



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

(11) BR 102014006322-6 B1



(22) Data do Depósito: 17/03/2014

(45) Data de Concessão: 26/05/2020

(54) **Título:** 4-AMINO-6-PICOLINATOS(HETEROCÍCLICOS) E 6-AMINO-2-PIRIMIDINA-(HETEROCÍCLICA)-4-CARBOXILATOS, E PROCESSO PARA CONTROLE DE VEGETAÇÃO INDESEJADA

(51) **Int.Cl.:** C07D 213/79; C07D 213/803.

(52) **CPC:** C07D 213/79; C07D 213/803.

(30) **Prioridade Unionista:** 15/03/2013 US 13/839,000.

(73) **Titular(es):** DOW AGROSCIENCES LLC.

(72) **Inventor(es):** JOSEPH D. ECKELBARGER; JEFFREY B. EPP; STEPHEN CRAIG FIELDS; LINDSEY G. FISCHER; NATALIE C. GIAMPIETRO; KATHERINE A. GUENTHENSBERGER.

(57) **Resumo:** Abstract 4-Amino-6-(heterocyclic)picolinic acids, 6-amino-2-(heterocyclic) pyrimidine-4-carboxylates, and derivatives thereof are provided. Also provided are herbicidal compositions including these compounds, as well as methods of using thereof as herbicides.

TRADUÇÃO DO RESUMO RESUMO Patente de Invenção: "4-AMINO-6-PICOLINATOS(HETEROCÍCLICOS) E 6-AMINO-2-PIRIMIDINA-(HETEROCÍCLICA)-4-CARBOXILATOS E SEU USO COMO HERBICIDAS" São fornecidos ácidos 4-amino-6-picolínicos (heterocíclicos), 4-carboxilatos de 6-amino-2-pirimidina (heterocíclica), e seus derivados. Também são fornecidas composições herbicidas compreendendo esses compostos, bem como os processos para uso das mesmas como herbicidas.

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**4-AMINO-6-PICOLINATOS(HETEROCÍCLICOS) E 6-AMINO-2-PIRIMIDINA-(HETEROCÍCLICA)-4-CARBOXILATOS, E PROCESSO PARA CONTROLE DE VEGETAÇÃO INDESEJADA**".

Referência Cruzada a Pedidos de Patente Relacionados

[001] Este pedido de patente reivindica o benefício do pedido de patente US 13/839,000, depositado em 15 de março de 2013, cuja divulgação é expressamente anexada aqui como referência.

Campo

[002] A invenção se refere a compostos e composições herbicidas e a métodos de controle de vegetação indesejável.

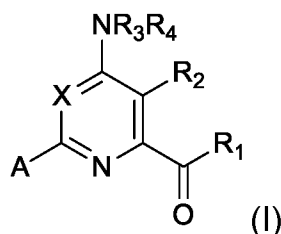
Antecedentes

[003] A ocorrência de vegetação indesejável, por exemplo, ervas daninhas, é um problema constante enfrentado por fazendeiros em lavouras, pastos e outros cenários. Ervas daninhas competem com lavouras e têm um impacto negativo no rendimento da lavoura. O uso de herbicidas químicos é uma ferramenta importante no controle da vegetação indesejada.

[004] Permanece uma necessidade de novos herbicidas químicos que oferecem um espectro mais amplo para o controle de ervas daninhas, seletividade, dano mínimo da safra, estabilidade ao armazenamento, facilidade de manuseio, maior atividade contra ervas daninhas, e/ou de um meio para tratar a tolerância a herbicidas que se desenvolve, no que se refere aos herbicidas atualmente em uso.

Sumário da Invenção

[005] São fornecidos aqui compostos da Fórmula (I)



(I)

[006] em que

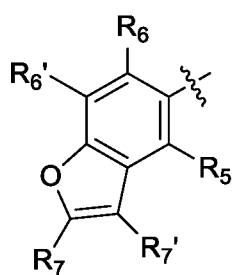
[007] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[008] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

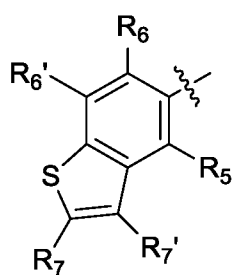
[009] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[0010] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi-carbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil sulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquil silila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com = C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

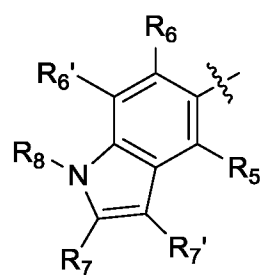
[0011] A é um dos grupos A1 até A36



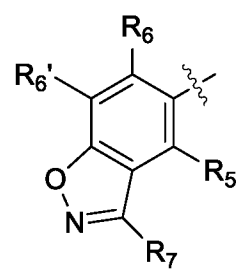
A1



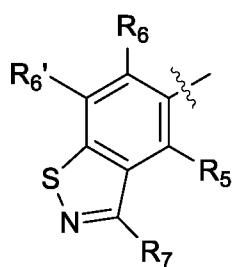
A2



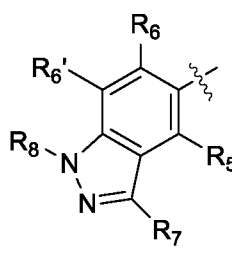
A3



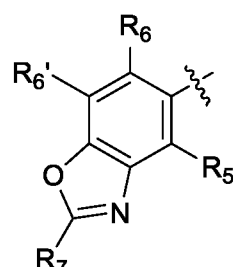
A4



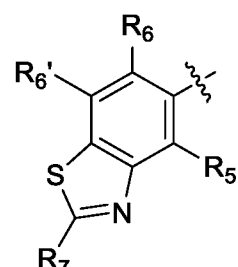
A5



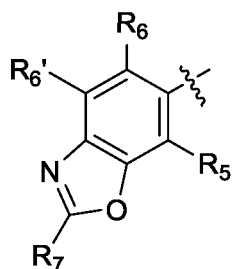
A6



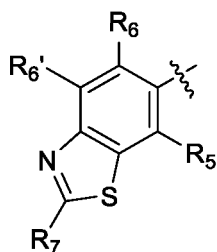
A7



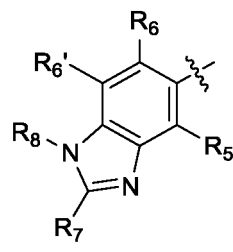
A8



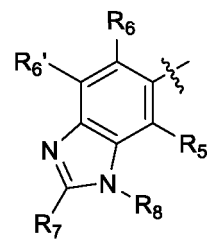
A9



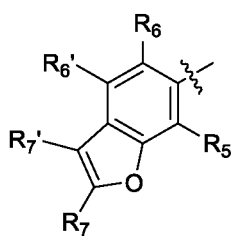
A10



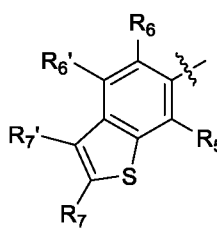
A11



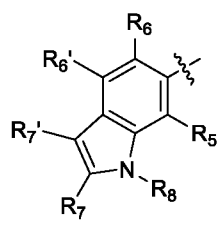
A12



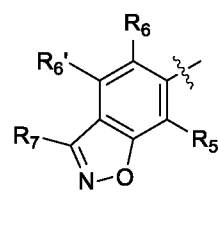
A13



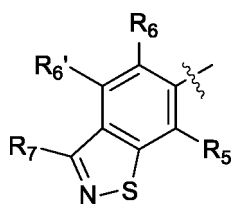
A14



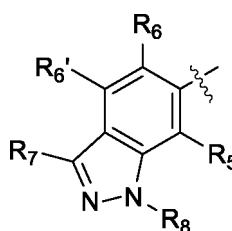
A15



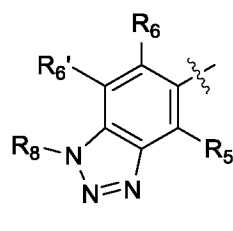
A16



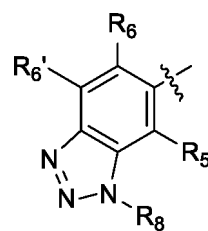
A17



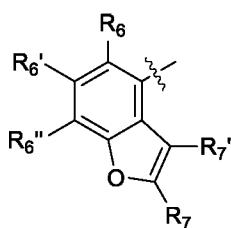
A18



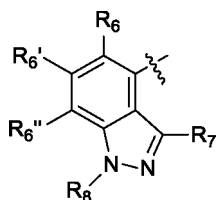
A19



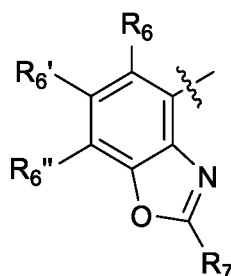
A20



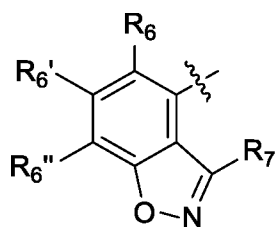
A21



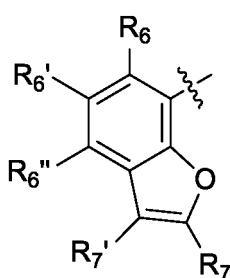
A25



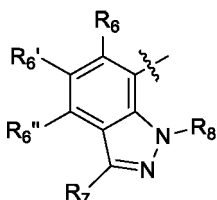
A29



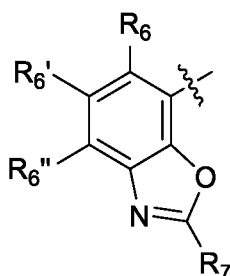
A33



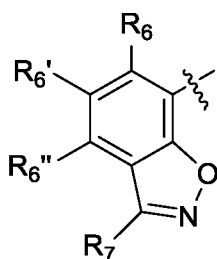
A22



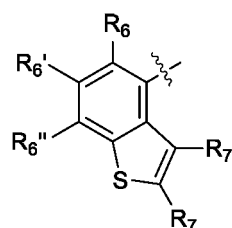
A26



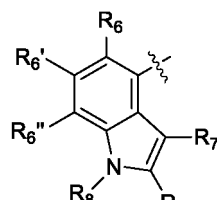
A30



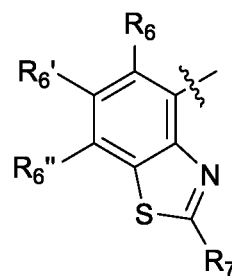
A34



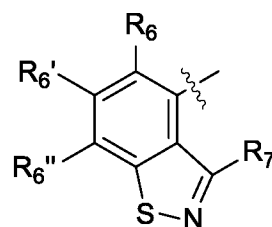
A23



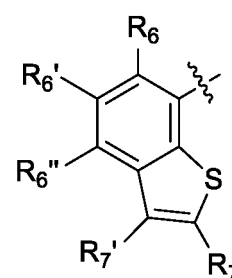
A27



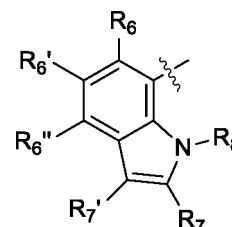
A31



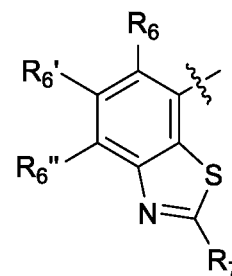
A35



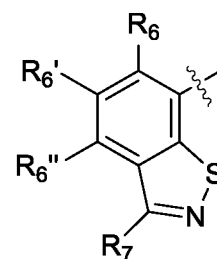
A24



A28



A32



A36

[0012]  $R^5$ , se aplicável ao grupo A, é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alqueni-la, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalqueni-la, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

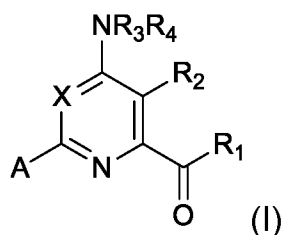
[0013]  $R^6$ ,  $R^{6'}$ , e  $R^{6''}$ , se aplicável ao grupo A, são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[0014]  $R^7$  e  $R^{7'}$  são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila;

[0015]  $R^8$  é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil sulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil silila, ou fenila;

[0016] ou um seu N-óxido ou seu sal agricolamente aceitável.

[0017] Em algumas modalidades, o composto é um composto da Fórmula (I):



[0018] em que

[0019] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[0020]  $R^1$  é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que  $R^{1'}$  é C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e  $R^{1''}$  e  $R^{1'''}$  são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[0021]  $R^2$  é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> al-

quenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[0022] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi-carbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil sulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquil silila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[0023] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[0024] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[0025] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

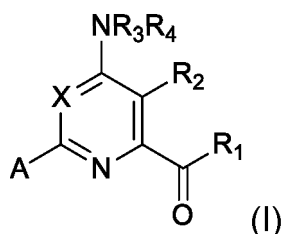
[0026] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-

C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquênila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquênila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila;

[0027] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquênila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquênila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbânila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil sulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquil silila, ou fenila;

[0028] ou um seu N-óxido ou um seu sal agricolamente aceitável,

[0029] com a condição de que o composto não seja um composto da Fórmula (I):



[0030] em que

[0031] X é N, CH, CF, CCl, ou CBr;

[0032] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila;

[0033] R<sup>2</sup> é cloro;

[0034] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio;

[0035] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, ou A20;

[0036] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, OH, amino, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilamino, ou ciclopropila;

[0037] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, OH, NH<sub>2</sub>, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, ciclopropila, ou vinila;

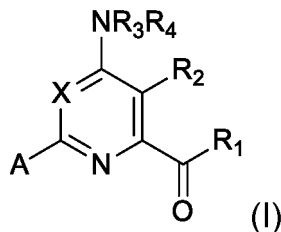
[0038] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ciclopropila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilamino, ou fenila; e

[0039] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, fenila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbo-

nila;

[0040] ou um seu N-óxido ou seu sal agricolamente aceitável.

[0041] Em algumas modalidades, o composto é um composto da Fórmula (I):



[0042] em que

[0043] X é CF;

[0044] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila;

[0045] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[0046] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil sulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquilsosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[0047] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[0048] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[0049] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[0050] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila;

[0051] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamil, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquil sulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquil silila, ou fenila;

[0052] ou um seu N-óxido ou um seu sal agricolamente aceitável.

[0053] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é Cl, metóxi, vinila, ou 1-propenila, e R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio. Em certas modalidades, R<sup>2</sup> é Cl, e R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio.

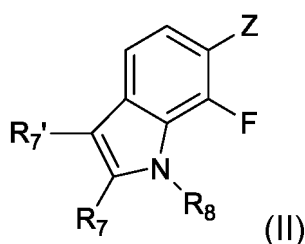
[0054] Em algumas modalidades, A é A15 e/ou R<sup>5</sup> é hidrogênio ou F.

[0055] Em uma modalidade, o composto é ácido 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il) picolínico. Em uma modalidade, o composto é flúor-flúor-4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il) pico-

linato de metila.

[0056] Também são fornecidos métodos para o controle da vegetação indesejada compreendendo (a) a contactação da vegetação indesejável ou área adjacente à vegetação indesejável ou (b) a contactação pre-emergentemente do solo ou água com uma quantidade com eficácia herbicida de pelo menos um composto da Fórmula (I) ou um seu derivado agricolamente aceitável.

[0057] Também são fornecidos novos precursores da Fórmula (II):



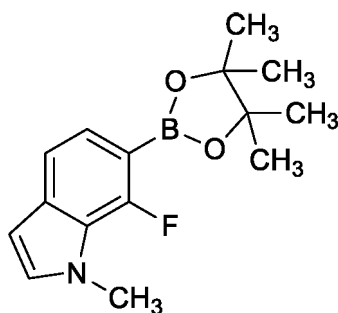
[0058] em que:

[0059]  $R^7$  e  $R^{7'}$  são independentemente hidrogênio, halogênio,  $C_1$ - $C_4$  alquila,  $C_1$ - $C_4$  haloalquila, ciclopropila, halociclopropila,  $C_2$ - $C_4$  alquenila,  $C_2$ - $C_4$  haloalquenila,  $C_2$ - $C_4$  alquinila,  $C_1$ - $C_3$  alcóxi,  $C_1$ - $C_3$  haloalcóxi,  $C_1$ - $C_3$  alquiltio,  $C_1$ - $C_3$  haloalquiltio, amino,  $C_1$ - $C_4$  alquilamino,  $C_2$ - $C_4$  haloalquilamino, ou fenila;

[0060]  $R^8$  é hidrogênio,  $C_1$ - $C_6$  alquila,  $C_1$ - $C_6$  haloalquila,  $C_3$ - $C_6$  alquenila,  $C_3$ - $C_6$  haloalquenila,  $C_3$ - $C_6$  alquinila, formila,  $C_1$ - $C_3$  alquilcarbonila,  $C_1$ - $C_3$  haloalquilcarbonila,  $C_1$ - $C_6$  alcóxicarbonila,  $C_1$ - $C_6$  alquilcarbamila,  $C_1$ - $C_6$  alquilsulfonila,  $C_1$ - $C_6$  trialquilsilila, ou fenila;

[0061] Z é  $B(OR^{22})_2$ ,  $BF_3M$ , ou  $Sn(R^{23})_3$ , sendo que cada  $R^{22}$  é independentemente hidrogênio ou  $C_1$ - $C_4$  alquila, ou as duas parcelas  $OR^{22}$  se combinam para formar

[0062]  $-O-C(CH_3)_2-C(CH_3)_2-O-$  ou  $-O-CH_2-C(CH_3)_2-CH_2-O-$ ; M é um cátion de metal, *p.ex.* sódio ou potássio, e  $R^{23}$  é  $C_1$ - $C_4$  alquila; com a condição de que o seguinte composto seja excluído:



### Descrição Detalhada

#### DEFINIÇÕES

[0063] Conforme empregado aqui, herbicida e ingrediente ativo herbicida significam um composto que controla a vegetação indesejável quanto aplicado em uma quantidade apropriada.

[0064] Conforme usado aqui, o controle de ou controlar a vegetação indesejada significa matar ou evitar a vegetação, ou causar algum efeito adversamente modificador para a vegetação, p. ex. desvios do crescimento ou desenvolvimento naturais, regulação, dessecação, retardo e semelhantes.

[0065] Conforme usado aqui, uma quantidade com eficácia herbicida ou que controla vegetação é uma quantidade do ingrediente ativo herbicida cuja aplicação controla a vegetação indesejável relevante.

[0066] Conforme usado aqui, aplicar um herbicida ou composição herbicida significa aplicá-la diretamente à vegetação alvo ou ao seu foco ou à área em que o controle de vegetação indesejada é desejado. Métodos de aplicação incluem mas não estão limitados à contactação pré-emergente do solo ou água, contactação pós-emergente da vegetação indesejável ou área adjacente à vegetação indesejável.

[0067] Conforme usado aqui, plantas e vegetação incluem, mas não estão limitadas a sementes dormentes, sementes germinantes, mudas emergentes, plantas que emergem de propágulos vegetativos, vegetação imatura e vegetação estabelecida.

[0068] Conforme usado aqui, sais e ésteres aceitáveis na agricul-

tura se referem a sais e ésteres que exibem atividade herbicida, ou que são ou podem ser convertidos no herbicida referenciado em plantas, água ou solo. Exemplos de ésteres que são aceitáveis na agricultura são aqueles que são ou podem ser hidrolisados, oxidados, metabolizados, ou de outra forma convertidos, p.ex. em plantas, água, ou solo, no ácido carboxílico correspondente, que, dependendo do pH, pode estar na forma dissociada ou não dissociada.

[0069] Sais apropriados incluem aqueles derivados de metais alcalinos ou alcalino terrosos e aqueles derivados de amônia e aminas. Cátions preferidos incluem sódio, potássio, magnésio, e cátions de aminínio da Fórmula:



[0070] em que  $R^{13}$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$  e  $R^{16}$  cada qual independentemente representa hidrogênio ou  $C_1$ - $C_{12}$  alquila,  $C_3$ - $C_{12}$  alquenila ou  $C_3$ - $C_{12}$  alquinila, cada um dos quais sendo opcionalmente substituído por um ou mais grupos hidróxi,  $C_1$ - $C_4$  alcóxi,  $C_1$ - $C_4$  alquiltio ou fenila, já que  $R^{13}$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$  e  $R^{16}$  sejam estericamente compatíveis. Além disso, quaisquer dois  $R^{13}$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$  e  $R^{16}$  juntos podem representar uma parcela alifática difuncional contendo um até doze átomos de carbono e até dois átomos de oxigênio ou enxôfre. Sais dos compostos da Fórmula I podem ser preparados por tratamento dos compostos de Fórmula I com um hidróxido metálico, tal como hidróxido de sódio com uma amina, tal como amônia, trimetilaminas, dietanolaminas, 2-metiltiopropilaminas, bisalilaminas, 2-butoxietilaminas, morfollinas, ciclododecilaminas, ou benzilaminas ou com um hidróxido de tetraalquilamônio, tal como hidróxido de tetrametilamônio ou hidróxido de colina. Sais de amina são frequentemente as formas preferidas dos compostos da Fórmula I porque eles são solúveis em água e prestam-se para a preparação das composições herbicidas à base de água desejáveis.

[0071] Compostos da Fórmula (I) incluem N-óxidos. N-óxidos de

piridina podem ser obtidos por oxidação das piridinas correspondentes. Métodos de oxidação apropriados são descritos, por exemplo, em Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie [Processos de Química Orgânica], volumes expandidos e subsequentes à 4ª edição, volume E 7b, págs. 565 em diante.

[0072] Conforme usado aqui, a menos que especificado de outro modo, acila se refere a formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila e C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> acila se refere a formila, C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> alquilcarbonila e C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> haloalquilcarbonila (o grupo contém um total de 1 até 6 átomos de carbono).

[0073] Conforme usado aqui, alquila se refere a parcelas de hidrocarboneto saturadas, de cadeia reta ou saturadas ramificadas. A menos que especificado de outro modo, são preferidos os grupos C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila. Exemplos incluem metila, etila, propila, 1-metil-etila, butila, 1-metil-propila, 2-metil-propila, 1,1-dimetil-etila, pentila, 1-metil-butila, 2-metil-butila, 3-metil-butila, 2,2-dimetil-propila, 1-etil-propila, hexila, 1,1-dimetil-propila, 1,2-dimetil-propila, 1-metil-pentila, 2-metil-pentila, 3-metil-pentila, 4-metil-pentila, 1,1-dimetil-butila, 1,2-dimetil-butila, 1,3-dimetil-butila, 2,2-dimetil-butila, 2,3-dimetil-butila, 3,3-dimetil-butila, 1-etil-butila, 2-etil-butila, 1,1,2-trimetil-propila, 1,2,2-trimetil-propila, 1-etil-1-metil-propila, e 1-etil-2-metil-propila.

[0074] Conforme empregado aqui, "haloalquila" se refere a grupos alquila de cadeia reta ou ramificada, sendo que nesses grupos os átomos de hidrogênio podem ser parcialmente ou totalmente substituídos por átomos de halogênio. A menos que especificado diferentemente, são pretendidos grupos C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>. Exemplos incluem clorometila, bromometila, diclorometila, triclorometila, fluormetila, difluormetila, trifluormetila, clorofluormetila, diclorofluormetila, clorodifluormetila, 1-cloroetila, 1-bromoetila, 1-fluoretila, 2-fluoretila, 2,2-difluoretila, 2,2,2-trifluoretila, 2-cloro-2-fluoretila, 2-cloro-2-difluoretila, 2,2-dicloro-2-

fluoretila, 2,2,2-tricloroetila, pentafluoretila, e 1,1,1-trifluorprop-2-ila.

[0075] Conforme empregado aqui, alquenila se refere a parcelas de hidrocarboneto insaturadas, de cadeia reta ou ramificadas, contendo uma dupla ligação. A menos que especificado de outra maneira, são pretendidos  $C_2$ - $C_8$  alquila. Grupos alquila podem conter mais do que uma ligação insaturada. Exemplos incluem etenila, 1-propenila, 2-propenila, 1-metiletênica, 1-butenila, 2-butenila, 3-butenila, 1-metil-1-propenila, 2-metil-1-propenila, 1-metil-2-propenila, 2-metil-2-propenila, 1-pentenila, 2-pentenila, 3-pentenila, 4-pentenila, 1-metil-1-butenila, 2-metil-1-butenila, 3-metil-1-butenila, 1-metil-2-butenila, 2-metil-2-butenila, 3-metil-2-butenila, 1-metil-3-butenila, 2-metil-3-butenila, 3-metil-3-butenila, 1,1-dimetil-2-propenila, 1,2-dimetil-1-propenila, 1,2-dimetil-2-propenila, 1-etil-1-propenila, 1-etil-2-propenila, 1-hexenila, 2-hexenila, 3-hexenila, 4-hexenila, 5-hexenila, 1-metil-1-pentenila, 2-metil-1-pentenila, 3-metil-1-pentenila, 4-metil-1-pentenila, 1-metil-2-pentenila, 2-metil-2-pentenila, 3-metil-2-pentenila, 4-metil-2-pentenila, 1-metil-3-pentenila, 2-metil-3-pentenila, 3-metil-3-pentenila, 4-metil-3-pentenila, 1-metil-4-pentenila, 2-metil-4-pentenila, 3-metil-4-pentenila, 4-metil-4-pentenila, 1,1-dimetil-2-butenila, 1,1-dimetil-3-butenila, 1,2-dimetil-1-butenila, 1,2-dimetil-2-butenila, 1,2-dimetil-3-butenila, 1,3-dimetil-1-butenila, 1,3-dimetil-2-butenila, 1,3-dimetil-3-butenila, 2,2-dimetil-3-butenila, 2,3-dimetil-1-butenila, 2,3-dimetil-2-butenila, 2,3-dimetil-3-butenila, 3,3-dimetil-1-butenila, 3,3-dimetil-2-butenila, 1-etil-1-butenila, 1-etil-2-butenila, 1-etil-3-butenila, 2-etil-1-butenila, 2-etil-2-butenila, 2-etil-3-butenila, 1,1,2-trimetil-2-propenila, 1-etil-1-metil-2-propenila, 1-etil-2-metil-1-propenila, e 1-etil-2-metil-2-propenila. Vinila se refere a um grupo contendo a estrutura  $-CH=CH_2$ ; 1-propenila se refere a um grupo com a estrutura  $-CH=CH-CH_3$ ; e 2-propenila se refere a um grupo com a estrutura  $-CH_2-CH=CH_2$ .

[0076] Conforme empregado aqui, alquinila representa parcelas

hidrocarboneto de cadeia reta ou ramificada contendo uma tripla ligação. A menos que especificado de outro modo, são pretendidos grupos  $C_2-C_8$  alquinila. Grupos alquinila podem conter mais do que uma ligação insaturada. Exemplos incluem  $C_2-C_6$ -alquinila, tal como etinila, 1-propinila, 2-propinila (ou propargila), 1-butinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-metil-2-propinila, 1-pentinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 4-pentinila, 3-metil-1-butinila, 1-metil-2-butinila, 1-metil-3-butinila, 2-metil-3-butinila, 1,1-dimetil-2-propinila, 1-etil-2-propinila, 1-hexinila, 2-hexinila, 3-hexinila, 4-hexinila, 5-hexinila, 3-metil-1-pentinila, 4-metil-1-pentinila, 1-metil-2-pentinila, 4-metil-2-pentinila, 1-metil-3-pentinila, 2-metil-3-pentinila, 1-metil-4-pentinila, 2-metil-4-pentinila, 3-metil-4-pentinila, 1,1-dimetil-2-butinila, 1,1-dimetil-3-butinila, 1,2-dimetil-3-butinila, 2,2-dimetil-3-butinila, 3,3-dimetil-1-butinila, 1-etil-2-butinila, 1-etil-3-butinila, 2-etil-3-butinila, e 1-etil-1-metil-2-propinila.

[0077] Conforme empregado aqui, alcóxi se refere a um grupo de Fórmula  $R-O-$ , em que R é alquila conforme definido acima. A menos que especificado de outro modo, são pretendidos grupos alcóxi em que R é um grupo  $C_1-C_8$  alquila. Exemplos incluem metóxi, etóxi, propóxi, 1-metil-etóxi, butóxi, 1-metil-propóxi, 2-metil-propóxi, 1,1-dimetil-etóxi, pentóxi, 1-metil-butóxi, 2-metil-butóxi, 3-metil-butóxi, 2,2-dimetil-propóxi, 1-etil-propóxi, hexóxi, 1,1-dimetil-propóxi, 1,2-dimetil-propóxi, 1-metil-pentóxi, 2-metil-pentóxi, 3-metil-pentóxi, 4-metil-pentóxi, 1,1-dimetil-butóxi, 1,2-dimetil-butóxi, 1,3-dimetil-butóxi, 2,2-dimetil-butóxi, 2,3-dimetil-butóxi, 3,3-dimetil-butóxi, 1-etil-butóxi, 2-etilbutóxi, 1,1,2-trimetil-propóxi, 1,2,2-trimetil-propóxi, 1-etil-1-metil-propóxi, e 1-etil-2-metil-propóxi.

[0078] Conforme empregado aqui, haloalcóxi se refere a um grupo de Fórmula  $R-O-$ , em que R é haloalquila conforme definido acima. A menos que especificado de outro modo, são pretendidos grupos haloalcóxi em que R é um grupo  $C_1-C_8$  alquila. Exemplos incluem clorome-

tóxi, bromometóxi, diclorometóxi, triclorometóxi, fluormetóxi, difluormetóxi, trifluormetóxi, clorofluormetóxi, diclorofluormetóxi, clorodifluormetóxi, 1-cloroetóxi, 1-bromoetóxi, 1-fluoretóxi, 2-fluoretóxi, 2,2-difluoretóxi, 2,2,2-trifluoretóxi, 2-cloro-2-fluoretóxi, 2-cloro, 2-difluoretóxi, 2,2-dicloro-2-fluoretóxi, 2,2,2-tricloroetóxi, pentafluoretóxi, e 1,1,1-trifluorprop-2-óxi.

[0079] Conforme empregado aqui, alquiltio se refere a um grupo de Fórmula R-S- em que R é alquila conforme definido acima. A menos que especificado de modo diferente, são preferidos grupos alquiltio em que R é um grupo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila. Exemplos incluem metiltio, etiltio, propiltio, 1-metiletiltio, butiltio, 1-metil-propiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetiletiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dio-metilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetil propiltio, 1,2-dimetil propiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metil-pentiltio, 4-metil-pentiltio, 1,1-dimetil butiltio, 1,2-dimetil-butiltio, 1,3-dimetil-butiltio, 2,2-dimetil butiltio, 2,3-dimetil butiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetil propiltio, 1,2,2-trimetil propiltio, 1-etil-1-metil propiltio, e 1-etil-2-metilpropiltio.

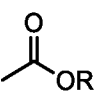
[0080] Conforme empregado aqui, haloalquiltio se refere a um grupo alquiltio conforme definido acima, sendo que os átomos de carbono são parcialmente ou totalmente substituídos por átomos de halogênio. A menos que especificado de modo diferente, são preferidos grupos haloalquiltio em que R é um grupo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila. Exemplos incluem clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluormetiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, clorofluormetiltio, diclorofluormetiltio, clorodifluormetiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoretiltio, 2-fluoretiltio, 2,2-difluoretiltio, 2,2,2-trifluoretiltio, 2-cloro-2-fluoretiltio, 2-cloro-2-difluoretiltio, 2,2-dicloro-2-fluoretiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoretiltio, e 1,1,1-trifluorprop-2-iltio.

[0081] Conforme empregado aqui, arila, bem como os termos deri-

vados tais como arilóxi, se refere a um grupo fenila, indanila ou naftila, sendo que fenila é preferida. O termo "heteroarila", bem como os termos derivados tais como "heteroarilóxi", se refere a um anel aromático com 5 ou 6 membros contendo um ou mais heteroátomos, a saber N, O ou S; esses anéis heteroaromáticos podem ser fundidos a outros sistemas aromáticos. Os substituintes arila ou heteroarila podem ser não substituídos ou substituídos por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, hidróxi, nitro, ciano, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> acila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoíla, hidroxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbonila, aminocarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilaminocarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquilaminocarbonila, contanto que os substituintes sejam estericamente compatíveis e as regras de ligação química e energia de deformação sejam satisfeitas. Substituintes preferidos incluem halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> alquila e C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> haloalquila.

[0082] Conforme empregado aqui, alquilcarbonila se refere a um grupo alquila ligado a um grupo carbonila. C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila e C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila se refere a grupos em que um grupo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila está ligado a um grupo carbonila (o grupo contem um total de 2 a 4 átomos de carbono).

[0083] Conforme empregado aqui, alcoxicarbonila se refere a um

grupo de Fórmula  em que R é alquila.

[0084] Conforme empregado aqui, arilalquila se refere a um grupo alquila substituído por um grupo arila. C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila se refere a um grupo em que o número total de átomos de carbono no grupo é de 7 a 10.

[0085] Conforme empregado aqui, alquilamino se refere a um grupo amino substituído por um ou dois grupos alquila, que podem ser os

mesmos ou diferentes.

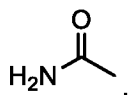
[0086] Conforme empregado aqui, haloalquilamino se refere a um grupo alquilamino em que os átomos de carbono da alquila são parcialmente ou totalmente substituídos por átomos de halogênio.

[0087] Conforme empregado aqui, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilaminocarbonila se refere a um grupo de Fórmula RNHC(O)- em que R é C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, e C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquilaminocarbonila se refere a um grupo de Fórmula R<sub>2</sub>NC(O)- sendo que cada R é independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila.

[0088] Conforme empregado aqui alquilcarbamila se refere a um grupo carbamil substituído no nitrogênio por um grupo alquila.

[0089] Conforme empregado aqui alquilsulfonila se refere a um grupo da Fórmula  $\text{—}\overset{\text{O}}{\underset{\text{O}}{\text{S}}}\text{—R}$ , em que R é alquila.

[0090] Conforme empregado aqui, carbamila (também referida como carbamoíla e aminocarbonila) se refere a um grupo de Fórmula



[0091] Conforme empregado aqui, dialquifosfonila se refere a um grupo da Fórmula  $\text{—}\overset{\text{O}}{\underset{\text{OR}}{\text{P}}}\text{—OR}$  em que R é alquila independentemente em cada ocorrência.

[0092] Conforme empregado aqui, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila se refere a um grupo de Fórmula —SiR<sub>3</sub> em que cada R é independentemente um grupo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila (o grupo contem um total de 3 até 18 átomos de carbono).

[0093] Conforme empregado aqui, Me se refere a um grupo metila; OMe se refere a um grupo metóxi; *i*-Pr se refere a um grupo isopropila.

[0094] Conforme empregado aqui, o termo “halogênio”, incluindo termos derivados tais como “halo”, se refere a flúor, cloro, bromo e iodo.

[0095] Conforme empregado aqui, plantas e vegetação incluem, mas não estão limitadas a sementes germinativas, mudas emergentes, plantas que emergem de propágulos vegetativos, vegetação imatura, e vegetação estabelecida.

#### COMPOSTOS DA FÓRMULA (I)

[0096] A invenção fornece compostos da Fórmula (I) conforme definido acima e N-óxidos e seus sais aceitáveis na agricultura.

[0097] Em algumas modalidades, o composto é o ácido carboxílico ou um éster ou sal agricolamente aceitável. Em algumas modalidades, o composto é o ácido carboxílico ou seu metil éster.

[0098] Em algumas modalidades:

[0031] A é um dos grupos A1 até A20;

R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila;

R<sup>2</sup> é cloro;

R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio;

X é N, CH, CF, CCl, ou CBr;

R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, OH, NH<sub>2</sub>, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilamino, ou ciclopropila;

R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, OH, NH<sub>2</sub>, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, ciclopropila, ou vinila;

R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ciclopropila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilamino, ou fenila; e

R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, fenila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbônica.

[0099] Em algumas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila. Em algumas modalidades, R<sup>1'</sup> é hidrogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila. Em algumas modalidades, R<sup>1'</sup> é hidrogênio.

[00100] Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcóxi, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcóxi. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é halogênio. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alquenila ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é Cl, OMe, vinila, ou 1-propenila. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é Cl. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é OMe. Em algumas modalidades, R<sup>2</sup> é vinila ou 1-propenila.

[00101] Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), sendo que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi, ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino. Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), sendo que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino. Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila. Em algumas modalidades, pelo menos um dos R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> é hidrogênio. Em algumas modalidades, R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são ambos hidrogênio.

[00102] Em algumas modalidades, X é N, CH ou CF. Em algumas modalidades, X é N. Em algumas modalidades, X é CH. Em algumas modalidades, X é CF.

[00103] Em algumas modalidades, A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, ou A20.

[00104] Em algumas modalidades, A é um dos A21, A22, A23, A24,

A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, e A36.

[00105] Em algumas modalidades, A é um dos grupos A1, A2, A3, A7, A8, A9, A10, A13, A14, e A15. Em algumas modalidades, A é um dos grupos A1, A2, A3, A13, A14, e A15. Em algumas modalidades, A é um dos grupos A13, A14, e A15. Em algumas modalidades, A é A15.

[00106] Em algumas modalidades, R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, ou amino. Em algumas modalidades, R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, ou amino. Em algumas modalidades, R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi. Em algumas modalidades, R<sup>5</sup> é hidrogênio ou F. Em algumas modalidades, R<sup>5</sup> é hidrogênio.

[00107] Em outras modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[00108] Em algumas modalidades, R<sup>6</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi. Em algumas modalidades, R<sup>6</sup> é hidrogênio ou flúor. Em algumas modalidades, R<sup>6</sup> é hidrogênio. Em algumas modalidades, R<sup>6</sup> é flúor.

[00109] Em algumas modalidades, R<sup>6'</sup> é hidrogênio ou halogênio. Em algumas modalidades, R<sup>6'</sup> é hidrogênio, F, ou Cl. Em algumas modalidades, R<sup>6'</sup> é hidrogênio ou F. Em algumas modalidades, R<sup>6'</sup> é hidrogênio.

[00110] Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, CN, ou NO<sub>2</sub>. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é hidrogênio. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é halogênio. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é ciclopropila. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é CN. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é NO<sub>2</sub>.

[00111] Em algumas modalidades:

[0032]  $R^2$  é halogênio,  $C_2$ - $C_4$ -alquenila,  $C_2$ - $C_4$  haloalqueni-  
la, ou  $C_1$ - $C_4$ -alcóxi;

$R^3$  e  $R^4$  são ambos hidrogênio; e

X é N, CH, ou CF.

[00112] Em algumas modalidades:

$R^2$  é halogênio;

$R^3$  e  $R^4$  são ambos hidrogênio; e

X é N, CH, ou CF.

[00113] Em algumas modalidades:

$R^2$  é  $C_2$ - $C_4$ -alquenila ou  $C_2$ - $C_4$  haloalqueni-  
la;

$R^3$  e  $R^4$  são ambos hidrogênio; e

X é N, CH, ou CF.

[00114] Em algumas modalidades:

$R^2$  é  $C_1$ - $C_4$ -alcóxi;

$R^3$  e  $R^4$  são ambos hidrogênio; e

X é N, CH, ou CF.

[00115] Em algumas modalidades:

$R^2$  é halogênio,  $C_2$ - $C_4$ -alquenila,  $C_2$ - $C_4$  haloalqueni-  
la, ou  $C_1$ -  
 $C_4$ -alcóxi;

$R^3$  e  $R^4$  são ambos hidrogênio;

X é N, CH, ou CF;

$R^5$  é hidrogênio ou F;

$R^6$  é hidrogênio ou F;

$R^{6'}$  é hidrogênio;

$R^{6''}$ , se aplicável ao relevante grupo A, é hidrogênio ou ha-  
logênio; e

$R^7$  e  $R^{7'}$ , se aplicável ao relevante grupo A, são indepen-  
dentemente hidrogênio ou halogênio.

[00116] Em algumas modalidades:

$R^2$  é halogênio,  $C_1$ - $C_4$ -alcóxi, ou  $C_2$ - $C_4$ -alquenila;

- $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;  
X é N, CH, ou CF; e  
[0033] A é um dos grupos de A1 até A20;
- [00117] Em algumas modalidades:  
 $R^2$  é cloro;  
 $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;  
X é N, CH, ou CF;  
A é um dos grupos de A1 até A20;  
 $R^5$  é hidrogênio ou F;  
 $R^6$  e  $R^6'$  são independentemente hidrogênio ou F; e  
 $R^7$  e  $R^7'$ , se aplicáveis ao grupo A relevante, são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila.
- [00118] Em algumas modalidades:  
 $R^2$  é cloro, metóxi, vinila, ou 1-propenila;  
 $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e  
X é N, CH, ou CF.
- [00119] Em algumas modalidades:  
 $R^2$  é cloro;  
 $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e  
X é N, CH, ou CF.
- [00120] Em algumas modalidades:  
 $R^2$  é vinila ou 1-propenila;  
 $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e  
X é N, CH, ou CF.
- [00121] Em algumas modalidades:  
 $R^2$  é metóxi;  
 $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e  
X é N, CH, ou CF.
- [00122] Em algumas modalidades:  
 $R^2$  é cloro;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e

X é N.

[00123] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e

X é CH.

[00124] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio; e

X é CF.

[00125] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;

X é CF;

A é um dos A1, A2, A3, A7, A8, A9, A10, A13, A14, ou A15;

$R^5$  é F; e

$R^6$  é H.

[00126] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro, metóxi, vinila, ou 1-propenila;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;

X é N, CH, ou CF; e

A é um dos A21-A36.

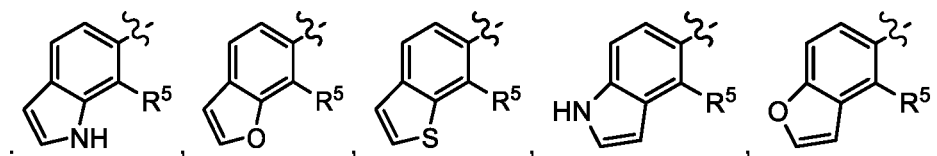
[00127] Em algumas modalidades:

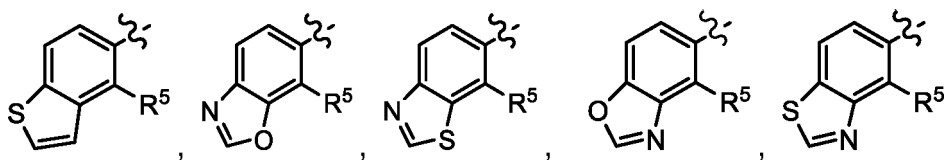
$R^2$  é cloro, metóxi, vinila, ou 1-propenila;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;

X é CF; e

A é um dos





[00128] em que

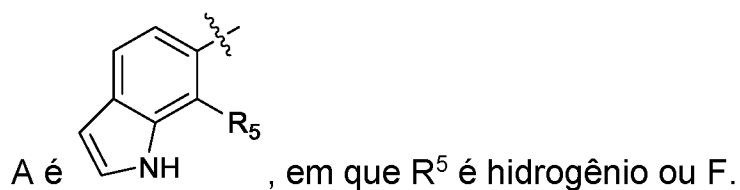
$R^5$  é hidrogênio ou F.

[00129] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro, metóxi, vinila, ou 1-propenila;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;

X é N, CH, ou CF; e

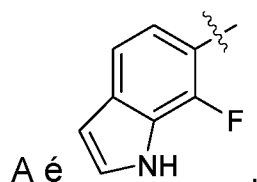


[00130] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro, metóxi, vinila, ou 1-propenila;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;

X é N, CH, ou CF; e

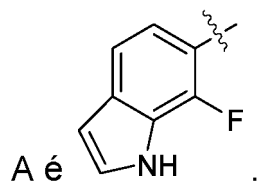


[00131] Em algumas modalidades:

$R^2$  é cloro, metóxi, vinila, ou 1-propenila;

$R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio;

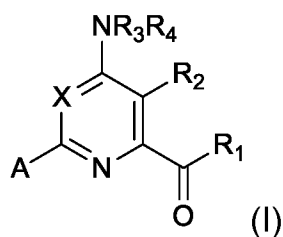
X é CF; e



[00132] É particularmente notável que compostos da Fórmula (I), em que A é *p.ex.* A15, exibem um aumento significativo da atividade quando X é CF. Isto é demonstrado por comparação da atividade dos

compostos 1.21 e 1.22 (em que X é CH) com aquela de 1.08 e 1.09 (em que X é CF). Também é demonstrado por comparação da atividade dos compostos 1.23 e 1.24 (em que X é CH) com aquela dos compostos 1.15 e 1.16 (em que X é CF). O aumento da atividade é ainda aumentada quando R<sup>5</sup> é F.

[00133] Em algumas modalidades, o composto é um composto da Fórmula (I):



em que

[00134] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00135] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00136] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo de Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00137] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsili-

la, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquilfosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), sendo que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00138] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00139] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

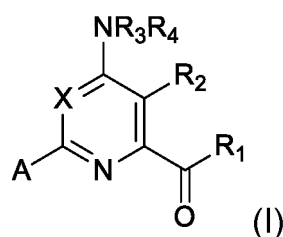
[00140] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00141] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00142] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila;

[00143] ou um seu N-óxido ou seu sal agricolamente aceitável,

[00144] com a condição de que o composto não seja um composto da Fórmula (I):



- [00145] em que
- [00146] X é N, CH, CF, CCl, ou CBr;
- [00147] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila;
- [00148] R<sup>2</sup> é cloro;
- [00149] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio;
- [00150] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, ou A20;
- [00151] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, OH, amino, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilamino, ou ciclopropila;
- [00152] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, OH, NH<sub>2</sub>, CN, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, ciclopropila, ou vinila;
- [00153] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ciclopropila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilamino, ou fenila; e
- [00154] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, fenila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbônica;
- [00155] ou um seu N-óxido ou um seu sal agricolamente aceitável.
- [00156] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.
- [00157] Em algumas modalidades:
- [00158] X é CY, em que Y é C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;
- [00159] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio,

C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00160] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00161] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquiltiofosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00162] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00163] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00164] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino

ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00165] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00166] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila.

[00167] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[00168] Em algumas modalidades:

[00169] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00170] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é C<sub>5</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00171] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00172] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi-

carbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00173] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00174] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00175] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00176] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila;

[00177] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila;

[00178] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é

A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0034] Em algumas modalidades:

[00179] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00180] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00181] R<sup>2</sup> é F, Br, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo de Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00182] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquilsulfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00183] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00184] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila,

ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00185] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00186] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00187] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsilila, ou fenila.

[00188] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0035] Em algumas modalidades:

[00189] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00190] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00191] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-

C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00192] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00193] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00194] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00195] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00196] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> halo-

alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00197] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila.

[00198] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0036] Em algumas modalidades:

[00199] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00200] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00201] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00202] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam

=CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00203] A é A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00204] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00205] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00206] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00207] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila.

[00208] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0037] Em algumas modalidades:

[00209] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00210]  $R^1$  é  $OR^{1'}$  ou  $NR^{1''}R^{1'''}$ , em que  $R^{1'}$  é hidrogênio,  $C_1-C_8$  alquila, ou  $C_7-C_{10}$  arilalquila, e  $R^{1''}$  e  $R^{1'''}$  são independentemente hidrogênio,  $C_1-C_{12}$  alquila,  $C_3-C_{12}$  alquenila, ou  $C_3-C_{12}$  alquinila;

[00211]  $R^2$  é halogênio,  $C_1-C_4$  alquila,  $C_1-C_4$  haloalquila,  $C_2-C_4$  alquenila,  $C_2-C_4$  haloalquenila,  $C_2-C_4$  alquinila,  $C_1-C_4$  alcóxi,  $C_1-C_4$  haloalcóxi,  $C_1-C_4$  alquiltio,  $C_1-C_4$  haloalquiltio, amino,  $C_1-C_4$  alquilamino,  $C_2-C_4$  haloalquilamino, formila,  $C_1-C_3$  alquilcarbonila,  $C_1-C_3$  haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo de Fórmula  $-CR^{17}=CR^{18}-SiR^{19}R^{20}R^{21}$ , em que  $R^{17}$  é hidrogênio, F, ou Cl;  $R^{18}$  é hidrogênio, F, Cl,  $C_1-C_4$  alquila, ou  $C_1-C_4$  haloalquila; e  $R^{19}$ ,  $R^{20}$ , e  $R^{21}$  são independentemente  $C_1-C_{10}$  alquila,  $C_3-C_6$  cicloalquila, fenila, fenila substituída,  $C_1-C_{10}$  alcóxi, ou OH;

[00212]  $R^3$  e  $R^4$  são independentemente hidrogênio,  $C_1-C_6$  alquila,  $C_1-C_6$  haloalquila,  $C_3-C_6$  alquenila,  $C_3-C_6$  haloalquenila,  $C_3-C_6$  alquinila, formila,  $C_1-C_3$  alquilcarbonila,  $C_1-C_3$  haloalquilcarbonila,  $C_1-C_6$  alcoxicarbonila,  $C_1-C_6$  alquilcarbamila,  $C_1-C_6$  alquilsulfonila,  $C_1-C_6$  trialquilsilila,  $C_1-C_6$  dialquifosfonila, ou  $R^3$  e  $R^4$  juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6, ou  $R^3$  e  $R^4$  juntos representam  $=CR^{3'}(R^{4'})$ , em que  $R^{3'}$  e  $R^{4'}$  são independentemente hidrogênio,  $C_1-C_6$  alquila,  $C_3-C_6$  alquenila,  $C_3-C_6$  alquinila,  $C_1-C_6$  alcóxi ou  $C_1-C_6$  alquilamino, ou,  $R^{3'}$  e  $R^{4'}$  juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00213] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, ou A20;

[00214]  $R^5$  é  $C_4$  alquila,  $C_1-C_4$  haloalquila, halociclopropila,  $C_2-C_4$  alquenila,  $C_2-C_4$  haloalquenila,  $C_2-C_4$  alquinila,  $C_1-C_3$  haloalcóxi,  $C_1-C_3$  alquiltio,  $C_1-C_3$  haloalquiltio,  $C_4$  alquilamino, ou  $C_2-C_4$  haloalquilamino;

[00215]  $R^6$ ,  $R^{6'}$ , e  $R^{6''}$  são independentemente hidrogênio, halogênio,  $C_1-C_4$  alquila,  $C_1-C_4$  haloalquila, ciclopropila, halociclopropila,  $C_2-C_4$  alquenila,  $C_2-C_4$  haloalquenila,  $C_2-C_4$  alquinila,  $C_1-C_3$  alcóxi,  $C_1-C_3$  haloalcóxi,  $C_1-C_3$  alquiltio,  $C_1-C_3$  haloalquiltio, amino,  $C_1-C_4$  alquilamino

ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00216] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00217] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila.

[00218] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0038] Em algumas modalidades:

[00219] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00220] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00221] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00222] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila,

formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00223] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, ou A20;

[00224] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00225] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, halociclopropila, C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou NO<sub>2</sub>;

[00226] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00227] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila.

[00228] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0039] Em algumas modalidades:

[00229] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00230] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00231] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00232] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi-carbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00233] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, ou A18;

[00234] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> halo-

alquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;  
 [00235] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00236] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>4</sub> alquilamino, ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino; e

[00237] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila

[00238] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[0040] Em algumas modalidades:

[00239] X é N ou CY, em que Y é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio;

[00240] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup> ou NR<sup>1''</sup>R<sup>1'''</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila, e R<sup>1''</sup> e R<sup>1'''</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquenila, ou C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> alquinila;

[00241] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;  
[00242] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00243] A é A3, A6, A11, A12, A15, A18, A19, ou A20;

[00244] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00245] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

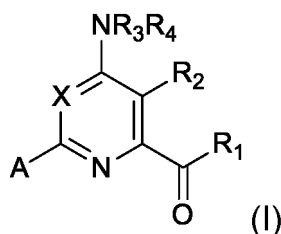
[00246] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00247] R<sup>8</sup> é C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>

trialquilsilila.

[00248] Em algumas dessas modalidades, R<sup>1</sup> é OR<sup>1</sup>. Em algumas dessas modalidades, X é CF. Em algumas dessas modalidades, A é A15. Em algumas dessas modalidades, R<sup>5</sup> é F.

[00249] Em algumas modalidades, o composto é um composto da Fórmula (I):



[00250] em que

[00251] X é CF;

[00252] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila;

[00253] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ciano, ou um grupo da Fórmula -CR<sup>17</sup>=CR<sup>18</sup>-SiR<sup>19</sup>R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>, em que R<sup>17</sup> é hidrogênio, F, ou Cl; R<sup>18</sup> é hidrogênio, F, Cl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila; e R<sup>19</sup>, R<sup>20</sup>, e R<sup>21</sup> são independentemente C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cicloalquila, fenila, fenila substituída, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> alcóxi, ou OH;

[00254] R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxicarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> dialquifosfonila, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos com N representam um anel saturado com 5 ou 6 membros, ou R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila-

mino, ou, R<sup>3'</sup> e R<sup>4'</sup> juntos com =C representam um anel saturado com 5 ou 6 membros;

[00255] A é A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A16, A17, A18, A19, A20, A21, A22, A23, A24, A25, A26, A27, A28, A29, A30, A31, A32, A33, A34, A35, ou A36;

[00256] R<sup>5</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, ou CN;

[00257] R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, OH, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00258] R<sup>7</sup> e R<sup>7'</sup> são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino, ou fenila; e

[00259] R<sup>8</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxycarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilsulfonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> trialquilsilila, ou fenila;

[00260] ou um seu N-óxido ou seu sal agricolamente aceitável.

Em algumas modalidades:

[00261] R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, em que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila, ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila;

[00262] R<sup>2</sup> é halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquiltio, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquiltio.

[00263]  $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, ou  $R^3$  e  $R^4$  juntos representam =CR<sup>3'</sup>(R<sup>4'</sup>), em que  $R^{3'}$  e  $R^{4'}$  são independentemente hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxi ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilamino;

[00264] A é A1, A2, A3, A7, A8, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15, A21, A22, A23, A24, A27, A28, A29, A30, A31, ou A32;

[00265]  $R^5$  é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquiltio, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino, ou C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquilamino;

[00266]  $R^6$ ,  $R^{6'}$ , e  $R^{6''}$  são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, halociclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, CN, ou NO<sub>2</sub>;

[00267]  $R^7$  e  $R^{7'}$  são independentemente hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalcóxi, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquiltio, ciclopropila, amino ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilamino; e

[00268]  $R^8$  é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> alquenila, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> haloalquenila, formila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> alquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> haloalquilcarbonila, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcóxicarbonila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilcarbamila.

[00269] Em algumas modalidades,  $R^2$  é halogênio, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-alquenila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> haloalquenila, ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alcóxi. Em certos modalidades,  $R^2$  é Cl, metóxi, vinila, ou 1-propenila. Em algumas modalidades,  $R^3$  e  $R^4$  são hidrogênio.

[00270] Em algumas modalidades, A é A1, A2, A3, A7, A8, A9, A10, A13, A14, ou A15. Em certos modalidades, A é A1, A2, A3, A13, A14, ou A15. Em certos modalidades, A é A15.

[00271] Em algumas modalidades,  $R^5$  é hidrogênio ou F. Em certos

modalidades, R<sup>5</sup> é F. Em certas modalidades, R<sup>5</sup> é H.

Em algumas modalidades, R<sup>6</sup> é hidrogênio ou F. Em certas modalidades, R<sup>6</sup> é F. Em certas modalidades, R<sup>6</sup> é H. Em algumas modalidades, R<sup>6''</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, CN, ou NO<sub>2</sub>. Em certas modalidades, R<sup>6</sup>, R<sup>6'</sup>, e R<sup>6''</sup> são todos hidrogênio.

[00272] Em certas modalidades:

R<sup>2</sup> é Cl, metóxi, vinila, ou 1-propenila;

R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio;

A é A15;

R<sup>5</sup> é hidrogênio ou F; e

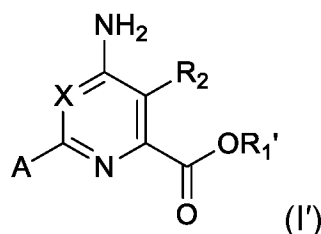
R<sup>6</sup> é hidrogênio ou F; e

R<sup>6''</sup> é hidrogênio, halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquila, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> haloalquila, ciclopropila, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> alquinila, C<sup>N</sup>, ou N<sup>O2</sup>.

[00273] Em uma modalidade, o composto é ácido 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il) picolínico. Em uma modalidade, o composto é flúor-flúor-4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il) picolinato de metila.

### EXEMPLOS DE COMPOSTOS

[00274] As seguintes tabelas 1-9 descrevem exemplos de compostos de Fórmula (I')



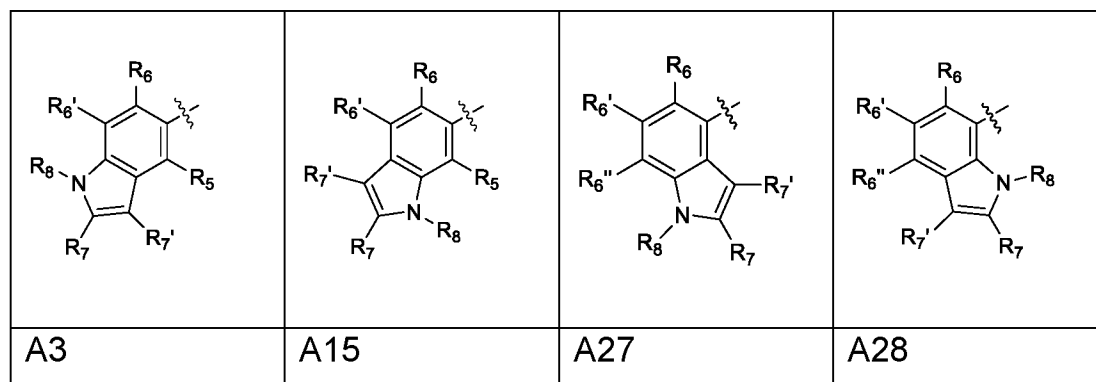
[00275] A Tabela 10 estabelece a estrutura, aparência, método de preparação, e o(s) precursor(es) empregado(s) na síntese dos compostos dos exemplos. A Tabela 11 estabelece os dados físicos para cada um dos compostos dos exemplos.

[00276] Espaços em branco nas tabelas dos compostos indicam

hidrogênio, ou estabelecem que para o grupo A indicado em uma linha particular, a coluna em que o espaço ocorre não é relevante.

**Tabela 1:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de indolila

[00277] A é A3, A15, A27, ou A28:

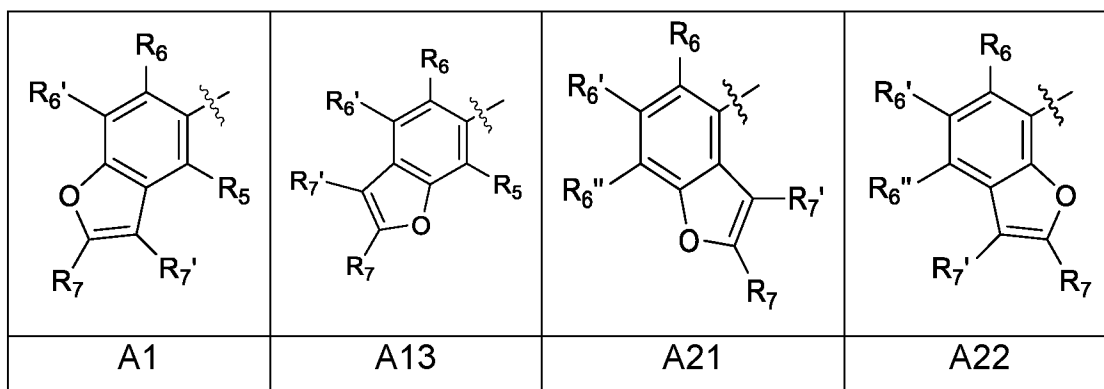


C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
1.01	H	Cl	CF	A3							Me
1.02	Me	Cl	CF	A3							
1.03	Me	Cl	CF	A3							Me
1.04	H	Cl	CF	A3							
1.05	Me	Cl	CCl	A15							
1.06	H	Cl	CCl	A15							
1.07	Me	Cl	CCl	A15	F						
1.08	Me	Cl	CF	A15							
1.09	H	Cl	CF	A15							
1.10	Me	Cl	CF	A15							Me
1.11	H	Cl	CF	A15							Me
1.12	Me	Cl	CF	A15	F						Si(i-Pr) <sub>3</sub>
1.13	Me	Cl	CF	A15		F					
1.14	H	Cl	CF	A15		F					
1.15	Me	Cl	CF	A15	F						
1.16	H	Cl	CF	A15	F						
1.17	H	OMe	CF	A15	F						
1.18	Me	vinila	CF	A15	F						
1.19	H	vinila	CF	A15	F						
1.20	Me	OMe	CF	A15	F						
1.21	Me	Cl	CH	A15							
1.22	H	Cl	CH	A15							

C.Nº	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
1.23	Me	Cl	CH	A15	F						
1.24	H	Cl	CH	A15	F						
1.25	Me	Cl	CH	A15		F					
1.26	H	Cl	CH	A15		F					
1.27	Me	Cl	CH	A15	F	F					
1.28	Me	Cl	CMe	A15							
1.29	H	Cl	CMe	A15							
1.30	Me	Cl	N	A15							
1.31	Me	Cl	N	A15	F						
1.32	Me	OMe	N	A15							
1.33	H	OMe	N	A15							
1.34	Me	OMe	N	A15	F						
1.35	H	OMe	N	A15	F						
1.36	Me	OMe	N	A15		F					
1.37	H	OMe	N	A15		F					
1.38	Me	vinila	N	A15	F						
1.39	H	vinila	N	A15	F						
1.40	Me	Cl	CF	A27							
1.41	Me	Cl	CF	A27							Me
1.42	H	Cl	CF	A27							Me
1.43	Me	Cl	CF	A27				Cl			
1.44	Me	Cl	CH	A27				Cl			
1.45	Me	OMe	N	A27				Cl			
1.46	Me	Cl	CF	A28				Cl			
1.47	Me	Cl	CF	A28							
1.48	H	Cl	CF	A28							
1.49	Me	Cl	CH	A28				Cl			
1.50	Me	OMe	N	A28				Cl			

**Tabela 2:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de benzofuranila

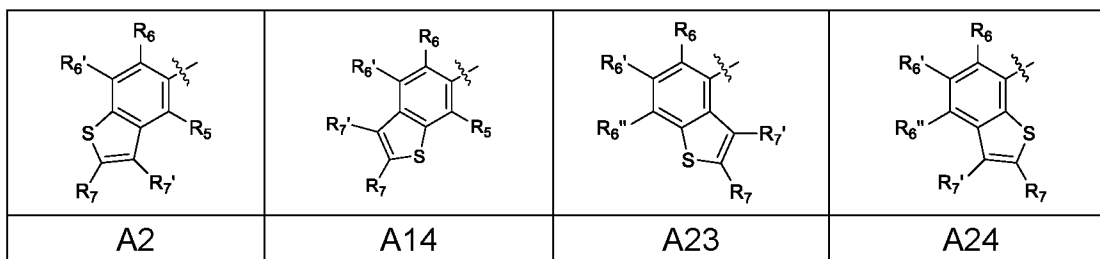
[00278] A é A1, A13, A21, ou A22:



C.Nº.	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
2.01	Me	Cl	CF	A1							
2.02	H	Cl	CF	A1							
2.03	Me	Cl	CH	A1							
2.04	Me	Cl	CH	A1		F					
2.05	Me	OMe	N	A1		F					
2.06	Me	OMe	N	A1							
2.07	Me	Cl	CF	A13							
2.08	H	Cl	CF	A13							
2.09	Me	Cl	CF	A13	F						
2.10	Me	Cl	CF	A13		F					
2.11	Me	Cl	CH	A13	F						
2.12	Me	Cl	CH	A13		F					
2.13	Me	OMe	N	A13	F						
2.14	Me	OMe	N	A13		F					
2.15	Me	Cl	CF	A21							
2.16	Me	Cl	CF	A21				Cl			
2.17	H	Cl	CF	A21							
2.18	H	Cl	CF	A21				Cl			
2.19	Me	Cl	CH	A21				Cl			
2.20	Me	Cl	N	A21				Cl			
2.21	Me	OMe	N	A21				Cl			
2.22	H	OMe	N	A21				Cl			
2.23	H	Cl	N	A21				Cl			
2.24	Me	Cl	CF	A22				Cl			
2.25	Me	Cl	CH	A22				Cl			

C.Nº.	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
2.26	Me	OMe	N	A22				Cl			

**Tabela 3: Compostos da Fórmula (I') com caudas de benzotiofuranila [00279] A é A2, A14, A23, ou A24:**

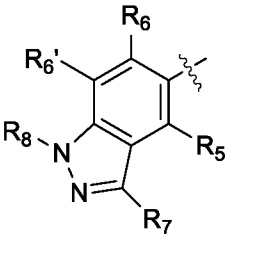
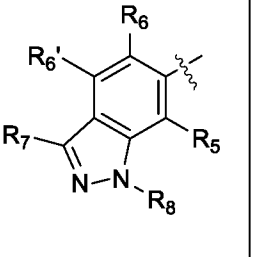
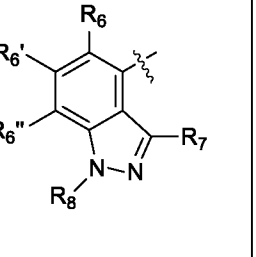
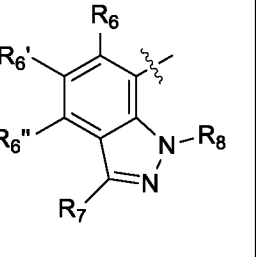


C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
3.01	Me	Cl	CCl	A2							
3.02	H	Cl	CCl	A2							
3.03	Me	Cl	CF	A2							
3.04	H	Cl	CF	A2							
3.05	Me	Cl	CH	A2							
3.06	Me	Cl	CMe	A2							
3.07	H	Cl	CMe	A2							
3.08	Me	OMe	N	A2							
3.09	H	OMe	N	A2							
3.10	Me	Cl	CCl	A14							
3.11	H	Cl	CCl	A14							
3.12	Me	Cl	CF	A14							
3.13	H	Cl	CF	A14							
3.14	Me	Cl	CF	A14		F					
3.15	Me	Cl	CH	A14							
3.16	H	Cl	CH	A14							
3.17	Me	Cl	CH	A14		F					
3.18	Me	Cl	CMe	A14							
3.19	H	Cl	CMe	A14							
3.20	Me	OMe	N	A14							
3.21	H	OMe	N	A14							
3.22	Me	OMe	N	A14		F					
3.23	Me	Cl	CF	A23							

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
3.24	Me	Cl	CF	A24							
3.25	H	Cl	CF	A24							
3.26	Me	Cl	CF	A24						Br	
3.27	Me	Cl	CH	A24							

**Tabela 4:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de 1H-indazolila

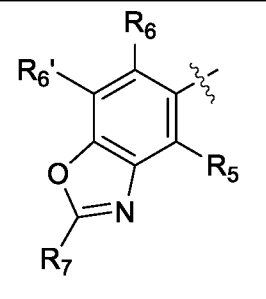
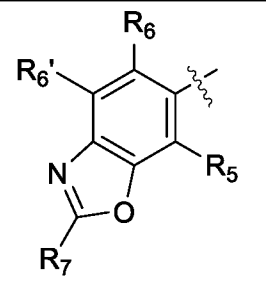
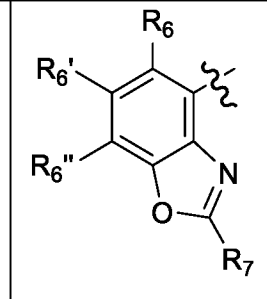
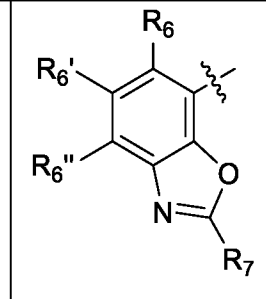
[00280] A é um dos grupos de A6, A18, A25, e A26:

			
A6	A18	A25	A26

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
4.01	Me	Cl	CF	A6							
4.02	H	Cl	CF	A6							
4.03	Me	Cl	CF	A6							Me
4.04	H	Cl	CF	A6							Me
4.05	Me	Cl	CF	A18							
4.06	H	Cl	CF	A18							
4.07	Me	Cl	CF	A18							Me
4.08	H	Cl	CF	A18							Me
4.09	Me	Cl	CH	A18							
4.10	Me	Cl	CF	A25							Me
4.11	H	Cl	CF	A25							Me
4.12	Me	Cl	CF	A25							
4.13	Me	Cl	CF	A26							

**Tabela 5:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de benzoxazolila

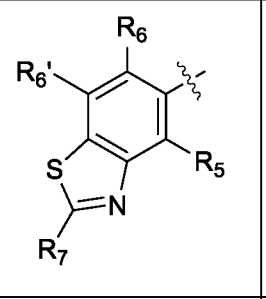
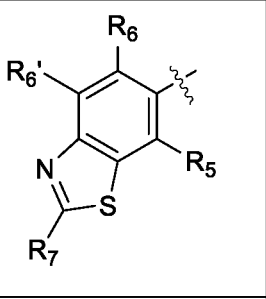
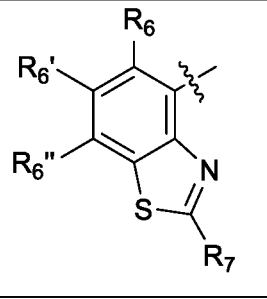
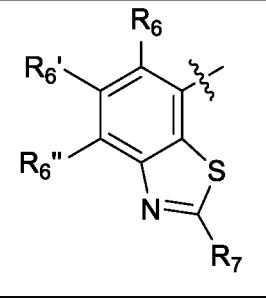
[00281] A é A7, A9, A29, ou A30:

			
A7	A9	A29	A30

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
5.01	Me	Cl	CF	A9							

**Tabela 6:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de benzotiazolila

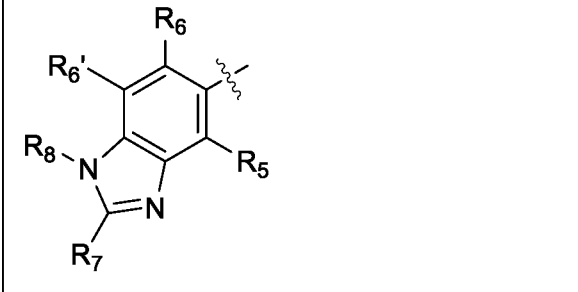
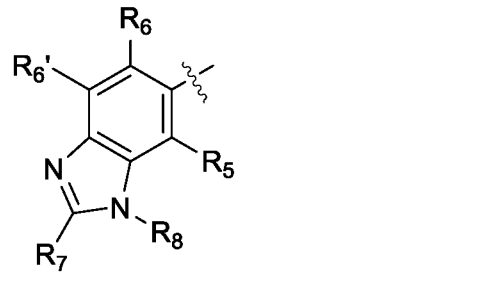
[00282] A é A8, A10, A31, ou A32:

			
A8	A10	A31	A32

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
6.01	Me	Cl	CF	A8							
6.02	H	Cl	CF	A8							

**Tabela 7:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de 1H-benzimidazolila

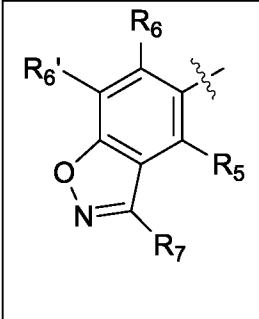
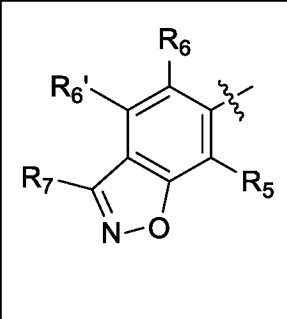
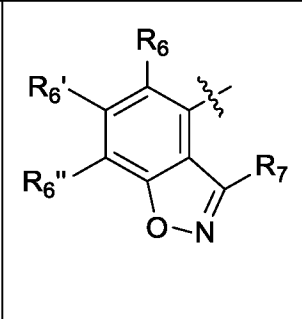
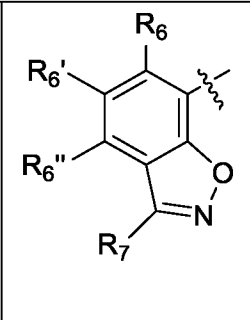
[00283] A é um dos grupos A11 e A12:

	
A11	A12

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
7.01	Me	Cl	CF	A12							
7.02	Me	Cl	CF	A12							Me
7.03	H	Cl	CF	A12							Me

**Tabela 8:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de indoxazinila

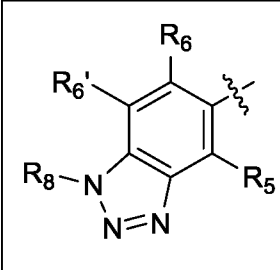
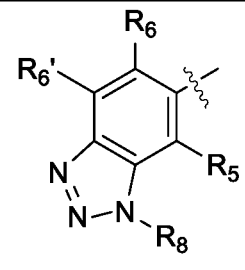
[00284] A é A4, A16, A33, ou A34:

			
A4	A16	A33	A34

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
8.01	Me	Cl	CF	A16				NMe <sub>2</sub>			

**Tabela 9:** Compostos da Fórmula (I') com caudas de 1H-benzotriazolila

[00285] A é A19 ou A20:

	
A19	A20

C.Nº	R <sup>1'</sup>	R <sup>2</sup>	X	A	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>6'</sup>	R <sup>6''</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>7'</sup>	R <sup>8</sup>
9.01	Me	Cl	CH	A20							

[0041] **MÉTODOS PARA PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS**

[00286] Exemplos de procedimentos que sintetizam os compostos

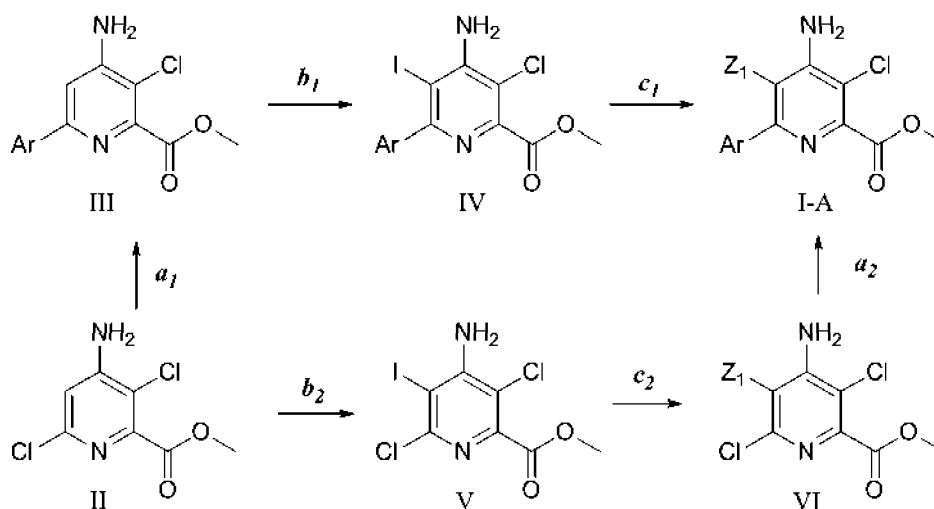
da Fórmula (I) são fornecidos abaixo.

[00287] Os ácidos 4-amino-6-(heterocíclico)picolínicos da Fórmula (I) podem ser preparados de diversas maneiras. Conforme representado no esquema I, os 4-amino-6-cloropicolinatos da Fórmula (II) podem ser convertidos nos picolinatos 4-amino-6-substituídos da Fórmula (III), em que Ar é conforme aqui definido, via ligação de Suzuki com um ácido ou éster borônico, na presença de uma base, tal como fluoreto de potássio, e um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em uma mistura de solvente polar prótico, tal como acetonitrila-água, a uma temperatura, tal como 110°C, *p.ex.* em um reator de microondas (reação  $a_1$ ). Picolinatos 4-amino-6-substituídos de Fórmula (III) podem ser transformados nos picolinatos 5-iodo-4-amino-6-substituídos da Fórmula (IV) via uma reação com reagentes de iodação, tais como ácido periódico e iodo, em um solvente polar, prótico, tal como álcool metílico (reação  $b_1$ ). Acoplamento de Stille dos picolinatos 5-iodo-4-amino-6-substituídos da Fórmula (IV) com um estanato, tal como tetrametilestanho, na presença de um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em um solvente não-reativo, tal como 1,2-dicloroetano, a uma temperatura, tal como 120-130°C, *p.ex.* em um reator de microondas, fornece picolinatos 5-(substituídos)-4-amino-6-substituídos da Fórmula (I-A), em que  $Z_1$  é alquila, alqueni-la, alquinila, haloalqueni-la e alquiltio (reação  $c_1$ ).

[00288] Alternativamente, 4-amino-6-cloropicolinatos da Fórmula (II) podem ser transformados nos 5-iodo-4-amino-6-cloropicolinatos da Fórmula (V) via uma reação com reagentes de iodação, tais como ácido periódico e iodo, em um solvente polar, prótico, tal como álcool metílico (reação  $b_2$ ). Acoplamento de Stille dos 5-iodo-4-amino-6-cloropicolinatos da Fórmula (V) com um estanano, tal como tetrametilestanho, na presença de um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em um solvente não reativo, tal como 1,2-

dicloroetano, a uma temperatura, tal como 120-130°C, *p.ex.* em um reator de microondas, fornece 5-(substituídos)-4-amino-6-cloropicolinatos da Fórmula (VI), em que Z<sub>1</sub> é alquila, alquenila, alquini-la, haloalquenila e alquiltio (reação *c*<sub>2</sub>). Os 5-substituídos-4-amino-6-cloropicolinatos da Fórmula (VI) podem ser convertidos nos 5-substituídos-4-amino-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (I-A), em que Ar é conforme aqui definido, via um acoplamento de Suzuki com um ácido ou éster borônico, na presença de uma base, tal como fluoreto de potássio e um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em uma mistura de solvente polar, prótico, tal como acetonitrila-água, a uma temperatura, tal como 110°C, *p.ex.*, em um reator de microondas (reação *a*<sub>2</sub>).

### Esquema I

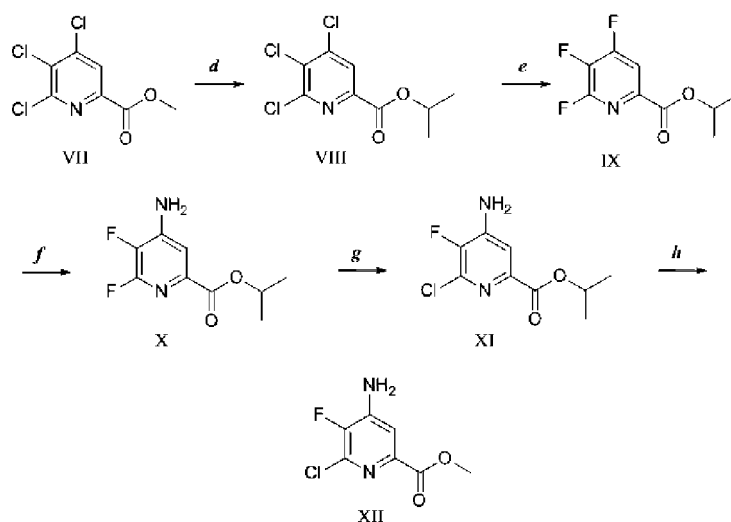


[00289] Como representado no esquema II, o 4,5,6-tricloropicolinato da Fórmula (VII) pode ser convertido no isopropiléster correspondente da Fórmula (VIII), via uma reação com álcool isopropílico e ácido sulfúrico concentrado, *p.ex.*, na temperatura de refluxo sob condições Dean-Stark (reação *d*). O éster isopropílico da Fórmula (VIII) pode ser reagido com uma fonte de íons fluoreto, tal como fluoreto de céσιο, em um solvente polar aprótico, tal como sulfóxido de dimetila (DMSO), a uma temperatura, tal como 80°C, sob condições Dean-Stark, para pro-

duzir o 4,5,6-trifluorpicolinato de isopropila da Fórmula (IX) (reação *e*). O 4,5,6-trifluorpicolinato de isopropila da Fórmula (IX) pode ser amina-do com uma fonte de nitrogênio, tal como amônia, em um solvente po-lar aprótico, tal como DMSO, para produzir um 4-amino-5,6-difluor-picolinato da Fórmula (X) (reação *f*). O substituinte flúor na posição 6 do 4-amino-5,6-difluorpicolinato da Fórmula (X) pode ser trocado por um substituinte cloro por tratamento com uma fonte de cloreto, tal co-mo cloreto de hidrogênio, *p.ex.*, em dioxano, em um reator Parr, a uma temperatura, tal como 100°C, para produzir um 4-amino-5-flúor-6-cloro-picolinato da Fórmula (XI) (reação *g*). O 4-amino-5-flúor-6-cloropicolinato da Fórmula (XI) pode ser transesterificado no metil és-ter correspondente da Fórmula (XII) por reação com isopropóxido de titânio (IV) em álcool metílico a temperatura de refluxo (reação *h*).

[00290] Como representado no esquema

Esquema II



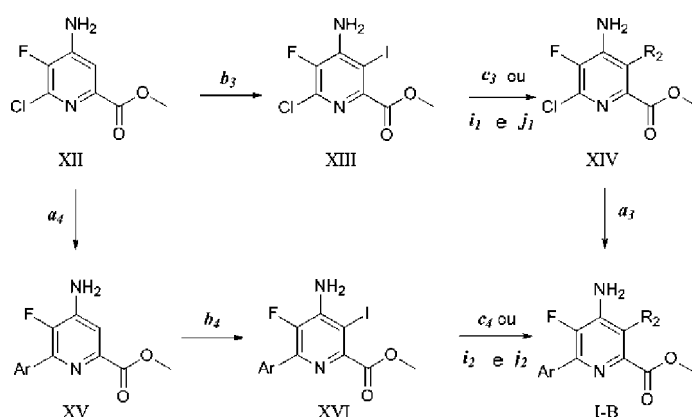
[00291] Como representado no esquema III, o 4-amino-5-flúor-6-cloropicolinato da Fórmula (XII) pode ser transformado no 3-iodo-4-amino-5-flúor-6-cloropicolinato da Fórmula (XIII) via reação com rea-gentes de iodação, tais como ácido periódico e iodo, em um solvente polar, prótico, tal como álcool metílico (reação *b*<sub>3</sub>). Acoplamento de Stille dos 3-iodo-4-amino-5-flúor-6-cloropicolinatos da Fórmula (XIII)

com um estanano, tal como tributil(vinil)estanano, na presença de um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em um solvente não reativo, tal como 1,2-dicloroetano, a uma temperatura, tal como 120-130°C, *p.ex.*, em um reator de microondas, produz 3-(substituído)-4-amino-5-flúor-6-cloropicolinatos da Fórmula (XIV), em que R<sup>2</sup> é alquila, alquenila, alquinila, haloalquila e alquiltio (reação c<sub>3</sub>). Alternativamente, os 3-iodo-4-amino-5-flúor-6-cloropicolinatos da Fórmula (XIII) podem ser tratados com carbonato de cézio e uma quantidade catalítica de ambos iodeto de cobre (I) e 1,10-fenantrolina na presença de um solvente polar, prótico, tal como álcool metílico, a uma temperatura, tal como 65°C, para fornecer um ácido 3-(substituído)-4-amino-5-flúor-6-cloropicolínico da Fórmula (XIV), em que R<sup>2</sup> é alcóxi ou haloalcóxi (reação i<sub>1</sub>), que pode ser esterificado nos metil ésteres, *p.ex.*, por um tratamento com cloreto de hidrogênio (gás) e álcool metílico a 50°C (reação j<sub>1</sub>). Os 3-(substituídos)-4-amino-5-flúor-6-cloropicolinatos da Fórmula (XIV) podem ser convertidos nos 4-amino-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (I-B), em que Ar é conforme aqui definido, via acoplamento de Suzuki com um ácido borônico ou éster, na presença de uma base, tal como fluoreto de potássio, e um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em uma mistura de solvente polar, prótico, tal como acetonitrila-água, a uma temperatura, tal como 110°C, *p.ex.*, em um reator de microondas (reação a<sub>3</sub>).

[00292] Alternativamente, os 4-amino-5-flúor-6-cloropicolinatos da Fórmula (XII) podem ser convertidos nos 4-amino-5-flúor-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XV), em que Ar é conforme definido aqui, via acoplamento de Suzuki com um ácido borônico ou éster, na presença de uma base, tal como fluoreto de potássio, e um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em uma mistura de solvente polar, prótico, tal como acetonitrila-água, a uma temperatura,

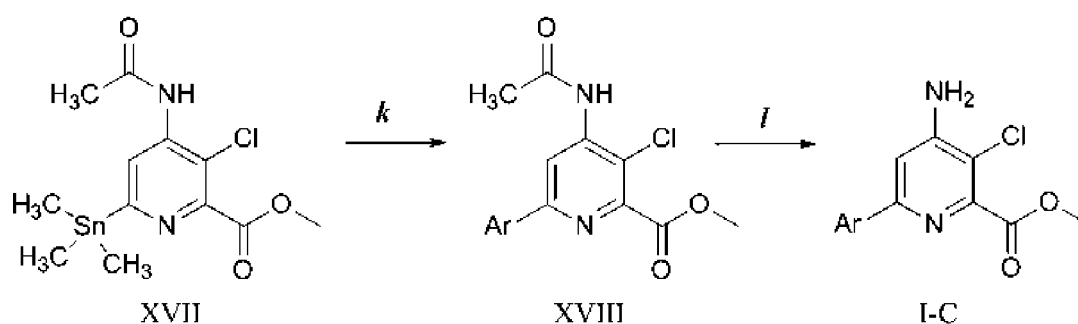
tal como 110°C, *p.ex.*, em um reator de microondas (reação  $a_4$ ). Os 4-amino-5-flúor-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XV) podem ser transformados nos 3-iodo-4-amino-5-flúor-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XVI) via reação com reagentes de iodação, tais como o ácido periódico e iodo, em um solvente polar, prótico, tal como álcool metílico (reação  $b_4$ ). Acoplamento de Stille dos 3-iodo-4-amino-5-flúor-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XVI) com um estanano, tal como tributil(vinil)estanano, na presença de um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em um solvente não-reativo, tal como 1,2-dicloroetano, a uma temperatura, tal como 120–130°C, *p.ex.*, em um reator de microondas, produz 3-(substituído)-4-amino-5-flúor-6-substituído-picolinatos da Fórmula (I-B), em que  $R^2$  é alquila, alquenila, alquinila, haloalquenila e alquiltio (reação  $c_4$ ). Alternativamente, os 3-iodo-4-amino-5-flúor-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XVI) podem ser tratados com carbonato de céσιο e uma quantidade catalítica de ambos iodeto de cobre (I) e 1,10 -fenantrolina na presença de um solvente polar prótico, tal como álcool metílico, a uma temperatura, tal como 65°C, para fornecer ácidos 3-(substituídos)-4-amino-5-flúor-6-substituídos-picolínicos da Fórmula (I-B), em que  $R^2$  é alcóxi ou haloalcóxi (reação  $i_2$ ), que podem ser esterificados nos metilésteres, por ex., por tratamento com cloreto de hidrogênio (gás) e álcool metílico, a uma temperatura, tal como 50°C (reação  $j_2$ ).

### Esquema III



[00293] Como representado no esquema IV, os 4-acetamido-6-(trimetilestanil)picolinatos da Fórmula (XVII) podem ser convertidos nos 4-acetamido-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XVIII), em que Ar é como definido aqui, via acoplamento de Stille com um brometo de arila ou iodeto de arila, na presença de um catalisador, tal como diclorreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em um solvente, tal como 1,2-dicloroetano, *p.ex.*, a uma temperatura de refluxo (reação *k*). 4-Amino-6-substituídos picolinatos da Fórmula (I-C), em que Ar é conforme definido aqui, podem ser sintetizados a partir de 4-acetamido-6-substituídos-picolinatos da Fórmula (XVIII) via métodos de desproteção padrão, tais como gás de ácido clorídrico em metanol (reação *l*).

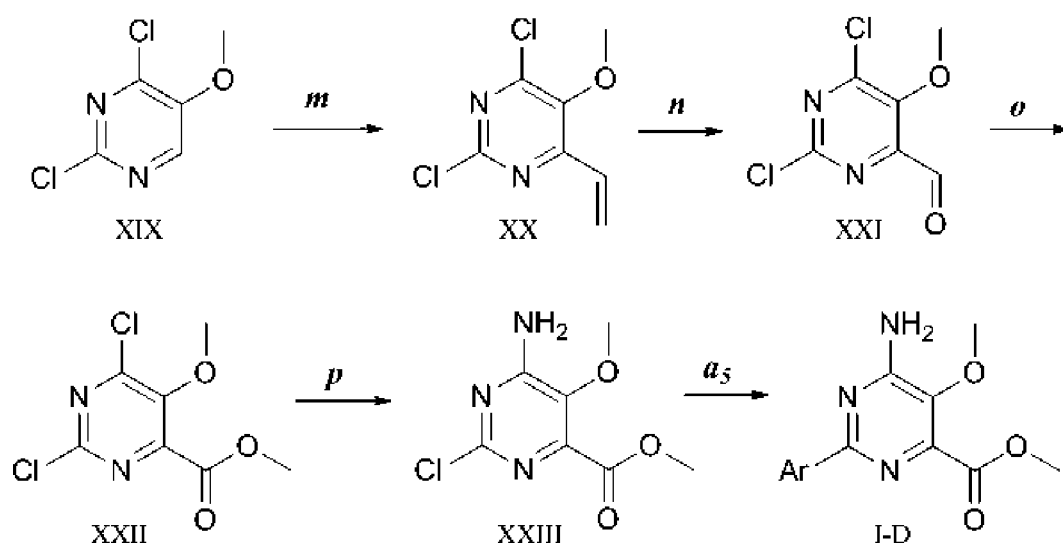
#### Esquema IV



[00294] Como representado no esquema V, 2,4-dicloro-5-metóxi-pirimidina (XIX) pode ser transformado na 2,4-dicloro-5-metóxi-6-vinilpirimidina (XX) via uma reação com brometo de vinil magnésio, em um solvente polar aprótico, tal como tetra-hidrofurano (reação *m*). 2,4-Dicloro-5-metóxi-6-vinilpirimidina (XX) pode ser transformada em 2,6-dicloro-5-metoxipirimidina-4-carboxaldeído (XXI) via tratamento com ozônio, *p.ex.*, em uma mistura de solvente de diclorometano:metanol (reação *n*). 2,6-Dicloro-5-metoxipirimidina-4-carboxaldeído (XXI) pode ser transformado em 2,6-dicloro-5-metoxipirimidina-4-carboxilato de metila (XXII) via tratamento com bromo, *p.ex.*, em uma mistura de solvente metanol: água (reação *o*). 2,6-dicloro-5-metoxipirimidina-4-carboxilato de metila (XXII) pode ser transformado em 6-amino-2-cloro-5-

metoxipirimidina-4-carboxilato de metila (XXIII) via tratamento com amônia (*p.ex.*, 2 equivalentes) em um solvente, tal como DMSO (reação *p*). Finalmente, 6-amino-2-substituído-5-metoxipirimidina-4-carboxilatos da Fórmula (I-D), em que Ar é conforme definido aqui, podem ser preparados via um acoplamento de Suzuki com um ácido ou éster borônico, com 6-amino-2-cloro-5-metoxipirimidina-4-carboxilato (XXIII), na presença de uma base, tal como fluoreto de potássio, e um catalisador, tal como dicloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II), em uma mistura de solvente polar, prótico, tal como acetonitrila-água, a uma temperatura, tal como 110°C, *p.ex.*, em um reator de microondas (reação *a*<sub>5</sub>).

#### Esquema V



[00295] Os compostos das Fórmulas I-A, I-B, I-C, e I-D obtidos por quaisquer desses processos, podem ser recuperados por meios convencionais e purificados por procedimentos padrão, tais como por recristalização ou cromatografia. Os compostos da Fórmula (I) podem ser preparados a partir de compostos das Fórmulas I-A, I-B, I-C, e I-D usando métodos padrão bastante conhecidos na técnica.

#### [0042] COMPOSIÇÕES E PROCESSOS

[00296] Em algumas modalidades, os compostos fornecidos aqui

são empregados em misturas contendo uma quantidade com eficácia herbicida do composto junto com pelo menos um adjuvante ou carreador aceitáveis na agricultura. Exemplos de adjuvantes ou carreadores incluem aqueles que não são fitotóxicos ou significativamente fitotóxicos para culturas valiosas, *p.ex.*, nas concentrações empregadas para aplicação das composições para o controle seletivo de ervas daninhas na presença de culturas, e/ou não reagem ou reagem significativamente quimicamente com os compostos fornecidos aqui ou com outros ingredientes da composição. Tais misturas podem ser projetadas para aplicação direta em ervas daninhas ou seu local, ou podem ser concentrados ou formulações, que são diluídos com carreadores adicionais e adjuvantes antes da aplicação. Eles podem ser sólidos, tais como, por exemplo, pós, grânulos, grânulos dispersíveis em água ou pós umectáveis, ou líquidos, tais como, e por exemplo, concentrados emulsificáveis, soluções, emulsões ou suspensões. Eles também podem ser fornecidos como uma pré-mistura ou misturados em tanques.

[00297] Adjuvantes agrícolas apropriados e carreadores que são úteis na preparação das misturas herbicidas da divulgação são bem conhecidos daqueles especialistas na técnica. Alguns desses adjuvantes incluem mas não estão limitados a concentrados de óleo da cultura (óleo mineral (85%) + emulsificantes (15%)); etoxilato de nonilfenol; sal de benzilcocoalquildimetil amônio quaternário; mistura de hidrocarboneto de petróleo, alquil ésteres, ácido orgânico, e agente tenso ativo aniônico; C<sub>9</sub>-C<sub>11</sub> alquilpoliglicosídeo; álcool etoxilato fosfatado; álcool (C<sub>12</sub>-C<sub>16</sub>) etoxilato primário natural; copolímero em bloco di-sec-butilfenol EO-PO; polisiloxano-metil cap; nonilfenol etoxilato + nitrato de ureia amônio; óleo de semente metilado emulsificado; etoxilato de (8EO) tridecil álcool (sintético); etoxilato de amina graxa (15 EO); dioleato-99 de PEG(400).

[00298] Carreadores líquidos que podem ser empregados incluem

água e solventes orgânicos. Os solventes orgânicos tipicamente empregados incluem, mas não estão limitados a, frações de petróleo ou hidrocarbonetos, tais como óleo mineral, solventes aromáticos, óleos parafínicos e semelhantes; óleos vegetais tais como óleo de soja, óleo de colza, óleo de oliva, óleo de mamona, óleo de semente de girassol, óleo de coco, óleo de milho, óleo de algodão, óleo de linhaça, óleo de palma, óleo de amendoim, óleo de açafrão, óleo de gergelim, óleo de tungue e semelhantes; ésteres dos óleos vegetais acima; ésteres dos monoálcoois ou poliálcoois di-hídricos, tri-hídricos ou outros mais baixos (contendo 4-6 hidróxi), tal como estearato de 2-etilhexila, oleato de *n*-butila, miristato de isopropila, dioleato de propileno glicol, succinato de di-octila, adipato de di-butila, ftalato de di-octila e semelhantes; ésteres de ácidos monocarboxílicos, dicarboxílicos e policarboxílicos e semelhantes. Solventes orgânicos específicos incluem tolueno, xileno, nafta de petróleo, óleo de culturas, acetona, metil etil cetonas, ciclohexanona, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etila, acetato de amila, acetato de butila, propileno glicol monometil éter e dietileno glicol monometil éter, álcool metílico, álcool etílico, álcool isopropílico, álcool amílico, etileno glicol, propileno glicol, glicerina, *N*-metil-2-pirrolidiona, *N,N*-dimetil alquilamidas, sulfóxido de dimetila, fertilizantes líquidos, e semelhantes. Em algumas modalidades, água é o carreador para a diluição de concentrados.

[00299] Carreadores sólidos apropriados incluem talco, argila pirofilita, sílica, argila atapulgita, argila caulim, gel de sílica, giz, terra diatomácea, cal, carbonato de cálcio, argila bentonita, terra de Fuller, cascas de algodão, farinha de trigo, farinha de soja, pedra pomes, pó de serra, farinha de concha, lignina, e semelhantes.

[00300] Em algumas modalidades, um ou mais agentes tenso ativos são utilizados nas composições da presente divulgação. Tais agentes tenso ativos são empregados, em algumas modalidades, tanto em

composições sólidas e líquidas, *p.ex.*, aquelas projetadas para serem diluídas com carreadores antes da aplicação. Os agentes tenso ativos podem ter caráter aniônico, catiônico ou não iônico e podem ser empregados como agentes emulsificantes, agentes umectantes, agentes de suspensão, ou para outras finalidades. Agentes tenso ativos convencionalmente utilizados na técnica da formulação e que também podem ser utilizados nas presentes formulações são descritos, *inter alia*, em *McCutcheon's Detergents e Emulsifiers Annual*, MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1998, e na *Encyclopedia of Surfactants*, Vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81. Agentes tenso ativos típicos incluem sais de sulfatos de alquila, tais como lauril sulfatos de dietanolamônio, tais como sais de alquilarilsulfonatos, tal como dodecilbenzenosulfato de cálcio; produtos de adição de alquilfenol-óxido de alquilenos, tal como nonilfenol-C<sub>18</sub> etoxilato; produtos de adição álcool-óxido de alquilenos, tal como álcool tridecíclico-C<sub>16</sub> etoxilato; sabões, tais como estearato de sódio; sais de alquilnaftalenosulfonato, tais como sódio dibutilnaftalenosulfonato; dialquil ésteres de sais de sulfosuccinato, tal como sódio di(2-etilhexil) sulfosuccinato; ésteres de sorbitol, tal como oleato de sorbitol; aminas quaternárias, tal como cloreto de lauril trimetilamônio; polietileno glicol ésteres de ácidos graxos, tal como estearato de polietileno glicol; copolímeros em bloco de óxido de etileno e óxido de propileno; sais de ésteres de monoalquilfosfato e dialquilfosfato; óleos vegetais ou óleos de sementes tais como óleo de soja, óleo de colza/canola, óleo de oliva, óleo de mamona, óleo de semente de girassol, óleo de coco, óleo de milho, óleo de algodão, óleo de linhaça, óleo de palma, óleo de amendoim, óleo de açafrão, óleo de gergelim, óleo de tungue e semelhantes; e ésteres dos óleos vegetais acima, *p.ex.* metil ésteres.

[00301] Frequentemente, alguns desses materiais, tais como óleos vegetais ou óleos de sementes e seus ésteres, podem ser usados in-

tercambiavelmente como um adjuvante agrícola, como um carreador líquido ou como um agente tenso ativo.

[00302] Outros adjuvantes comumente utilizados nas composições agrícolas incluem agentes de compatibilização, agentes antiespuma, agentes sequestrantes, agentes neutralizadores e tamponadores, inibidores de corrosão, corantes, odorantes, agentes de espalhamento, auxiliares de penetração, agentes colantes, agentes dispersantes, agentes espessantes, depressantes do ponto de congelamento, agentes antimicrobianos, e semelhantes. As composições também podem conter outros componentes compatíveis, por exemplo outros herbicidas, reguladores do crescimento das plantas, fungicidas, inseticidas e semelhantes, e podem ser formulados com fertilizantes líquidos ou sólidos, carreadores de fertilizantes particulados, tais como nitrato de amônio, ureia e semelhantes.

[00303] A concentração dos ingredientes ativos nas composições herbicidas desta divulgação é geralmente de cerca de 0,001 até cerca de 98 por cento em peso. Concentrações de cerca de 0,01 até cerca de 90 por cento em peso são frequentemente empregadas. Nas composições projetadas para serem empregadas como concentrados, o ingrediente ativo está geralmente presente em uma concentração de cerca de 5 até cerca de 98 por cento em peso, de preferência cerca de 10 até cerca de 90 por cento em peso. Tais composições são tipicamente diluídas com um carreador inerte, tal como água, antes da aplicação. As composições diluídas usualmente aplicadas às ervas daninhas ou ao local das ervas daninhas geralmente contêm cerca de 0,0001 até cerca de 1 por cento em peso de ingrediente ativo, e de preferência contêm cerca de 0,001 até cerca de 0,05 por cento em peso.

[00304] As presentes composições podem ser aplicadas a ervas daninhas ou ao seu local empregando pulverizadores de solo ou aéreos convencionais, borrifadores e aplicadores de grânulos, por adição

à água de irrigação ou inundação, e por outros meios convencionais conhecidos pelos especialistas na técnica.

[00305] Em algumas modalidades, os compostos e composições descritos aqui são aplicados como aplicação pós emergência, aplicação pré-emergência, aplicação em água em plantações de arroz inundadas ou massas de água (p.ex., laguinhos, lagos e fluxos de água), ou aplicação em queimadas.

[00306] Em algumas modalidades, os compostos e composições fornecidos aqui são utilizados para controlar ervas daninhas em culturas, incluindo mas não limitadas a cítricos, maçãs, borracha, óleo, palmeiras, florestas, arroz plantado diretamente, plantado em água e transplantado, trigo, cevada, aveias, centeio, sorgo, milho (de grão tenro) /milho (de grão duro), pastos, pradarias, pastagens, terra não cultivada, turfa, pomares e vinhedos, culturas aquáticas, ou plantações em fileiras, bem como aplicações em locais sem culturas, por exemplo administração da vegetação industrial (IVM) ou direitos de passagem. Em algumas modalidades, o compostos e composições são usados para controlar plantas lenhosas, ervas daninhas de folhas largas e gramas ou ciperáceas.

[00307] Em algumas modalidades, os compostos e composições fornecidos aqui são utilizados para controlar a vegetação indesejada em arroz. Em certos modalidades, a vegetação indesejável é *Bracharia platiphylla* (Groseb.) Nash (broadleaf signalgrass, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (large crabgrass, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (echinochloa, ECHCG), *Echinochloa colonum* (L.) LINK (echinochloa colona, ECHCO), *Echinochloa oryzoides* (Ard.) Fritsch (early watergrass, ECHOR), *Echinochloa oryzicola* (Vasinger) Vasinger (late watergrass, ECHPH), *Ischaemum rugosum* Salisb. (saramollagrass, ISCRU), *Leptochloa chinensis* (L.) Nees (Leptochloa chinesa, LEFCH), *Leptochloa fascicularis* (Lam.) Gray (bearded sprangletop,

LEFFA), *Leptochloa panicoides* (Presl.) Hitchc. (Leptochloa da Amazônia, LEFPA), *Panicum dichotomiflorum* (L.) Michx. (fall panicum, PANDI), *Paspalum dilatatum* Poir. (dallisgrass, PASDI), *Cyperus difformis* L. (smallflower flatsedge, carriço CYPDI), *Cyperus esculentus* L. (yellow nutsedge, CYPES), *Cyperus iria* L. (rice flatsedge, CYPID), *Cyperus rotundus* L. (purple nutsedge, CYPRO), *Eleocharis* species (ELOSS), *Fimbristilis miliacea* (L.) Vahl (globe fringerush, FIMMI), *Schoenoplectus juncooides* Roxb. (japanese bulrush, SPCJU), *Schoenoplectus maritimus* L. (sea clubrush, SCPMA), *Schoenoplectus mucronatus* L. (ricefield bulrush, SCPMU), espécies *Aeschynomene*, (jointvetch, AESSS), *Alternanthera philoxeroides* (Mart.) Griseb. (alligatorweed, ALRPH), *Alisma plantago-aquatica* L. (common waterplantain, ALSPA), espécies *Amaranthus*, (pigweeds e amarantos, AMASS), *Ammannia coccinea* Rottb. (redstem, AMMCO), *Eclipta alba* (L.) Hassk. (American false daisy, ECLAL), *Heteranthera limosa* (SW.) Willd./Vahl (ducksalad, HETLI), *Heteranthera reniformis* R. & P. (roundleaf mudplantain, HETRE), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (ivyleaf morningglory, IPOHE), *Lindernia dubia* (L.) Pennell (low false pimpinell, LIDDU), *Monochoria korsakowii* Regel & Maack (monochoria, MOOKA), *Monochoria vaginalis* (Burm. F.) C. Presl ex Kuhth, (monochoria, MOOVA), *Murdannia nudiflora* (L.) Brenan (doveweed, MUDNU), *Polygonum pensylvanicum* L., (Pennsylvania smartweed, POLPI), *Polygonum persicaria* L. (ladythumb, POLPE), *Polygonum hydropiperoides* Michx. (POLHP, mild smartweed), *Rotala indica* (Willd.) Koehne (Indian toothcup, ROTIN), *Sagittaria* species, (sagittaria, SAGSS), *Sesbania exaltata* (Raf.) Cory/Rydb. Ex Hill (hemp sesbania, SEBEX), ou *Sphenoclea zeylanica* Gaertn. (sphenoclea, SPDZE).

[00308] Em algumas modalidades, os compostos e composições fornecidos aqui são utilizados para controlar a vegetação indesejável em cereais. Em certos modalidades, a vegetação indesejável é *Alope-*

*curus myosuroides* Huds. (blackgrass, ALOMY), *Apera spica-venti* (L.) Beauv. (windgrass, APESV), *Avena fatua* L. (aveia, AVEFA), *Bromus tectorum* L. (downy brome, BROTE), *Lolium multiflorum* Lam. (azevém italiano, LOLMU), *Phalaris minor* Retz. (littleseed canarygrass, PHAMI), *Poa annua* L. (bluegrass anual, POANN), *Setaria pumila* (Poir.) Roemer & J.A. Schultes (yellow foxtail, SETLU), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (green foxtail verde, SETVI), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (Canada thistle, CIRAR), *Galium aparine* L. (catchweed bedstraw, GALAP), *Kochia scoparia* (L.) Schrad. (kochia, KCHSC), *Lamium purpureum* L. (purple deadnettle, LAMPU), *Matricaria recutita* L. (camomila selvagem, MATCH), *Matricaria matricarioides* (Less.) Porter (pineappleweed, MATMT), *Papaver rhoeas* L. (common poppy, PAPRH), *Polygonum convolvulus* L. (wild buckwheat, POLCO), *Salsola tragus* L. (Russian thistle, SASKR), *Stellaria media* (L.) Vill. (common chickweed, STEME), *Veronica persica* Poir. (Persian speedwell, VERPE), *Viola arvensis* Murr. (violeta do campo, VIOAR), ou *Viola tricolor* L. (violeta selvagem, VIOTR).

[00309] Em algumas modalidades, os compostos e composições fornecidos aqui são utilizados para controlar a vegetação indesejável em montanhas e pastagens. Em certos modalidades, a vegetação indesejável é *Ambrosia artemisiifolia* L. (common ragweed, AMBEL), *Cassia obtusifolia* (sickle pod, CASOB), *Centaurea maculosa* auct. non Lam. (spotted knapweed, CENMA), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (Canada thistle, CIRAR), *Convolvulus arvensis* L. (field bindweed, CONAR), *Euphorbia esula* L. (leafy spurge, EPHES), *Lactuca serriola* L./Torn. (prickly lettuce, LACSE), *Plantago lanceolata* L. (buckhorn plantain, PLALA), *Rumex obtusifolius* L. (broadleaf dock, RUMOB), *Sida spinosa* L. (prickly sida, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (wild mustard, SINAR), *Sonchus arvensis* L. (perennial sowthistle, SONAR), *Solidago* species (goldenrod, SOOSS), *Taraxacum officinale* G.H. Weber ex Wiggers

(dandelion, TAROF), *Trifolium repens* L. (white clover, TRFRE), ou *Urtica dioica* L. (common nettle, URTDI).

[0043]

[00310] Em algumas modalidades, os compostos e composições fornecidos aqui são utilizados para controlar a vegetação indesejável encontrada em culturas em fileiras. Em certos modalidades, a vegetação indesejável é *Alopecurus myosuroides* Huds. (blackgrass, ALOMY), *Avena fatua* L. (wild oat, AVEFA), *Brachiaria platiphylla* (Groseb.) Nash (broadleaf signalgrass, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (large crabgrass, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (barnyardgrass, ECHCG), *Echinochloa colonum* (L.) Link (jungle rice, ECHCO), *Lolium multiflorum* Lam. (Italian ryegrass, LOLMU), *Panicum dichotomiflorum* Michx. (fall panicum, PANDI), *Panicum miliaceum* L. (wild-proso millet, PANMI), *Setaria faberi* Herrm. (giant foxtail, SETFA), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (foxtail verde, SETVI), *Sorghum halepense* (L.) Pers. (massambará, SORHA), *Sorghum bicolor* (L.) Moench ssp. *Arundinaceum* (shattercane, SORVU), *Cyperus esculentus* L. (tiririca amarela, CYPES), *Cyperus rotundus* L. (tiririca roxa, CYPRO), *Abutilon theophrasti* Medik. (velvetleaf, ABUTH), *Amaranthus* species (pigweeds e amarantos, AMASS), *Ambrosia artemisiifolia* L. (common ragweed, AMBEL), *Ambrosia psilostachya* DC. (western ragweed, AMBPS), *Ambrosia trifida* L. (giant ragweed, AMBTR), *Asclepias syriaca* L. (common milkweed, ASCSY), *Chenopodium album* L. (common lambsquarters, CHEAL), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (Canada thistle, CIRAR), *Commelina benghalensis* L. (tropical spiderwort, COMBE), *Datura stramonium* L. (jimsonweed, DATST), *Daucus carota* L. (cenoura selvagem, DAUCA), *Euphorbia heterophylla* L. (wild poinsettia, EPHHL), *Erigeron bonariensis* L. (hairy fleabane, ERIBO), *Erigeron canadensis* L. (Canadian fleabane, ERICA), *Helianthus annuus* L. (girassol comum, HELAN), *Jacquemontia tamnifolia* (L.) Griseb. (ipo-

meas de flor pequena, IAQTA), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (ivy leaf morning glory, IPOHE), *Ipomoea lacunosa* L. (ipomeas brancas, IPO-LA), *Lactuca serriola* L./Torn. (alface espinhosa, LACSE), *Portulaca oleracea* L. (purslane comum, POROL), *Sida spinosa* L. (sida espinhosa, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (mostarda selvagem, SINAR), *Solanum ptichanthum* Dunal (eastern black nightshade, SOLPT), ou *Xanthium strumarium* L. (common cocklebur, XANST).

[00311] Em algumas modalidades, taxas de aplicação de aproximadamente 1 até aproximadamente 4.000 gramas/hectare (g/ha) são empregadas em operações pós emergência. Em algumas modalidades, taxas de aproximadamente 1 até aproximadamente 4.000 g/ha são empregadas em operações de pré emergência.

[00312] Em algumas modalidades, os compostos, composições, e métodos fornecidos aqui são empregados em conjunto com um ou mais herbicidas para controlar uma maior variedade de vegetação indesejável. Quando empregado em conjunto com outros herbicidas, os compostos atualmente reivindicados podem ser formulados com os outros herbicidas ou herbicida, misturados em tanque com os outros herbicidas ou herbicida ou aplicados sequencialmente com os outros herbicidas ou herbicida. Alguns dos herbicidas que podem ser empregados em conjunto com os compostos da presente divulgação incluem: 4-CPA, 4-CPB, 4-CPP, 2,4-D, 2,4-D sal colina, ésteres 2,4-D e aminas, 2,4-DB, 3,4-DA, 3,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DP, 2,3,6-TBA, 2,4,5-T, 2,4,5-TB, acetocloro, acifluorfen, aclonifen, acroleína, alacloro, alidocloro, aloxidim, álcool alílico, alorac, ametrídiona, ametrina, amibuzina, amicarbazona, amidosulfurona, aminociclopiraclo, aminopiraldida, metil-amiprofos, amitrola, sulfamato de amônio, anilofos, anisurona, asulam, atratona, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, aziprotrina, barban, BCPC, beflubutamida, benazolin, bencarbazona, benfluralin, benfuresato, metil-bensulfurona, bensulida, bentiocarb, sódio

bentazona, benzadox, benzofendizona, benzipram, benzobiciclona, benzofenap, benzofluor, benzoilprop, benzotiazurona, biciclopirona, bifenox, bilanafos, bispiribac-sódio, borax, bromacil, bromobonil, bromobutideo, bromofenoxim, bromoxinil, brompirazona, butaclor, butafenacil, butamifos, butenaclor, buthidazol, butiurona, butralina, butroxidima, buturona, butilato, ácido cacodílico, cafenstrole, clorato de cálcio, cálcio cianamida, cambendicloro, carbasulam, carbetamida, carboxazol, clorprocarb, etil- carfentrazona, CDEA, CEPC, clometoxifen, cloramben, cloranocril, clorazifop, clorazina, clorobromurona, clorbufam, cloreturona, clorfenac, clorfenprop, clorflurazol, clorflurenol, cloridazona, clorimurona, cloronitrofen, cloropon, clorotolurona, cloroxurona, cloroxinila, clorprofam, clorosulfurona, clorothal, clorotiamida, etilcinidona, cinmetilina, cinosulfurona, cisanilida, clethodim, cliodinato, clodinafop-propargil, clofop, clomazona, clomeprop, cloprop, cloproxidim, clopiralida, metil cloransulam, CMA, sulfato de cobre, CPMF, CPPC, credazina, cresol, cumilurona, cianatrina, cianazina, cicloato, ciclosulfamurona, cicloxidim, ciclurona, butil-cihalofop, ciperquat, ciprazina, ciprazol, cipromida, daimurona, dalapon, dazomet, delaclor, desmedifam, desmetrina, di-alato, dicamba, diclobenil, dicloralureia, diclormate, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclosulam, dietamquat, dietatil, difenopenteno, difenoxurona, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, dimefurona, dimepiperato, dimetaclor, dimetametrina, dimetenamida, dimetenamida-P, dimexano, dimidazona, dinitramina, dinofenato, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinoterb, difenamida, dipropetrina, diquat, disul, ditiopir, diurona, DMPA, DNOC, DSMA, EBEP, eglinazina, endotal, epronaz, EPTC, erbon, esprocarb, etalfluralina, ethbenzamida, etametsulfurona, etidimurona, etiolato, etobenzamida, etobenzamida, etofumesato, etoxifen, etoxisulfurona, etinofen, etnipromida, etobenzanida, EXD, fenasulam, fenoprop, fenoxaprop, P-etil fenoxaprop, P-etil-fenoxaprop + etil-isoxadifen, fenoxasulfona, fenteracol, fen-

tiaprop, fentrazamida, fenurona, sulfato ferroso, flamprop, flamprop-M, flazasulfurona, florasulam, fluazifop, P-butil fluazifop, fluazolto, flucarbazona, flucetosulfurona, flucloralina, flufenacet, flufenican, etil-flufenpir, flumetsulam, flumezina, pentil-flumiclorac, flumioxazina, flumipropina, fluometurona, flúordifen, flúorglicofen, flúormidina, flúornitrofen, fluotiurona, flupoxam, flupropacila, flupropanato, flupirsulfurona, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, flurtamona, flutiacet, fomesafen, foramsulfurona, fosamina, furiloxifen, glufosinato, amônio-glufosinato, glifosato, halosafen, metil-halosulfurona, haloxidina, metil-haloxifop, P-metil-haloxifop, metil-haloxifen, hexacloroacetona, hexaflurato, hexazinona, imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazethapir, imazosulfurona, indanofan, indaziflam, iodobonil, iodometano, iodosulfurona, iofensulfurona, ioxinil, ipazina, ipfencarbazona, iprimidam, isocarbamida, isocil, isometiozina, isonorurona, isopolinato, isopropalina, isoproturona, isourona, isoxabeno, isoxaclortole, isoxaflutole, isoxapirifop, karbutilato, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MAA, MAMA, MCPA ésteres e aminas, tioetil-MCPA, MCPB, mecoprop, mecoprop-P, medinoterb, mefenacet, mefluidida, mesoprazina, mesosulfurona, mesotriona, metam, metamifop, metamitron, metazaclor, metazosulfurona, metflurazona, metabenzotiazurona, metalpropalina, metazol, metiobencarb, metiozolina, metiurona, metometona, metoprotrina, brometo de metila, isotiocianato de metila, metildimrona, metobenzurona, metobromurona, metolaclor, metosulam, metoxurona, metribuzina, metsulfurona, molinato, monalida, monisourona, ácido monocloroacético, monolinurona, monurona, morfamquat, MSMA, naproanilida, napropamida, napropamida-M, naptalam, neburona, nicosulfurona, nipiraclufen, nitalina, nitrofen, nitrofluorfen, norflurazona, norurona, OCH, orbencarb, *orto*-diclorobenzeno, ortosulfamurona, orizalina, oxadiargila, oxadiazona, oxapirazona, oxasulfurona, oxaziclo-mefona, oxifluorfen, etil-paraflufen, paraflurona, paraquat, pebulato,

ácido pelargônico, pendimetalina, penoxsulam, pentaclorofenol, pentanocloro, pentoxazona, perfluidona, petoxamida, fenisofam, fenmedifam, etil-fenmedifam, fenobenzurona, acetato de fenilmercúrio, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofos, arsenita de potássio, azida de potássio, cianato de potássio, pretilaclor, metil-primisulfurona, prociazina, prodiamina, profluazol, profluralina, profoxidima, proglinazina, cálcio prohexadiona, prometona, prometrina, propaclor, propanila, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propirisulfurona, propizamida, prosulfalina, prosulfocarb, prosulfurona, proxan, prinacoloro, pidanona, piraclonila, piraflufeno, pirasulfotola, pirazogila, pirazolinato, etil-pirazosulfurona, pirazoxifen, piribenzoxim, piributicarb, piriclor, piridafol, piridato, piriftalida, piriminobac, pirimisulfan, metil-piritiobac, piroxasulfona, piroxsulam, quinclorac, quinmerac, quinoclamina, quinonamida, quizalofop, P-etil-quizalofop, rhodetanil, rimsulfurona, saflufenacil, S-metolaclor, sebutilazina, secbumetona, setoxidim, sidurona, simazina, simetona, simetrina, SMA, arsenita de sódio, azida de sódio, clorato de sódio, sulcotriona, sulfalato, sulfentrazona, sulfometurona, sulfosato, sulfosulfurona, ácido sulfúrico, sulglycapin, swep, TCA, tebutam, tebutiurona, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacil, terbucarb, terbuclor, terbumetona, terbutilazina, terbutrina, tetraflurona, tenilclor, tiazafurona, tiazopir, tidiazimina, tidiazurona, metiltienocarbazona, tifensulfurona, tiobencarb, tiocarbazil, tioclorim, topramezona, tralcóxidim, triafamona, tri-alato, triasulfurona, triaziflam, tribenurona, tricamba, ésteres e aminas triclopir, tridifano, trietazina, trifloxisulfurona, trifluralina, triflusulfurona, trifop, trifopsima, trihidroxitriazina, trimeturona, tripropindana, tritac, tritosulfurona, vernolato e xilaclor.

[00313] Os compostos e composições da presente divulgação podem ser geralmente empregados em combinação com outros protetores contra herbicida, tais como benoxacor, bentiocarb, brassinólida,

cloquintocet (*p.ex.*, mexil), ciometrinila, daimurona, diclormida, diclonona, dimepiperato, disulfoton, etil-fenclozazol, fenclozim, flurazol, fluxofenim, furilazol, proteínas harpin, etil-isoxadifen, dietil-mefenpir, MG 191, MON 4660, anidrido ftálico (NA), oxabetrinil, R29148 e amidas de ácido *N*-fenilsulfonilbenzoico, para aumentar sua seletividade.

[00314] Os compostos, composições, e métodos descritos aqui podem ser empregados para controlar a vegetação indesejável em culturas tolerantes a glifosato, culturas tolerantes a glufosinato, culturas tolerantes a dicamba, culturas tolerantes a fenóxi auxina, culturas tolerantes a piridilóxi auxina, culturas tolerantes a ariloxifenoxipropionato, culturas tolerantes a inibidor acetil CoA carboxilase (ACCase), culturas tolerantes a imidazolinona, culturas tolerantes a inibidor acetolactato sintase (ALS), culturas tolerantes a inibidor 4-hidroxifenil-piruvato dióxigenase (HPPD), culturas tolerantes a inibidor protoporfirinogen oxidase (PPO), culturas tolerantes a triazina, e culturas tolerantes a bromoxinil (tais como, mas não limitado a, soja, algodão, canola/óleo de colza, arroz, cereais, milho, turfa, etc), por exemplo, em conjunto com glifosato, glufosinato, dicamba, fenóxi auxinas, piridilóxi auxinas, ariloxifenoxipropionatos, inibidores ACCase, imidazolinonas, inibidores ALS, inibidores HPPD, inibidores PPO, triazinas, e bromoxinil. As composições e métodos também podem ser utilizados no controle da vegetação indesejável em culturas que possuem múltiplos genes ou genes combinados, conferindo tolerância a químicas múltiplas e/ou inibidores de múltiplos modos-de-ação.

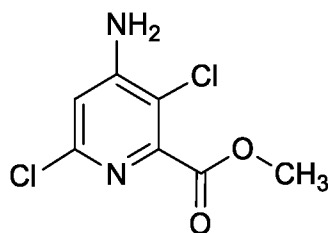
[00315] Os compostos e composições fornecidos aqui também podem ser empregados para controlar ervas daninhas tolerantes ou resistentes a herbicida a ervas daninhas. Exemplos de ervas daninhas resistentes ou tolerantes incluem, mas não estão limitadas a, biotipos resistentes ou tolerantes a inibidores de acetolactato sintase (ALS), inibidores do fotosistema II, inibidores de acetil CoA carboxilase (AC-

Case), auxinas sintéticas, inibidores do fotosistema I, inibidores de 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato (EPSP), inibidores do conjunto de microtúbulos, inibidores da síntese de lipídeos, inibidores de protoporfirino gene oxidase (PPO), inibidores da biossíntese carotenóide, inibidores do ácido graxo de cadeia muito longa (VLCFA), inibidores da fitoenno desaturase (PDS), inibidores de glutamina sintetase, inibidores da 4-hidroxifenil-piruvato-dioxigenase (HPPD), inibidores de mitose, inibidores da biossíntese de celulose, herbicidas com múltiplos modos-de ação, tais como quinclorac, e herbicidas não classificados, tais como ácidos arilaminopropiônicos, difenzoquat, endothall, e organo arsênicos. Exemplos de ervas daninhas resistentes ou tolerantes incluem, mas não estão limitadas a, biótipos com resistência ou tolerância a múltiplos herbicidas, múltiplas classes químicas e múltiplos modos de ação herbicida.

[00316] Os modalidades descritos e os exemplos que se seguem são para propósitos ilustrativos e não são pretendidos como limitantes do âmbito das reivindicações. Outras modificações, usos, ou combinações, no que se refere às composições descritas aqui, ficarão claras a uma pessoa de conhecimento comum na técnica sem sair do espírito e âmbito da matéria reivindicada.

#### [0044] SÍNTESE DE PRECURSORES

Preparação 1: 4-amino-3,6-dicloropicolinato de metila (Head A)

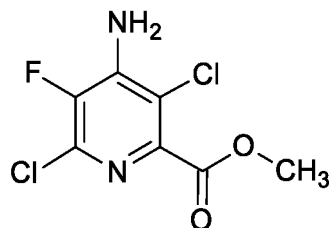


[0045]

[00317] Preparado como descrito em Fields et al., WO 2001051468 A1.

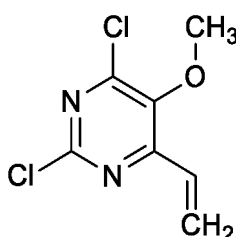
Preparação 2: fluorpicolinato 4-amino-3,6-dicloro-5-fluorico-

linato de metila (Head B)



[00318] Preparado como descrito em Fields et al., *Tetrahedron Letters* 2010, 511, 79-81.

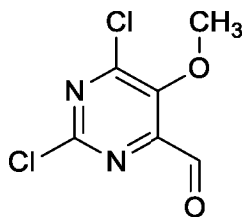
Preparação 3: 2,6-dicloro-5-metóxi-4-vinil pirimidina



[00319] A uma solução de 2,6-dicloro-5-metóxi pirimidina comercialmente disponível adicionou-se, gota a gota (100 gramas (g), 0,55 moles (mol)) em tetra-hidrofurano (THF) seco, brometo de vinil magnésio 1 molar (M) em solvente tetra-hidrofurano (124 g, 0,94 mol) por uma hora (h) à temperatura ambiente. A mistura foi então agitada por 4 h à temperatura ambiente. Excesso de reagente de Grignard foi temperado por meio de adição de acetona (200 mililitros (mL)) enquanto a temperatura da mistura foi mantida a uma temperatura abaixo de 20°C. Posteriormente, adicionou-se 2,3-dicloro-5,6-diciano-*p*-benzoquinona (DDQ; 151 g, 0,67 mol) imediatamente e agitou-se durante a noite. Um sólido amarelo foi precipitado. O sólido foi filtrado e lavado com acetato de etila (500 mL). O produto filtrado foi concentrado sob pressão reduzida e o composto cru resultante foi diluído com acetato de etila (2 litros (l)). O semi-sólido escuro, não dissolvido, resultante foi separado por filtração empregando acetato de etila. Ele foi ainda concentrado sob pressão reduzida para fornecer um composto bruto, que foi purificado por cromatografia em coluna. O composto foi diluído com 5% a 10% de mistura de acetato de etila em hexano para fornecer o composto do título (70 g, 60%): pf 60–61°C; <sup>1</sup>H

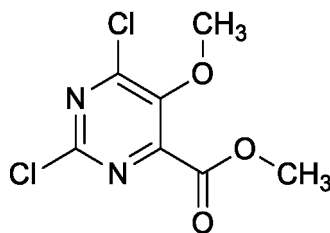
RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 3,99 (s, 3H), 5,85 (d, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,95 (dd, 1H).

Preparação 4: 2,6-dicloro-5-metóxi-pirimidina-4-carbaldeído



[00320] Uma solução de 2,6-dicloro-5-metóxi-4-vinil pirimidina (50 g, 0,24 mol) em diclorometano:metanol (4:1, 2 l) foi resfriada a -78°C. Gás ozônio foi borbulhado através dela por 5 h. A reação foi temperada com sulfeto de dimetila (50 mL). A mistura foi lentamente aquecida até a temperatura ambiente e concentrada sob pressão reduzida a 40°C para fornecer o composto do título (50,5 g, 100%); cromatografia líquida de alto desempenho (HPLC; 85% acetonitrila tamponada com 0,1% volume por volume (v/v) de ácido acético).

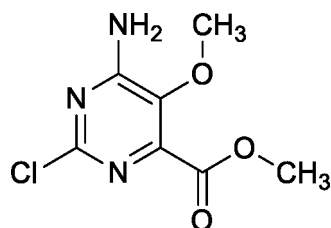
Preparação 5: 2,6-dicloro-5-metóxi-pirimidina-4-carboxilato de metila



[00321] Preparou-se uma solução de 2,6-dicloro-5-metóxi-pirimidina-4-carbaldeído (50 g, 0,24 mol) em metanol (1 l) e água (60 mL). Adicionou-se bicarbonato de sódio (400 g) à solução. Adicionou-se gota a gota uma solução 2 M de bromo (192 g, 1,2 mol) em metanol/água (600 mL, 9:1) à solução de pirimidina por 45 minutos (min) a 0°C enquanto se agitava a mistura. A agitação foi continuada na mesma temperatura por 1 h. Mais tarde, a mistura foi agitada à temperatura ambiente por 4 h. Enquanto agitava, a mistura de reação foi posteriormente entornada em uma mistura de gelo moído (2 l), bissulfito de sódio (50 g), e cloreto de sódio (200 g). O produto foi extraído com

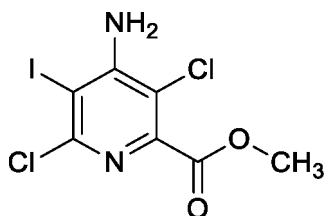
acetato de etila (1l x 2), e a camada orgânica combinada foi secada em sulfato de sódio e filtrada. A evaporação do solvente sob pressão reduzida produziu um material espesso, que solidificou em repouso prolongado para fornecer o composto do título (50,8 g, 87%); ESIMS  $m/z$  238 ( $[M+H]^+$ ).

Preparação 6: 6-amino-2-cloro-5-metóxi-pirimidina-4-carboxilato de metila (Head C)



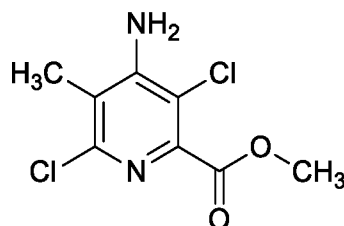
[00322] Preparou-se uma solução de 2,6-dicloro-5-metóxi-pirimidina-4-carboxilato de metila (25 g, 0,1 mol) e sulfóxido de dimetila (DMSO). Adicionou-se a esta solução, a 0–5°C, uma solução de amônia (2 eq) em DMSO. Esta mistura foi agitada na mesma temperatura de 0–5°C por 10 a 15 min. Mais tarde, a mistura foi diluída com acetato de etila e o sólido resultante foi filtrado. O filtrado de acetato de etila foi lavado com uma solução de salmoura e secado em sulfato de sódio. Mediante concentração, obteve-se o produto bruto. O produto bruto foi agitado em uma quantidade mínima de acetato de etila e filtrado para obter o composto puro. Obteve-se composto puro adicional a partir do filtrado que, após concentração, foi purificado por cromatografia flash. Isto produziu o composto do título (11 g, 50%): pf 158°C;  $^1\text{H}$  RMN (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  3,71 (s, 3H), 3,86 (s, 3H), 7,65 (br s, 1H), 8,01 (br s, 1H).

Preparação 7: 4-amino-3,6-dicloro-5-iodopicolinato de metila



[00323] Dissolveu-se 4-amino-3,6-dicloropicolinato de metila (10,0 g, 45,2 mmol), ácido periódico (3,93 g, 17,2 milimoles (mmol)), e iodo (11,44 g, 45,1 mmol) em metanol (30 mL) e agitou-se sob refluxo a 60°C por 27 h. A mistura de reação foi concentrada, diluída com dietil éter, e lavada duas vezes com bissulfito de sódio aquoso saturado. As camadas aquosas foram extraídas uma vez com éter dietílico, e as camadas orgânicas combinadas foram secadas em sulfato de sódio anido. O produto foi concentrado e purificado por cromatografia flash (sílica-gel, 0-50% acetato de etila/hexano) para fornecer o composto do título como um sólido amarelo claro (12,44 g, 35,9 mmol, 79%): pf 130,0–131,5°C; <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 5,56 (s, 2H), 3,97 (s, 3H); <sup>13</sup>C RMN (101 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 163,80, 153,00, 152,75, 145,63, 112,12, 83,91, 53,21; EIMS *m/z* 346.

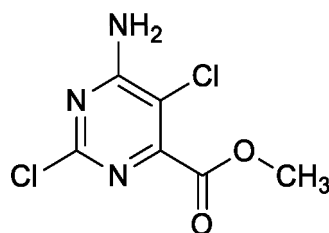
Preparação 8: 4-amino-3,6-dicloro-5-metilpicolinato de metila (Head D)



[00324] Irradiou-se uma mistura de 4-amino-3,6-dicloro-5-iodopicolinato de metila (8,1 g, 23,4 mmol), tetrametilestanano (8,35 g, 46,7 mmol), e cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) (2,5 g, 3,5 mmol) em 1,2-dicloroetano (40 mL) em um microondas iniciador Biotage a 120°C por 30 min, com monitoramento externo da temperatura por sensor infravermelho (IV) lateral. A mistura de reação foi carregada diretamente em um cartucho de sílica-gel e purificada por cromatografia flash (sílica gel, 0-50% acetato de etila/hexanos) para fornecer o composto do título como um sólido laranja (4,53 g, 83 %): pf 133–136°C; <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 4,92 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,29 (s, 3H); <sup>13</sup>C RMN (101 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 164,34, 150,24, 148,69, 143,94,

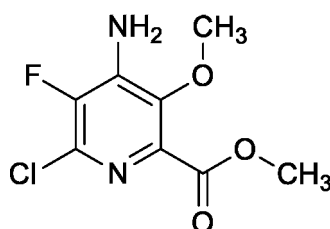
117,01, 114,60, 53,02, 14,40; ESIMS  $m/z$  236 ( $[M+H]^+$ ), 234 ( $[M-H]^-$ ).

[00325] Preparação 9: 6-amino-2,5-dicloropirimidina-4-carboxilato de metila (Head E)



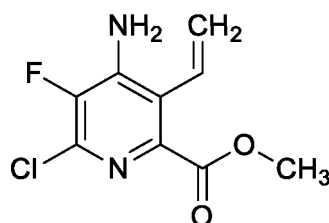
[00326] Preparado como descrito em Epp et al., WO 2007082076 A1.

Preparação 10: 4-amino-6-cloro-5-flúor-3-metoxipicolinato de metila (Head F)



[00327] Preparado como descrito em Epp et al., WO 2013003740 A1.

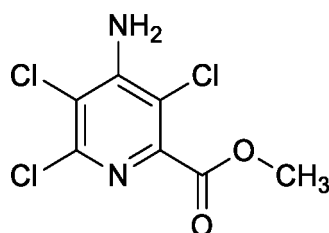
Preparação 11: 4-amino-6-cloro-5-flúor-3-vinilpicolinato de metila (Head G)



[00328] 4-amino-6-cloro-5-flúor-3-iodopicolinato de metila (7,05 g, 21,33 mmol, preparado como descrito em Epp et al., WO 2013003740 A1) e viniltri-*n*-butilestanho (7,52 mL, 25,6 mmol) foram suspensos em dicloroetano (71,1 mL) e a mistura foi desgaseificada com argônio por 10 min. Cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) (1,497 g, 2,133 mmol) foi então adicionado, e a mistura de reação foi agitada a 70°C durante a noite (solução laranja clara). A reação foi monitorada por cromato-

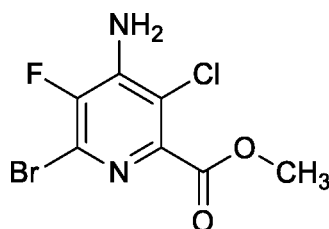
grafia a gás - espectrometria de massa (GC-MS). Após 20 h, a mistura de reação foi concentrada, adsorvida em Celite, e purificada por cromatografia em coluna (sílica-gel (SiO<sub>2</sub>), gradiente hexano/acetato de etila) para obter o composto do título (3,23 g, 65,7 %) como um sólido marrom claro: pf 99–100°C; <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 6,87 (dd, *J* = 18,1, 11,6 Hz, 1H), 5,72 (dd, *J* = 11,5, 1,3 Hz, 1H), 5,52 (dd, *J* = 18,2, 1,3 Hz, 1H), 4,79 (s, 2H), 3,91 (s, 3H); <sup>19</sup>F RMN (376 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -138,79 (s); EIMS *m/z* 230.

Preparação 12: 4-amino-3,5,6-tricloropicolinato de metila (Head H)



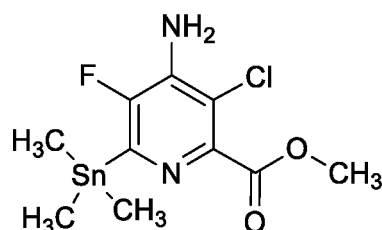
[00329] Preparado como descrito em Finkelstein et al., WO 2006062979 A1.

Preparação 13: 4-amino-6-bromo-3-cloro-5-fluoropicolinato de metila (Head I)



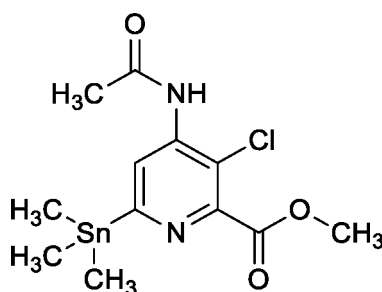
[00330] Preparado como descrito em Arndt et al., US 20120190857 A1.

Preparação 14: 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(trimetilestanil)picolinato de metila (Head J)



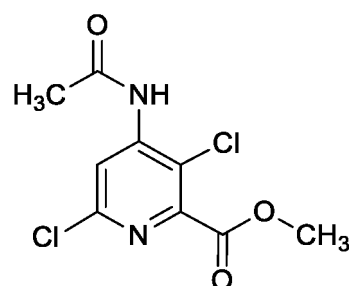
[00331] Combinou-se 4-amino-6-bromo-3-cloro-5-fluoropicolinato de metila (500 mg, 1,8 mmol), 1,1,1,2,2,2-hexametildiestanano (580 mg, 1,8 mmol) e cloreto de bis(trifenilfosfina)-paládio(II) (120 mg, 0,18 mmol) em dioxano seco (6 mL), aspergiu-se com um fluxo de nitrogênio por 10 min e depois aqueceu-se até 80 °C por 2 h. A mistura resfriada foi agitada com acetato de etila (25 mL) e NaCl saturado (25 mL) por 15 min. A fase orgânica foi separada, filtrada através de terra diatomácea, secada (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) e evaporada. O resíduo foi extraído em acetato de etila (4 mL), agitado e tratado em porções com hexano (15 mL). A solução branca leitosa foi decantada de quaisquer sólidos produzidos, filtrada através de lã de vidro e evaporada para originar o composto do título como um sólido esbranquiçado (660 mg, 100%): <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 4,63 (d, *J* = 29.1 Hz, 1H), 3,97 (s, 2H), 0,39 (s, 4H); <sup>19</sup>F RMN (376 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -130,28; EIMS *m/z* 366.

Preparação 15: 4-acetamido-3-cloro-6-(trimetilestanil)-picolinato de metila (Head K)



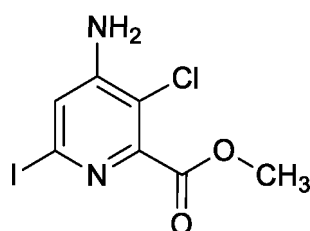
[00332] Preparado como descrito em Balko et al., WO 2003011853 A1.

Preparação 16: 4-acetamido-3,6-dicloropicolinato de metila (Head L)



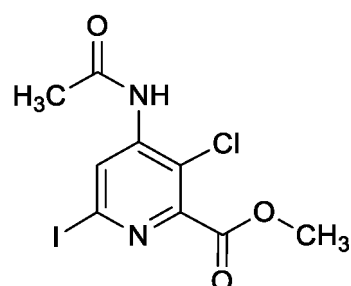
[00333] Preparado como descrito em Fields et al., WO 2001051468 A1.

Preparação 17: 4-amino-3-cloro-6-iodopicolinato de metila (Head M)



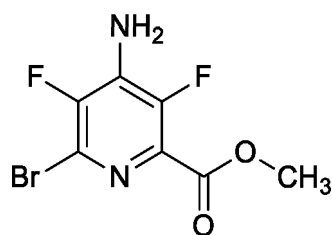
[00334] Preparado como descrito em Balko et al., WO 2007082098 A2.

Preparação 18: 4-acetamida-3-cloro-6-iodopicolinato de metila (Head N)



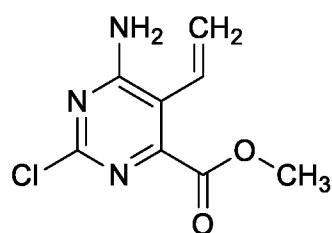
[00335] Preparado como descrito em Balko et al., WO 2007082098 A2.

Preparação 19: 4-amino-6-bromo-3,5-difluoropicolinato de metila (Head O)



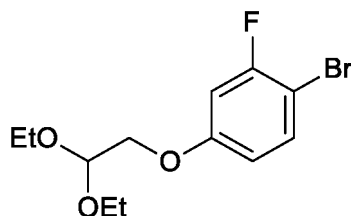
[00336] Preparado como descrito em Fields et al., WO 2001051468 A1.

Preparação 20: 6-amino-2-cloro-5-vinilpirimidina-4-carboxilato de metila (Head P)



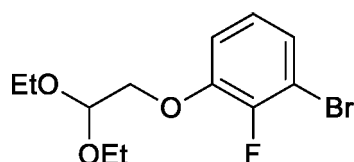
[00337] Preparado como descrito em Epp et al., US 20090088322.

Preparação 21: 1-bromo-4-(2,2-dietoxietóxi)-2-fluorbenzeno



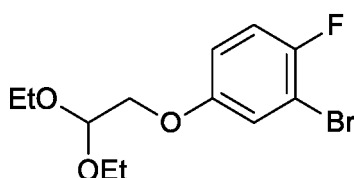
[00338] Dissolveu-se 4-bromo-3-fluorfenol (7 g, 0,03665 mol) e carbonato de potássio (7,6 g, 0,055 mol) em *N,N*-dimetilformamida (9 mL). Adicionou-se 2-bromo-1,1-dietoxietano (8,5 mL, 0,055 mol) e a mistura de reação foi agitada e aquecida a 135°C por 7 h. O solvente foi removido depois da reação ter sido completada. O resíduo foi dissolvido em acetato de etila e lavado com solução de NaOH 2M. A fase orgânica foi secada em Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>. O solvente foi evaporado para produzir 1-bromo-4-(2,2-dietoxietóxi)-2-fluorbenzeno como um óleo (11,4 g, 100%).

Preparação 22: 1-bromo-3-(2,2-dietoxietóxi)-2-fluorbenzeno



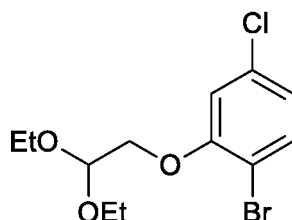
[00339] 1-bromo-3-(2,2-dietoxietóxi)-2-fluorbenzeno foi preparado a partir de 3-bromo-2-fluorfenol conforme descrito na preparação 21.

Preparação 23: 2-bromo-4-(2,2-dietoxietóxi)-1-fluorbenzeno



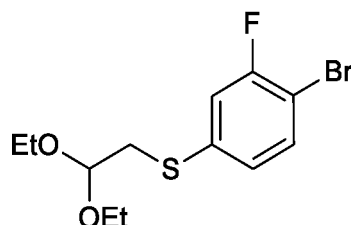
[00340] 2-bromo-4-(2,2-dietoxietóxi)-1-fluorbenzeno foi preparado a partir de 3-bromo-4-fluorfenol conforme descrito na preparação 21.

Preparação 24: 1-bromo-4-cloro-2-(2,2-dietoxietóxi)benzeno



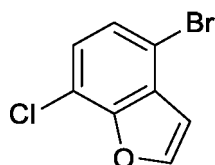
[00341] 1-bromo-4-cloro-2-(2,2-dietoxietóxi)benzeno foi preparado a partir de 2-bromo-5-clorofenol conforme descrito na preparação 21.

Preparação 25: (4-bromo-3-fluorfenil)(2,2-dietoxietil)sulfano



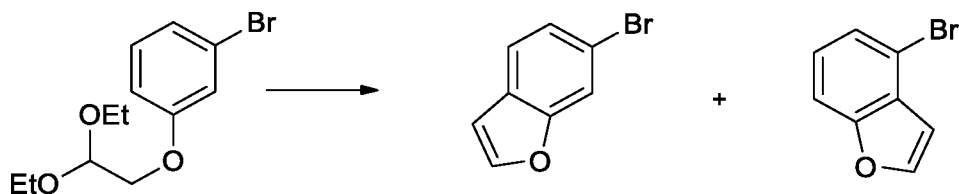
[00342] (4-bromo-3-fluorfenil)(2,2-dietoxietil)sulfano foi preparado a partir de 4-bromo-3-fluorbenzenotiol conforme descrito na preparação 21.

Preparação 26: 4-bromo-7-clorobenzofurano



[00343] A 80 mL de benzeno adicionou-se ácido polifosfórico (3,47 g, 36,9 mmol) e 2-(5-bromo-2-clorofenóxi)acetaldeído (9,2 g, 36,9 mmol) comercialmente disponível e separou-se em oito frascos de 20 mL contendo quantidades iguais. Os frascos foram aquecidos a uma temperatura externa de 90°C por 4 dias. Mediante resfriamento da reação, o benzeno foi removido por decantação. À solução orgânica adicionou-se Celite (50 g) e o solvente foi removido usando um evaporador rotativo. A Celite impregnada foi carregada em um sistema de purificação Teledyne-Isco e purificada por cromatografia em sílica-gel usando 0-30% de acetato de etila:hexanos para originar 4-bromo-7-clorobenzofurano como um sólido branco (2,7 g, 32%):  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,73 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1H), 7,33 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1H), 7,18 (d,  $J = 8,3$  Hz, 1H), 6,85 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1H);  $^{13}\text{C}$  RMN (101 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  150,38 (s), 146,14 (s), 130,27 (s), 126,56 (s), 125,32 (s), 116,44 (s), 112,49 (s), 107,71 (s); ESIMS  $m/z$  232 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ), 230 ( $[\text{M}-\text{H}]^-$ ).

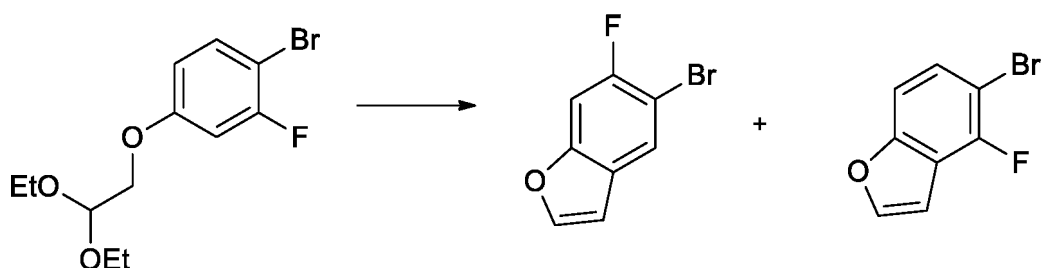
Preparação 27: 6-bromobenzofurano e 4-bromobenzofurano



[00344] 6-bromobenzofurano e 4-bromobenzofurano foram preparados como descrito em US20040147559 a partir de 1-bromo-3-(2,2-dietoxietóxi)benzeno.

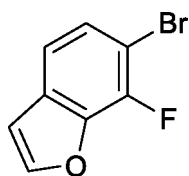
Preparação 28: 5-bromo-6-fluorbenzofurano e 5-bromo-4-fluorbenzofurano

86/175



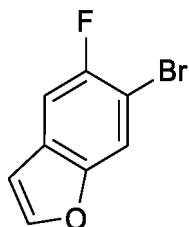
[00345] Dissolveu-se 1-bromo-4-(2,2-dietoxietóxi)-2-fluorbenzeno (11,4 g, 0,037 mol) em tolueno (78 mp). Adicionou-se ácido polifosfórico (11,9 g) e a mistura foi aquecida por 5 h até o refluxo. O solvente foi removido e o resíduo foi diluído com água e acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com solução de NaOH 2M e depois secada em Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>. A mistura de 5-bromo-6-fluorbenzofurano e 5-bromo-4-fluorbenzofurano (4,8 g, 60,3%) foi obtida como uma mistura após purificação via coluna cromatográfica.

Preparação 29: 6-bromo-7-fluorbenzofurano



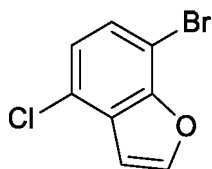
[00346] 6-bromo-7-fluorbenzofurano foi preparado a partir de 1-bromo-3-(2,2-dietoxietóxi)-2-fluorbenzeno como descrito na Preparação 28: ESIMS *m/z* 216 ([M+H]<sup>+</sup>).

Preparação 30: 6-bromo-5-fluorbenzofurano



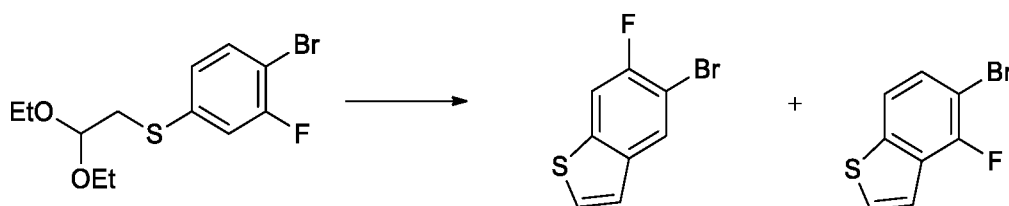
[00347] 6-Bromo-5-fluorbenzofurano foi preparado a partir de 2-bromo-4-(2,2-dietoxietóxi)-1-fluorbenzeno conforme descrito na Preparação 28: ESIMS *m/z* 216 ([M+H]<sup>+</sup>).

Preparação 31: 7-bromo-4-clorobenzofurano



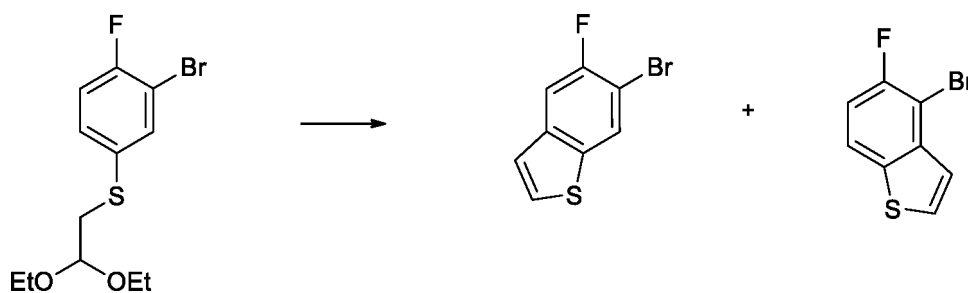
[00348] 7-bromo-4-clorobenzofurano foi preparado a partir de 1-bromo-4-cloro-2-(2,2-dietoxietóxi)benzeno como descrito na Preparação 28: ESIMS  $m/z$  232 ( $[M+H]^+$ ).

Preparação 32: 5-bromo-4-fluorbenzo[*b*]tiofeno e 5-bromo-6-fluorbenzo[*b*]tiofeno



[00349] Ácido polifosfórico (13,9 g) foi agitado em clorobenzeno (50 mL) a 130°C. Adicionou-se gota a gota (4-bromo-3-fluorfenil)(2,2-dietoxietil)sulfana (7,7 g, 0,0238 mol) em clorobenzeno (15,4 mL) a 130°C. A mistura foi então agitada a 130°C por 10 h. O solvente foi removido e o resíduo foi extraído com tolueno, hexano e, então água. A fase orgânica foi combinada e lavada com solução saturada de bicarbonato de sódio ( $\text{NaHCO}_3$ ) e salmoura e, depois secada em  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ . Os produtos 5-bromo-4-fluorbenzo[*b*]tiofeno e 5-bromo-6-fluorbenzo[*b*]tiofeno foram obtidos após purificação via coluna cromatográfica (3,6 g, 65,5%).

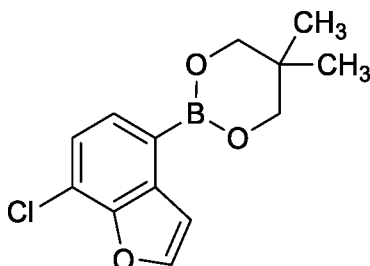
Preparação 33: 6-bromo-5-fluorbenzo[*b*]tiofeno e 4-bromo-5-fluorbenzo[*b*]tiofeno



[00350] 6-bromo-5-fluorbenzo[*b*]tiofeno e 4-bromo-5-fluorben-

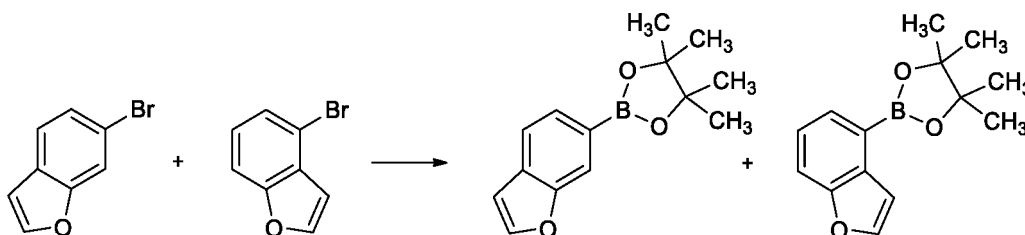
zo[b]tiofeno foram preparados a partir de (3-bromo-4-fluorfenil)(2,2-dietoxietil)sulfano conforme descrito na Preparação 32: ESIMS  $m/z$  232 ( $[M+H]^+$ ).

Preparação 34: 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinano



[00351] 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinano foi preparado como descrito na preparação 55 a partir de 4-bromo-7-clorobenzofurano (preparado como descrito em WO2005056015) para conseguir um sólido branco (66%): IR ( $\text{cm}^{-1}$ ) 669,18, 701,26, 741,33, 792,08, 773,25, 842,53, 811,66, 863,44, 876,27, 884,51, 953,31, 993,58, 1027,34, 1132,28, 1059,34, 1157,92, 1217,21, 1207,86, 1253,95, 1238,65, 1302,38, 1266,72, 1359,16, 1335,94, 1370,05, 1422,73, 1438,38, 1480,37, 1577,30, 1602,05, 2903,59, 2871,91, 2940,30, 2955,31, 3140,15, 3161,21;  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,69 (d,  $J = 2,1$  Hz, 1H), 7,63 (d,  $J = 7,8$  Hz, 1H), 7,28 (dd,  $J = 6,7, 2,6$  Hz, 1H), 7,27 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1H), 3,82 (s, 4H), 1,05 (s, 6H); ESIMS  $m/z$  265 ( $[M+H]^+$ ), 263( $[M-H]^-$ ).

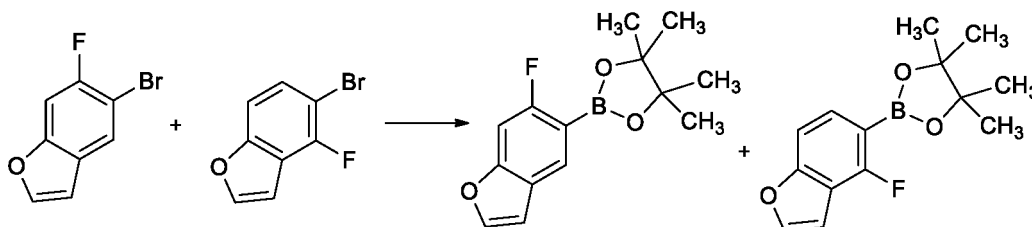
Preparação 35: 2-(benzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(benzofuran-4-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



[00352] 2-(benzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(benzofuran-4-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano foram prepa-

rados como descrito na Preparação 55 a partir de 4-bromobenzofurano e 6-bromobenzofurano para obter a mistura como um óleo limpo (48%):  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,97 (s, 1H), 7,72 – 7,68 (m, 1H), 7,66 (dd,  $J = 4,9, 2,6$  Hz, 2H), 7,60 (dd,  $J = 8,0, 5,2$  Hz, 2H), 7,30 (dd,  $J = 7,1, 6,2$  Hz, 1H), 7,28 – 7,21 (m, 2H), 6,77 (dd,  $J = 2,1, 0,8$  Hz, 1H), 1,37 (d,  $J = 6,2$  Hz, 22H), 1,29 – 1,22 (m, 8H);  $^{13}\text{C}$  RMN (101 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  146,01, 145,21, 130,19, 130,11, 128,76, 123,56, 120,60, 117,60, 114,05, 108,45, 106,63, 83,82, 83,69, 83,50, 25,02, 24,98, 24,88; ESIMS  $m/z$  245 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ), 243( $[\text{M}-\text{H}]^-$ ).

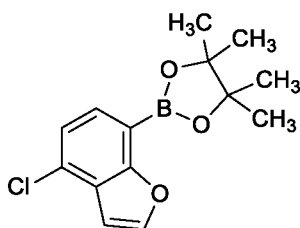
Preparação 36: 2-(6-fluorbenzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(4-fluorbenzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



[00353] Uma mistura de 5-bromo-6-fluorbenzofurano e 5-bromo-4-fluorbenzofurano (1 equivalente combinado), acetato de potássio (KOAc; 3 eq) e bis(pinacolato) diborona (1,2 eq) foram agitados em dioxano (0,1 M com respeito a mistura de 5-bromo-6-fluorbenzofurano e 5-bromo-4-fluorbenzofurano) sob fluxo de nitrogênio por 30 min. O catalisador [1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]dicloropaládio(II) ( $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ ; 0,15 eq) foi adicionado e o fluxo de nitrogênio foi mantido por 10 min. A mistura de reação foi aquecida a  $85^\circ\text{C}$  durante a noite. O solvente foi removido, o resíduo foi dissolvido em cloreto de metileno e o sólido foi filtrado. O produto filtrado foi concentrado e purificado através de uma coluna para originar uma mistura de 2-(6-fluorbenzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(4-fluorbenzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (63%):  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,98 (d,  $J = 5,7$  Hz, 1H), 7,59 (d,  $J = 2,1$  Hz, 1H), 7,18 (d,  $J = 9,4$  Hz, 1H), 6,73 (d,  $J = 1,3$  Hz,

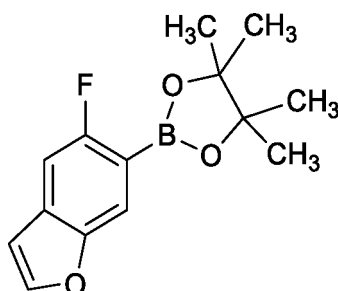
1H), 1,38 (s, 12H);  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,81 (d,  $J = 7,0$  Hz, 1H), 7,37 (t,  $J = 7,4$  Hz, 1H), 7,30 (d,  $J = 8,4$  Hz, 1H), 6,87 (s, 1H), 1,38 (s, 12H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -107,80, -107,81, -107,82, -107,84, -108,47, -108,48; ESIMS  $m/z$  262 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Preparação 37: 2-(4-clorobenzofuran-7-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



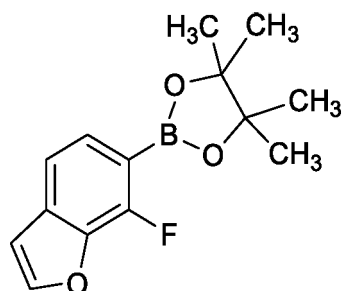
[00354] 2-(4-Clorobenzofuran-7-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano foi preparado como descrito na Preparação 36 a partir de 7-bromo-4-clorobenzofurano:  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,75 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1H), 7,67 (d,  $J = 7,8$  Hz, 1H), 7,24 (d,  $J = 7,8$  Hz, 1H), 6,86 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1H), 1,41 (s, 12H); ESIMS  $m/z$  278 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Preparação 38: 2-(5-fluorbenzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



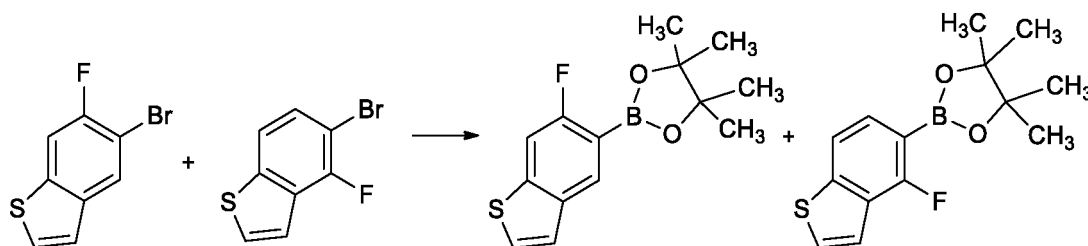
[00355] 2-(5-fluorbenzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano foi preparado como descrito na Preparação 36 de 6-bromo-5-fluorbenzofurano :  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,85 (d,  $J = 4,3$  Hz, 1H), 7,68 (d,  $J = 2,2$  Hz, 1H), 7,24 – 7,20 (m, 1H), 6,75 – 6,70 (m, 1H), 1,38 (s, 12H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -110,23 (dd,  $J = 9,6, 4,1$  Hz); ESIMS  $m/z$  262 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

Preparação 39: 2-(7-fluorbenzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



[00356] 2-(7-fluorbenzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano foi preparado como descrito na Preparação 36 de 6-bromo-7-fluorbenzofurano :  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,68 (t,  $J = 3,1$  Hz, 1H), 7,55 (dd,  $J = 7,8, 4,5$  Hz, 1H), 7,34 (t,  $J = 6,5$  Hz, 1H), 6,80 (dd,  $J = 2,9, 2,2$  Hz, 1H), 1,38 (s, 12H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -127,62 (dd,  $J = 4,2, 3,1$  Hz); ESIMS  $m/z$  262 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

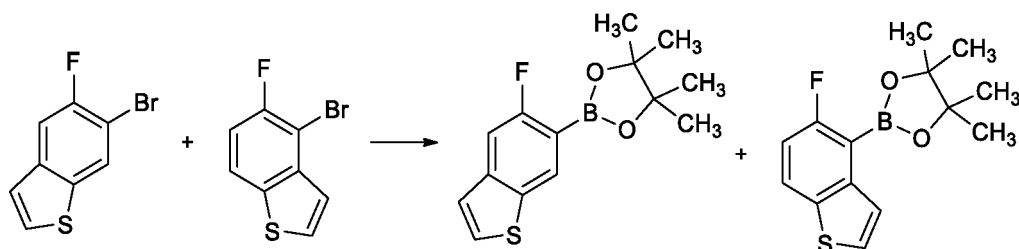
Preparação 40: 2-(6-fluorbenzo[*b*]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(4-fluorbenzo[*b*]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



[00357] 2-(6-fluorbenzo[*b*]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(4-fluorbenzo[*b*]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano foram preparados como descrito na Preparação 36 a partir de 5-bromo-4-fluorbenzo[*b*]tiofeno e 5-bromo-6-fluorbenzo[*b*]tiofeno:  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,20 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 7,53 (d,  $J = 9,3$  Hz, 1H), 7,35 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 7,30 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 1,39 (s, 12H);  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,69 – 7,61 (m, 2H), 7,47 (d,  $J = 5,6$  Hz, 1H), 7,39 (d,  $J = 5,6$  Hz, 1H), 1,39 (s, 12H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -107,24, -109,56; ESIMS  $m/z$  278 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

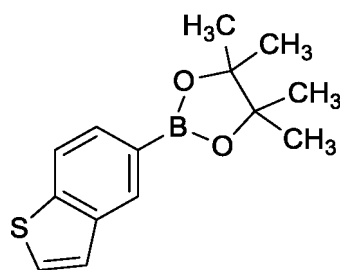
Preparação 41: 2-(5-fluorbenzo[*b*]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(5-fluorbenzo[*b*]tiofen-4-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-

dioxaborolano



[00358] 2-(5-fluorbenzo[*b*]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano e 2-(5-fluorbenzo[*b*]tiofen-4-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano foram preparados como descrito na Preparação 36 a partir de 6-bromo-5-fluorbenzo[*b*]tiofeno e 4-bromo-5-fluorbenzo[*b*]tiofeno:  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,26 (d,  $J = 5,1$  Hz, 1H), 7,59 (d,  $J = 5,4$  Hz, 1H), 7,45 (d,  $J = 9,9$  Hz, 1H), 7,28 (d,  $J = 5,4$  Hz, 1H), 1,39 (s, 12H);  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,92 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 7,88 (dd,  $J = 8,8, 4,9$  Hz, 1H), 7,55 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 7,07 (t,  $J = 9,1$  Hz, 1H), 1,42 (s, 12H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -107,32, -107,34, -107,35, -107,36, -111,00, -111,02, -111,02, -111,03, -111,04, -111,04; ESIMS  $m/z$  278 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ).

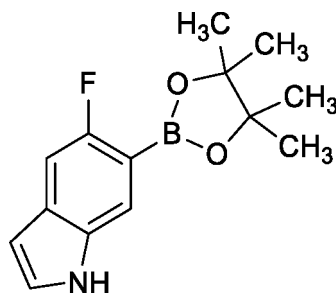
Preparação 42: 2-(benzo[*b*]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



[00359] 6-bromobenzo[*b*]tiofeno (3,09 g, 14,5 mmol), 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bi(1,3,2-dioxaborolano) (4,42 g, 17,4 mmol),  $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$  (0,54 g, 0,74 mmol), e  $\text{KOAc}$  (2,89 g, 29,4 mmol) em dioxano anidro (48 mL) foram agitados sob refluxo a  $80^\circ\text{C}$  por 4 h. A mistura de reação foi resfriada e diluída com acetato de etila, filtrada através de uma almofada de Celite, e lavada com salmoura. A camada aquosa foi extraída com acetato de etila. As camadas orgânicas foram

secadas, filtradas e adsorvidas em sílica gel. Purificação por cromatografia por flasheamento (0 – 30% acetato de etila /hexanos) forneceram 2-(benzo[*b*]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (3,266 g, 87%) como um sólido amarelo oleoso:  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8,38 (d,  $J = 0,7$  Hz, 1H), 7,79 (ddd,  $J = 20,2, 8,0, 0,8$  Hz, 2H), 7,51 (d,  $J = 5,5$  Hz, 1H), 7,34 (dd,  $J = 5,4, 0,7$  Hz, 1H), 1,37 (s, 12H);  $^{13}\text{C}$  RMN (101 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  141,78, 129,75, 129,58, 128,18, 123,87, 122,94, 83,89, 24,92; EIMS  $m/z$  260.

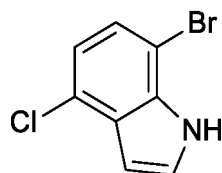
Preparação 43: 5-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1*H*-indol



[00360] A um frasco de fundo redondo, carregou-se 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bi(1,3,2-dioxaborolano) (1,424 g, 5,61 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno] dicloropaládio (II) (0,342 g, 0,467 mmol), e acetato de potássio (0,917 g, 9,34 mmol) como sólidos. O frasco foi selado e bombeado e purgado (3x) com gás inerte. Depois adicionou-se 6-bromo-5-flúor-1*H*-indol (1,0 g, 4,67 mmol) em dioxano (15,57 mL). A mistura de reação foi agitada e aquecida até uma temperatura interna de 85°C. Após 18 h a mistura de reação foi resfriada e filtrada através de uma almofada de Celite, e lavada com excesso de acetato de etila. O produto filtrado foi diluído com água e dividido. A camada aquosa foi extraída com acetato de etila (3 x 15 mL). As camadas orgânicas combinadas foram secadas em  $\text{MgSO}_4$ , filtradas e concentradas *in vacuo*. O produto bruto foi purificado usando um sistema de purificação Teledyne ISCO com um sistema gradiente de eluente de acetato de etila e hexanos para produzir o composto do título

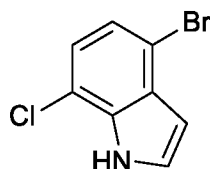
como um sólido de cor pêssego (656 mg, 54%):  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  1,31 (s, 12H), 6,42 (ddd,  $J = 2,9, 1,9, 0,9$  Hz, 1H), 7,22 (d,  $J = 10,5$  Hz, 1H), 7,52 (t,  $J = 2,8$  Hz, 1H), 7,69 (d,  $J = 4,8$  Hz, 1H), 11,24 (s, 1H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  -116,07; ESIMS  $m/z$  262.0 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ), 260,0 ( $[\text{M}-\text{H}]^-$ ).

Preparação 44: 7-bromo-4-cloro-1H-indol



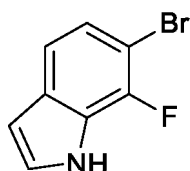
[00361] A uma solução de 1-bromo-4-cloro-2-nitrobenzeno (932 mg, 3,95 mmol) em tetra-hidrofurano (10 mL), brometo de vinilmagnésio (0,7 M em tetra-hidrofurano; 12 mmol) em tetra-hidrofurano (15 mL) adicionou-se gota a gota a  $-40$  °C. Após 1 h a mistura de reação foi entornada em cloreto de amônio saturado ( $\text{NH}_4\text{Cl}$ ). A camada orgânica resultante foi concentrada. O resíduo resultante foi purificado usando um sistema de cromatografia Teledyne ISCO com um sistema eluente gradiente de 2% de acetato de etila em hexano para produzir o composto do título (400 mg, 44%):  $^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  6,73 (t,  $J = 2,8$  Hz, 1H), 7,02 (d,  $J = 8,1$  Hz, 1H), 7,19 – 7,39 (m, 2H), 8,43 (s, 1H).

Preparação 45: 4-bromo-7-cloro-1H-indol



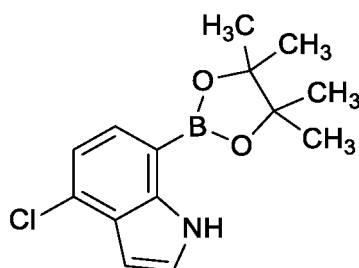
[00362] 4-bromo-7-cloro-1H-indol foi preparado a partir de 4-bromo-1-cloro-2-nitrobenzeno conforme descrito na Preparação 44:  $^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  6,49 – 6,74 (m, 1H), 7,07 (d,  $J = 8,1$  Hz, 1H), 7,15 – 7,42 (m, 2H), 8,49 (s, 1H).

Preparação 46: 6-bromo-7-flúor-1H-indol



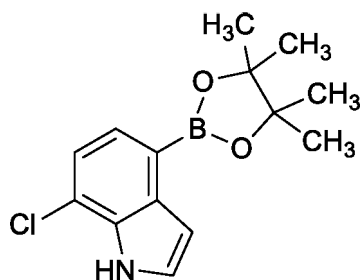
[00363] 6-Bromo-7-flúor-1*H*-indol foi preparado a partir de 1-bromo-2-flúor-3-nitrobenzeno como descrito na Preparação 44 (250 mg, 25.2%): <sup>1</sup>H RMN (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 6,52 – 6,62 (m, 1H), 7,13 – 7,34 (m, 3H), 8,38 (s, 1H); ESIMS *m/z* 215,0 ([M+H]<sup>+</sup>).

Preparação 47: (Exemplo precursor 1): 4-cloro-7-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1*H*-indol



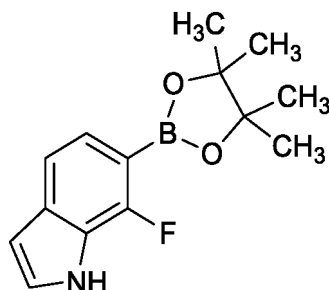
[00364] A uma solução de 7-bromo-4-cloro-1*H*-indol (8 g, 0,03 mol) em dioxano, carregou-se KOAc (9,8 g, 0,1 mol), dicloro[1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]-paládio(II) (2,19 g, 0,003 mol), e 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bi(1,3,2-dioxaborolano) (13,2 g, 0,052 mol) como sólidos. A mistura de reação foi colocada sob atmosfera inerte e o frasco foi selado. A reação foi aquecida a 100 °C por 16 h. A mistura de reação foi então tratada com H<sub>2</sub>O e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi dividida e concentrada. O resíduo resultante foi purificado usando um sistema de cromatografia Teledyne ISCO com um sistema de gradiente de eluente de acetato de etila em hexano para produzir o composto do título (1,3 g, 15,6%): <sup>1</sup>H RMN (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 1,40 (s, 12H), 6,58 – 6,73 (m, 1H), 7,14 (d, *J* = 7,6 Hz, 1H), 7,28 – 7,36 (m, 1H), 7,56 (d, *J* = 7,6 Hz, 1H), 9,34 (s, 1H).

Preparação 48: 7-cloro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1*H*-indol



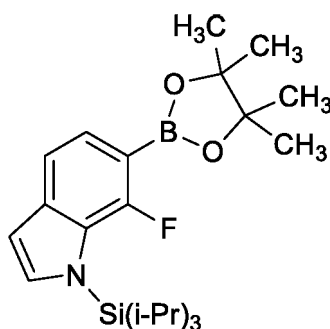
[00365] 7-cloro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1*H*-indol foi preparado como descrito na Preparação 47 a partir de 4-bromo-7-cloro-1*H*-indol (4,2 g, 43,7%):  $^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,38 (s, 26H), 7,08 (dd,  $J = 3,2, 2,2$  Hz, 1H), 7,20 (d,  $J = 7,6$  Hz, 1H), 7,30 (t,  $J = 2,8$  Hz, 1H), 7,56 (d,  $J = 7,6$  Hz, 1H), 8,40 (s, 1H).

Preparação 49 (Exemplo Precursor 2): 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1*H*-indol



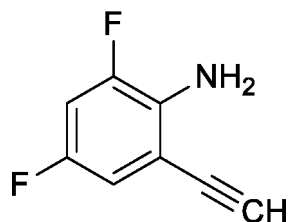
[00366] 7-Flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1*H*-indol foi preparado como descrito na Preparação 47 a partir de 6-bromo-7-flúor-1*H*-indol (150 mg, 45,5%):  $^1\text{H}$  RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1,26 (s, 25H), 1,39 (s, 24H), 7,27 (d,  $J = 4,5$  Hz, 2H), 7,40 (d,  $J = 2,6$  Hz, 2H), 8,43 (s, 1H);  $^{19}\text{F}$  RMN (282 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -124,52;  $^{13}\text{C}$  RMN (101 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  24,87 (d,  $J = 15,9$  Hz), 77,30, 83,49 (d,  $J = 6,9$  Hz), 103,25, 115,98 (d,  $J = 3,3$  Hz), 126,08 (d,  $J = 7,7$  Hz).

Preparação 50 (Exemplo Precursor 3): 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1-(triisopropilsilil)-1*H*-indol



[00367] 7-Flúor-1-(triisopropilsilil)-1*H*-indol (4,0 g, 14 mmol) (Preparado de acordo com M. Schlosser, et al., *Eur. J. Org. Chem.* 2006, 2956–2969) foi dissolvido em 30 mL de THF seco, resfriado a -75 °C, tratado em porções com *sec*-butil lítio (10 mL, 1,4 M, 14 mmol) e agitado por 2 h a -75 °C. 2-isopropóxi-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (3,0 mL, 2,7 g, 14 mmol) foi adicionado em porções e a mistura foi agitada por 1 h a -75 °C. O banho de resfriamento foi removido e permitiu-se que a temperatura se elevasse para 5 °C em 30 min. A reação foi temperada por adição de 5 mL de NH<sub>4</sub>Cl saturado e dividida entre acetato de etila e água. A fase orgânica foi lavada com cloreto de sódio saturado (NaCl), secada com (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), evaporada em sílica gel, e purificada por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>; eluindo com hexanos) para produzir o composto do título como um óleo espesso (4,2 g, 73%): <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,43 (dd, *J* = 7,9, 4,6 Hz, 1H), 7,38 (m, 2H), 1,75 (m, 3H), 1,38 (s, 12H), 1,13 (d, *J* = 7,6 Hz, 18H); <sup>19</sup>F RMN (376 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -113,07; EIMS *m/z* 417.

#### Preparação 51: 2-etinil-4,6-difluoranilina

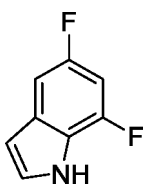


[00368] Etapa 1: 2-bromo-4,6-difluoranilina (10 g, 48 mmol), iodeto de cobre (I) (CuI; 180 mg, 0,96 mmol), cloreto de bis(trifenilfosfina) paládio(II) (680 mg, 0,96 mmol) e etiniltrimetilsilano (7,1 g, 72 mmol) fo-

ram combinados com 10 mL de DMF seco e aquecidos a 50°C por 18 h. 2 mL adicionais de etiniltrimetilsilano, 200 mg de cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II), e 60 mg de CuI foram adicionados e o aquecimento foi continuado por 4 h. Após o resfriamento, a mistura foi diluída com acetato de etila e agitada com ácido clorídrico (HCl) 1 normal (N). A mistura escura foi filtrada através de Celite para remover sólidos finos. A fase orgânica foi lavada com água, NaCl saturado, secada e concentrada. A purificação por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>, eluindo com 0-20% de EtOAc em hexanos) proporcionou 9 g do material que consistiu de uma proporção de 70/30 do derivado de TMS alquina e o brometo de partida.

[00369] Etapa 2: A mistura foi levada à dessililação sem maior purificação. O derivado TMS foi dissolvido em metanol (500 mL) e tratado com 8,5 g de KF. Formou-se uma solução que foi agitada durante a noite à temperatura ambiente (RT). A maior parte dos voláteis foi removida sob vácuo, o resíduo foi extraído em acetato de etila e lavado com água e com NaCl saturado. A solução foi secada, evaporada e purificada por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>, eluindo com 0-10% de acetato de etila em hexanos) para fornecer o composto do título (4,2 g, 70 % área pura por cromatografia a gás com detector por ionização por chama. Cromatografia a gás com detector (FID-GC)): <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 6,83 (m, 1H), 4,13 (m, 1H), 3,46 (s, 1H); <sup>19</sup>F RMN (376 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -124,04, -124,88, -126,94, -130,08; EIMS *m/z* 153. Este material foi levado para a etapa de ciclização sem maior purificação.

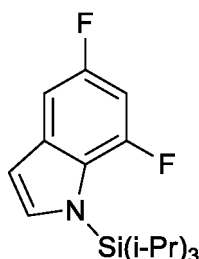
Preparação 52: 5,7-difluór-1H-indol



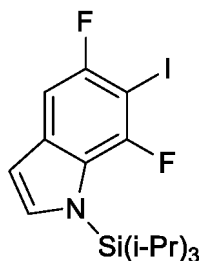
[00370] A 2-etinil-4,6-difluoranilina (4,2 g, 19 mmol) impura da preparação prévia foi dissolvida em etanol (75 mL), tratada com di-hidrato

de cloreto de sódio ouro(III) (310 mg, 0,77 mmol) e agitada por 3 h sob uma atmosfera de nitrogênio. A mistura foi concentrada, extraída em acetato de etila, lavada com água, lavada com NaCl saturado, secada em sulfato de sódio (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) e evaporada. Purificação por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>, 100-200 malha; eluindo com 0-15% EtOAc em hexanos contendo ácido acético 2%) forneceu o produto título (2,0 g, cerca de 85% de pureza): <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8,32 (s, 1H), 7,26 (dd, *J* = 4,8, 2,0 Hz, 1H), 7,09 (dd, *J* = 9,1, 2,2 Hz, 1H), 6,74 (ddd, *J* = 11,2, 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,55 (td, *J* = 3,3, 2,2 Hz, 1H); <sup>19</sup>F RMN (376 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -122,11, -131,96; EIMS *m/z* 153.

Preparação 53: 5,7-difluór-1-(triisopropilsilil)-1*H*-indol



[00371] Adicionou-se *N*-butil lítio (2,7 mL, 2,5 M, 6,9 mmol) a 10 mL de THF seco a -70°C. Adicionou-se 5,7-difluór-1*H*-indol (1,0 g, 6,5 mmol) em 5 mL de THF em porções para a solução e a mistura foi agitada por 30 min a -75°C. Adicionou-se triisopropilclorosilano (1,5 mL, 1,3 g, 6,9 mmol), a agitação foi continuada por 1 h a -75 °C e depois permitiu-se que a mistura se aquecesse até -5°C por 2 h. Depois do tratamento com 5 mL de NH<sub>4</sub>Cl saturado, a mistura foi misturada com 30 mL de éter e a fase orgânica foi lavada com 5 mL de NaCl saturado, secada (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) e evaporada. O produto foi purificado por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>; hexanos) para fornecer o composto do título como um óleo claro (1,5 g; 74%): <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7,35 (d, *J* = 3,1 Hz, 1H), 7,07 (dd, *J* = 8,7, 2,3 Hz, 1H), 6,69 (m, 1H), 6,59 (t, *J* = 3,1 Hz, 1H), 1,67 (m, 3H), 1,13 (d, *J* = 7,6 Hz, 18H); <sup>19</sup>F RMN (376 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -120,64, -120,65, -122,49, -122,49; EIMS *m/z* 309.

Preparação 54: 5,7-diflúor-6-iodo-1-(triisopropilsilil)-1*H*-indol

[00372] 5,7-Diflúor-1-(triisopropilsilil)-1*H*-indol (1,4 g, 4,5 mmol) e pentametildietileno –triamina (830 mg, 4,8 mmol) foram combinados em 10 mL de THF seco, resfriados a  $-70^{\circ}\text{C}$  e tratados em porções com *sec*-butil lítio (3,4 mL, 1,4 M, 4,8 mmol) e agitados por 3 h a esta temperatura. Iodo (1,3 g, 5,0 mmol) em 5 mL de THF foi adicionado, a mistura foi agitada por 50 min, temperada por adição de 3 mL de  $\text{NH}_4\text{Cl}$  saturado e dividida entre dietil éter e água. A fase orgânica foi lavada com  $\text{NaCl}$  saturado, secada ( $\text{Na}_2\text{SO}_4$ ), evaporada e purificada por cromatografia flash ( $\text{SiO}_2$ ; hexanos) para fornecer o composto do título como um óleo claro que solidificou em repouso (1,9 g, 90%): pf  $74\text{--}76^{\circ}\text{C}$ ;  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,34 (d,  $J = 3,1$  Hz, 1H), 7,14 (dd,  $J = 7,7, 0,9$  Hz, 1H), 6,60 (t,  $J = 3,1$  Hz, 1H), 1,67 (m, 3H), 1,13 (d,  $J = 7,6$  Hz, 18H);  $^{19}\text{F}$  RMN (376 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$   $-101,37, -105,33$ .

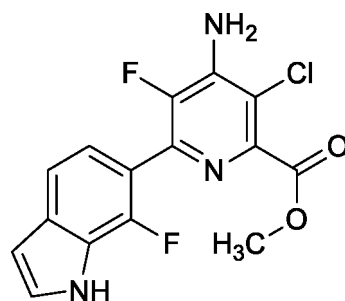
[0046] Preparação 55: 2-(2,2-dimetilbenzo[d][1,3]dioxol-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano

[00373] Adicionou-se a DMSO (10mL) acetato de potássio (1,671 g, 17,03 mmol), 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bi(1,3,2-dioxaborolano) (1,729 g, 6,81 mmol), 5-bromo-2,2-dimetilbenzo[d][1,3]dioxol (1,3 g, 5,68 mmol), e  $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$  (0,415 g, 0,568 mmol). A reação foi aquecida a uma temperatura externa de  $80^{\circ}\text{C}$  por 18 horas. Com resfriamento, a reação foi entornada em 50 mL de água gelada. A mistura de água gelada foi transferida a um funil separatório e foram completadas duas extrações com EtOAc (50 mL). As camadas orgânicas foram combinadas, secadas em  $\text{Na}_2\text{SO}_4$ , e filtradas. A solução foi concentra-

da em 5 g de celite usando EtOAc como solvente. A celite impregnada foi carregada em um sistema de purificação Teledyne Isco e purificada por cromatografia em sílica-gel empregando 0-30% EtOAc:hexanos para produzir 2-(2,2-dimetilbenzo[d][1,3]dioxol-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (767 mg, 49%) como um semi-sólido vermelho:  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7,31 (dt,  $J = 6,6, 3,3$  Hz, 1H), 7,15 (s, 1H), 6,74 (d,  $J = 7,7$  Hz, 1H), 1,66 (s, 6H), 1,32 (s, 12H);  $^{13}\text{C}$  RMN (101 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  129,21 (s), 113,78 (s), 108,15 (s), 83,59 (s), 25,86 (s), 24,82 (s); ESIMS  $m/z$  277 ( $[\text{M}+\text{H}]^+$ ), 275 ( $[\text{M}-\text{H}]^-$ ).

[0047] EXEMPLOS DE SÍNTESE DE COMPOSTOS DA FÓRMULA (I)

Exemplo 1. 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila (Composto No. 1.14)

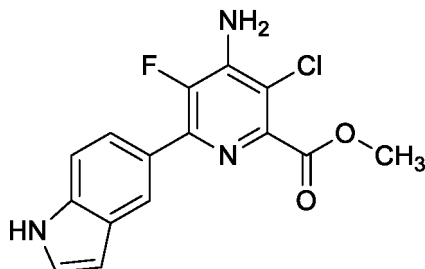


[00374] fluorpicolinato 4-amino-3,6-dicloro-5-fluorpicolinato de metila (0,650 g, 2,72 mmol), 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol (0,817 g, 3,13 mmol), cloreto de bis(trifenilfosfina) paládio(II) (0,191 g, 0,272 mmol), e fluoreto de césio (0,826 g, 5,44 mmol) foram combinados em acetonitrila (4,53 mL) e água (4,53 mL). A mistura de reação foi irradiada em um microondas Iniciador Biotage a 110°C em um frasco lacrado por 30 min. A mistura de reação resfriada foi dividida entre acetato de etila e água. A fase orgânica foi secada e concentrada. O produto foi purificado por cromatografia flash  $\text{SiO}_2$ ; eluído com acetato de etila 5-40% em hexano) para fornecer o composto do título como um sólido branco (0,517 g, 52,4 % de rendimento). Nota: Fluoreto de potássio substituiu fluoreto de césio em alguns exem-

plos que se referem a este exemplo em particular.

[00375] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “Acoplamento 1”.

Exemplo 2: 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(1*H*-indol-5-il)picolinato de metila (Composto No. 1.2)

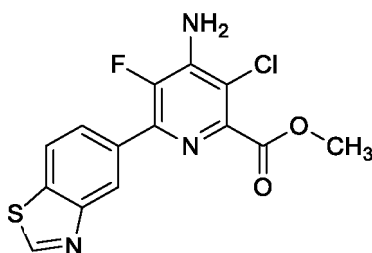


[00376] Ácido 1*H*-Indol-5-ilborônico (220 mg, 1,4 mmol, 1,1 equiv) e 4-amino-3,6-dicloro-5-fluorpicolinato de metila (300 mg, 1,3 mmol, 1,0 equiv) foram adicionados sequencialmente a um vaso de 5 mL de microondas Biotage, seguido por fluoreto de céσιο (380 mg, 2,5 mmol, 2,0 equiv), acetato de paládio(II) (14 mg, 0,063 mmol, 0,05 equiv), e 3,3',3''-fosfinatriiltribenzenossulfonato de sódio (71 mg, 0,13 mmol, 0,10 equiv). Uma mistura 3:1 de água:acetonitrilo (2,5 mL) foi adicionada e a mistura marrom escuro resultante foi colocada em um microondas Biotage e aquecida a 150°C por 5 min, com um sensor IV externo de temperatura monitorando do lado do vaso. A mistura de reação resfriada foi diluída com água (50 mL) e extraída com diclorometano (15 x 30 mL). As camadas orgânicas combinadas foram secadas (sulfato de sódio), filtradas por gravidade e concentradas por evaporação por meio de evaporação rotativa. O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna de fase reversa (gradiente de 5% de acetonitrila a 100% acetonitrila) para originar o composto do título como um pó cor de bronze (290 mg, 73%).

[00377] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “acoplamento 2”.

Exemplo 3: 4-amino-6-(benzo[d]tiazol-5-il)-3-cloro-5-

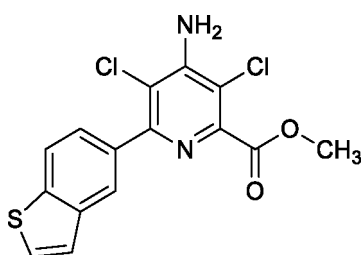
fluorpicolinato de metila (Composto No. 6.1)



[00378] Adicionou-se a um frasco de 5 mL para microondas 4-amino-6-bromo-3-cloro-5-fluoropicolinato de metila (200 mg, 1,0 mmol), ácido benzo[*d*]tiazol-5-ilborônico (237 mg, 1,35 mmol), fluoreto de potássio (KF; 122 mg, 2,12 mmol), TPPTS-Na (tris-(3-sulfonatofenil)-fosfina-4-hidrato de sal de sódio, 67 mg, 0,106 mmol) e Pd(OAc)<sub>2</sub> (11 mg, 0,053 mmol). Subsequentemente, CH<sub>3</sub>CN (1,0 mL) e H<sub>2</sub>O (3,0 mL) foram adicionados, e o frasco de reação foi lacrado e aquecido em um microondas Biotage a 150°C por 5 min, com monitor externo de temperatura com sensor IR ao lado do frasco. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e diluída com diclorometano e lavada com água. Os extratos orgânicos foram combinados, secados (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), filtrados, e concentrados *in vacuo*. O produto bruto foi purificado por trituração com dietila (Et<sub>2</sub>O) para produzir o composto do título como um sólido marrom (172 mg, 51%).

[00379] O método de preparação empregado neste exemplo se refere a “acoplamento 3” na Tabela 10.

Exemplo 4: 4-amino-6-(benzo[*b*]tiofenil-5-il)-3,5-dicloropicolinato de metila (Composto No. 3.1)

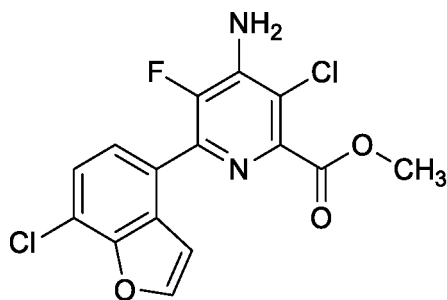


[00380] Adicionou-se a um frasco de microondas de 5 mL 4-amino-3,5,6-tricloropicolinato de metila (0,232 g, 0,909 mmol), 2-(benzo[*b*]tio-

fen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (0,260 g, 0,999 mmol), fluoreto de céσιο (0,276 g, 1,817 mmol) e  $(PPh_3)_2PdCl_2$  (0,064 g, 0,091 mmol). O frasco de reação foi então lacrado e colocado sob atmosfera inerte. Subsequentemente, adicionou-se dioxano (4,0 mL) e  $H_2O$  (1,0 mL) e a mistura de reação foi aquecida em um microondas Biotage a  $120^\circ C$  por 60 min, com sensor externo de temperatura I.V. monitorando do lado do recipiente. A mistura de reação foi resfriada a temperatura ambiente e diluída com acetato de etila (5 mL) e entornada na solução de salmoura. As camadas foram separadas e a fase aquosa foi extraída com acetato de etila (3 x 10 mL). Os extratos orgânicos foram combinados, secados ( $MgSO_4$ ), filtrados, e concentrados *in vacuo*. O produto bruto foi purificado usando um sistema de purificação Teledyne ISCO com um sistema de gradiente de eluente de acetato de etila e hexanos. Maior purificação foi realizada, se necessário, usando um sistema de fase reversa Teledyne ISCO com sistema de gradiente de eluente de acetonitrila e  $H_2O$  para produzir o composto do título como um sólido branco.

[00381] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “acoplamento 4”.

Exemplo 5: 4-amino-3-cloro-6-(7-clorobenzofuran-4-il)-5-fluorpicolinato de metila (Composto No. 2.16)

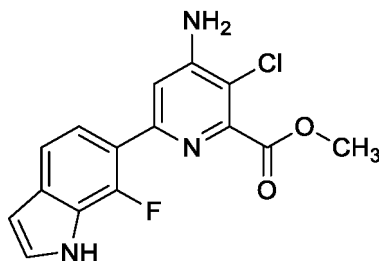


[00382] Fluoreto de potássio (0,365 g, 6,28 mmol), diacetato de paládio (0,047 g, 0,209 mmol), 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinano (0,609 g, 2,301 mmol), tetra-hidrato 3,3',3''-fosfinatriiltribenzenosulfonato de sódio (0,134 g, 0,209 mmol), e fluor-

picolinato 4-amino-3,6-dicloro-5-fluoropicolinato de metila (0,5 g, 2,092 mmol) foram combinados em um frasco de reator de microondas. Adicionou-se a esses água (3 mL) e acetonitrila (1 mL). A mistura de reação foi aquecida a 150°C em um reator de microondas por 6 min. A mistura de reação resfriada foi diluída com acetato de etila e água e filtrada através de um tampão de algodão. A fase orgânica foi secada (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) e concentrada sob vácuo. Purificação por cromatografia de fase reversa forneceu o composto do título como um sólido branco (127 mg, 12,5% de rendimento).

[00383] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “acoplamento 5”.

Exemplo 6: 4-amino-3-cloro-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila (Composto No. 1.22)

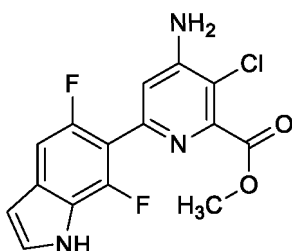


[00384] 4-acetamida-3,6-dicloropicolinato de metila (400 mg, 1,520 mmol), 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol (437 mg, 1,673 mmol), fluoreto de césio (462 mg, 3,04 mmol), e (PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>PdCl<sub>2</sub> (107 mg, 0,152 mmol) foram carregados como sólidos em um frasco de reação de microondas e dioxano (4 mL) e adicionou-se água (1 mL). O vaso de reação foi lacrado e irradiado em um microondas iniciador Biotage a 110°C por 2 h, com sensor I.V. externo de temperatura monitorando do lado. A mistura de reação foi particionada entre acetato de etila e água. A fase orgânica foi filtrada e concentrada. O produto intermediário foi purificado por cromatografia flash (ISCO 40 g de sílica 10-75% EtOAc: Hexanos 16 CV). Frações contendo produto foram combinadas e concentradas pra originar 524 mg de um

sólido branco intermediário 4-acetamido-3-cloro-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila (0,524 g, 1,448 mmol) que foi subsequentemente diluída com metanol (10,0 mL). Depois adicionou-se cloreto de acetila (0,725 mL, 10,20 mmol). Permitiu-se que a mistura de reação agitasse à temperatura ambiente por 18 h. A mistura de reação foi concentrada até a secagem. O resíduo resultante foi dissolvido em acetato de etila e entornado na solução saturada de NaHCO<sub>3</sub>. As camadas foram divididas e a camada aquosa foi extraída com acetato de etila (3 x 15 mL). Os extratos orgânicos foram combinados, lavados com solução saturada de NaCl, secados (MgSO<sub>4</sub>), filtrados e concentrados *in vacuo*. O produto bruto foi purificado usando um sistema de purificação Tele-dyne ISCO com um sistema eluente gradiente de acetato de etila e hexano para produzir o composto do título como um sólido branco (365 mg, 79%).

[00385] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “Acoplamento 6”.

Exemplo 7: 4-amino-3-cloro-6-(5,7-difluor-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila (Composto No. 1.26)

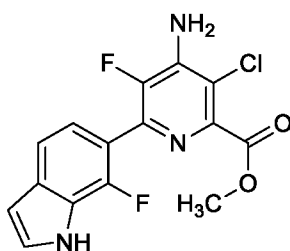


[00386] 5,7-difluor-6-iodo-1-(triisopropilsilil)-1H-indol (450 mg, 1,0 mmol), 4-acetamido-3-cloro-6-(trimetilestanil)picolinato de metila (450 mg, 1,1 mmol) foram combinados em 7 mL de DMF seco, desaerados com um fluxo de nitrogênio por 15 min, tratados com cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) (72 mg, 0,10 mmol) e iodeto de cobre (I) e aquecidos a 60 °C por 2 h. A mistura foi dividida entre acetato de etila e água. A fase orgânica foi lavada com água, lavada com NaCl saturado, secada (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), e evaporada. A purificação por cromatografia

flash (SiO<sub>2</sub>, 100-200 malha; eluindo com 0–30% de EtOAc em hexanos) forneceu 200 mg do produto *N*-acetamida sililado. Este material foi suspenso com metanol (15 mL) formando uma lama, tratado com 2 mL cloreto de acetila e aquecido sob refluxo por 2 h. Os voláteis foram removidos sob vácuo e o resíduo foi purificado por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>; 0-40% acetato de etila em hexanos) para fornecer 30 mg do composto do título mais 60 mg do composto do título que ainda estava protegido pelo grupo TIPS no nitrogênio indol. O derivado TIPS foi dissolvido em 5 mL de THF seco, tratado com fluoreto hidrato de tetrabutilamônio (140 mg, 0,5 mmol) e agitado por 1 h a 20°C. A mistura foi dividida entre 20 mL de acetato de etila e NaCl saturado. A fase orgânica foi secada (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>) e evaporada. A purificação por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>; 0-50% acetato de etila em hexanos) forneceu outros 30 mg do composto do título como um sólido branco (60 mg, 16%).

[00387] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “Acoplamento 7”.

Exemplo 8: 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila (Composto No. 1.14)

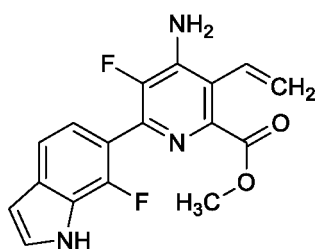


[00388] 7-Flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1-(triiopropilsilil)-1H-indol (500 mg, 1,2 mmol), 4-amino-3,6-dicloro-5-fluoropicolinato de metila (290 mg, 1,2 mmol), fluoreto de césio (360 mg, 2,4 mmol) e cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) (84 mg, 0,12 mmol) foram combinados em 4 mL de uma mistura 1:1 v/v de acetonitrila-água e aquecidos a 115°C por 25 min em um reator de microondas Biotage. A mistura foi dividida entre acetato de etila e NaCl saturado e a fase orgânica foi secada e evaporada. Purificação por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>;

eluindo com 0-20% de acetato de etila em diclorometano) forneceu um produto impuro. O material foi purificado por cromatografia flash novamente ( $\text{SiO}_2$ ; eluindo com 0-30% de acetato de etila em hexanos) para fornecer o composto do título como um sólido branco (220 mg, 52%).

[00389] O método de preparação usado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “Acoplamento 8”.

Exemplo 9: 4-amino-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)-3-vinilpicolinato de metila (Composto No. 1.17)

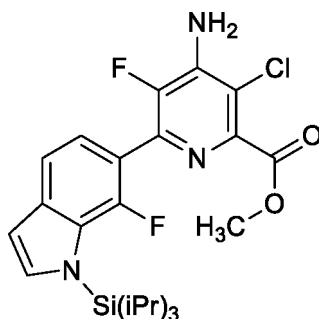


[00390] 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1-(triiisopropilsilil)-1H-indol (320 mg, 0,77 mmol), 4-amino-6-cloro-5-fluorflúor-3-vinilpicolinato de metila (190 mg, 0,84 mmol), carbonato de sódio (81 mg, 0,77 mmol) e cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) (54 mg, 0,08 mmol) foram combinados em 4 mL de uma mistura 1:1 v/v de acetoneitrila-água e aquecida a 115°C por 30 min em um reator de microondas iniciador Biotage. A mistura foi dividida entre acetato de etila e água. A fase orgânica foi lavada com NaCl saturado, secada ( $\text{Na}_2\text{SO}_4$ ), e evaporada. Purificação por cromatografia flash ( $\text{SiO}_2$ ; eluindo com 0-20% de acetato de etila em hexanos) forneceu 220 mg do produto TIPS protegido. Este material foi dissolvido em 10 mL de THF, tratado com hidrato fluoreto de tetrabutylamônio (260 mg, 1,0 mmol) e agitado por 1 h. A mistura foi dividida entre NaCl saturado e acetato de etila. A fase orgânica foi lavada com NaCl saturado, secada ( $\text{Na}_2\text{SO}_4$ ), e evaporada. Purificação por cromatografia flash ( $\text{SiO}_2$ ; eluindo com 0-20% de acetato de etila em hexanos) forneceu o composto do título como um sólido branco (100 mg, 37%).

[00391] O método de preparação usado neste exemplo é referido

na Tabela 10 como “Acoplamento 9”.

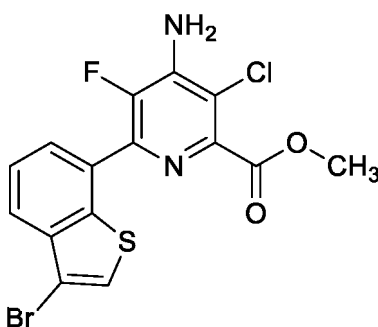
Exemplo 10: Preparação de 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1-(triisopropilsilil)-1H-indol-6-il)picolinato de metila (Composto 1.12)



[00392] 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1-(triisopropilsilil)-1H-indol (1,0 g, 2,4 mmol), 4-amino-3,6-dicloro-5-fluoropicolinato de metila (630 mg, 2,6 mmol), carbonato de sódio (250 mg, 2,4 mmol) e com cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) (170 mg, 0,24 mmol) foram combinados em 10 mL de 1:1 v/v acetonitrila-água e aquecidos a 110°C por 30 min em um reator de microondas iniciador Biotage. A mistura foi agitada com 30 mL de acetato de etila e 20 mL de água e filtrada através de lã de vidro para remover sólidos escuros. A fase orgânica foi lavada com NaCl saturado, secada (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), e evaporada. A purificação por cromatografia flash (SiO<sub>2</sub>; eluindo com 0-30% acetato de etila em hexanos) forneceu o composto do título como um sólido branco (520 mg; 42%).

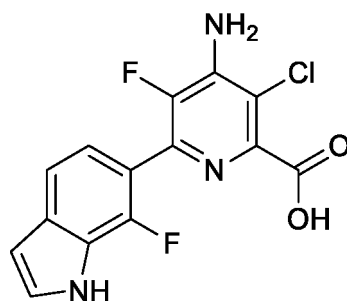
[00393] O método de preparação utilizado neste exemplo é referido na Tabela 10 como “Acoplamento 10”.

Exemplo 11: 4-amino-6-(3-bromobenzo[b]tiofen-7-il)-3-cloro-5-fluoropicolinato de metila (Composto No. 3.26)



[00394] 4-amino-6-(benzo[b]tiofen-7-il)-3-cloro-5-fluorpicolinato de metila (0,500 g, 1,485 mmol) foi dissolvido em diclorometano (9,90 mL) e resfriado a  $-5^{\circ}\text{C}$  em um banho de acetona ao qual foram adicionadas algumas poucas peças de gelo seco. Bromo (114  $\mu\text{l}$ , 2,227 mmol) foi dissolvido em diclorometano (9,90 mL) e adicionado gota a gota. A mistura de reação foi agitada durante a noite, e depois dividida entre acetato de etila e água. A fase orgânica foi secada e concentrada e o produto foi purificado por cromatografia flash ( $\text{SiO}_2$ ; 5-40% acetato de etila / hexano gradiente), seguido por uma segunda purificação por cromatografia de fase reversa para fornecer o composto do título como um sólido cinza. (0,278 g, 45%).

Exemplo 12: Ácido 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolínico (Composto 1.38)

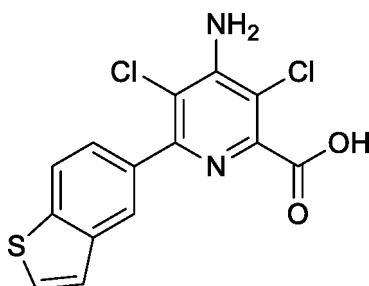


[00395] A um vaso de reação contendo 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila (0,500 g, 1,481 mmol) adicionou-se metanol (14,81 mL) e hidróxido de sódio (2,96 mL, 5,92 mmol). A mistura de reação foi agitada durante a noite à RT depois acidificada por adição de um leve excesso de HCl 2 N. A mistura foi concentrada e o precipitado que se formou foi lavado com água e secado sob vá-

cuo para fornecer o ácido 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1*H*-indol-6-il)picolínico (0,400 g, 79% de rendimento) como um sólido esbranquiçado.

[00396] O método de preparação empregado neste exemplo é referido na tabela 10 como “Hidrólise 1”.

Exemplo 13: Ácido 4-amino-6-(benzo[*b*]tiofen-5-il)-3,5-dicloropicolínico (Composto 3.2)

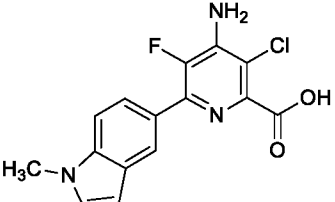
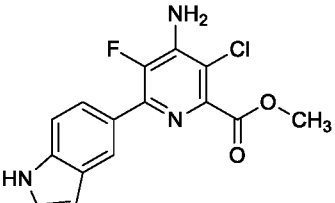
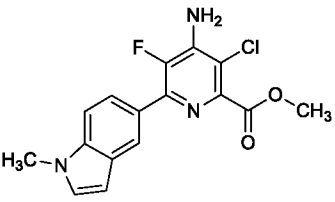
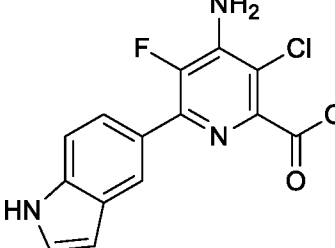
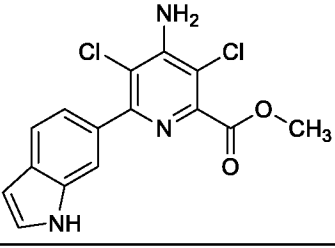
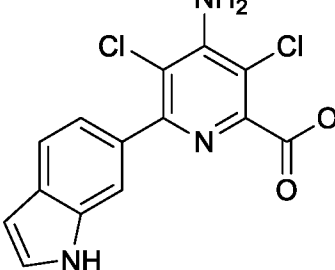


[00397] Em um frasco de fundo redondo de 100 mL, dissolveu-se 4-amino-6-(benzo[*b*]tiofen-5-il)-3,5-dicloropicolinato de metila (210 mg, 0,595 mmol) em metanol (2,3 mL), tetra-hidrofurano (2,3 mL), e H<sub>2</sub>O (1,2 mL). Hidrato de hidróxido de lítio (74,8 mg, 1,784 mmol) foi adicionado como um sólido. A mistura de reação foi agitada à temperatura ambiente até estar completada. A mistura de reação foi concentrada até a secagem. O resíduo resultante foi dissolvido em H<sub>2</sub>O (2,0 mL) e HCl 1N foi usado para ajustar o pH a 3,0, fazendo com que um precipitado se forme. Esta suspensão foi extraída com acetato de etila (3 x 15 mL). Os extratos orgânicos foram combinados, lavados com solução saturada de NaCl, secados (MgSO<sub>4</sub>), filtrados e concentrados. Purificação adicional do sólido resultante foi realizada, se necessário, usando um sistema de fase reversa Teledyne ISCO com um sistema de gradiente de eluente de acetonitrila e H<sub>2</sub>O para produzir o composto do título como um sólido branco (110 mg, 55%).

[00398] O método de preparação usado neste exemplo se refere, na tabela 10, à “Hidrólise 2”.

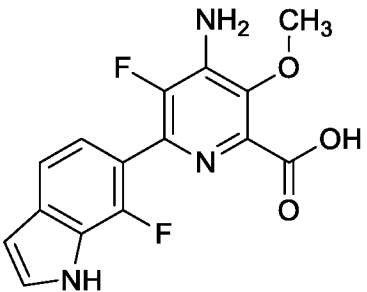
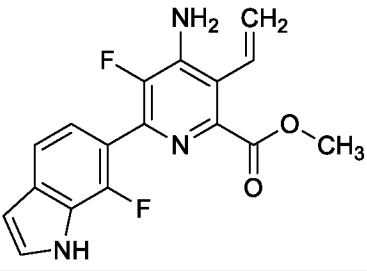
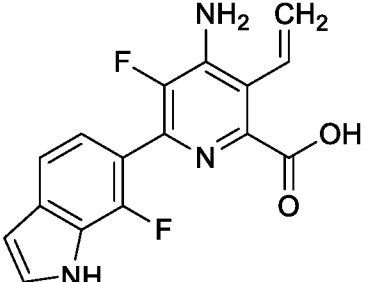
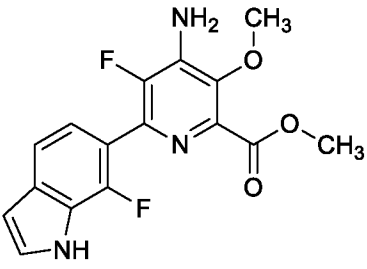
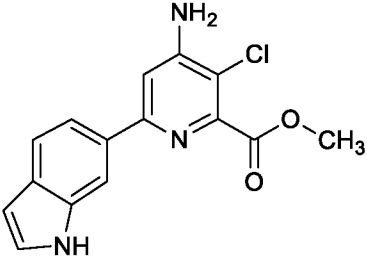
Tabela 10. Composto número, estrutura, aparência, e Método de pre-

## paração

Composto Número	Estrutura	Apa-rência	Método de Prepa-ração:	Precursore(s)
1,01		Pó branco	Hidrólise 1	Composto 1,03
1,02		Pó cor de bronze	Acopla-mento 2	Conforme des-crito
1,03		Pó Branco	Acopla-mento 2	Head B; Ácido 1-metil-1 <i>H</i> -indol-5-ilborônico
1,04		Pó cor de bronze	Hidrólise 1	Composto 1,02
1,05		Sólido ama-relo	Acopla-mento 1	Head H; Ácido (1 <i>H</i> -indol-6-il)borônico
1,06		Sólido ama-relo	Hidrólise 1	Composto 1,05

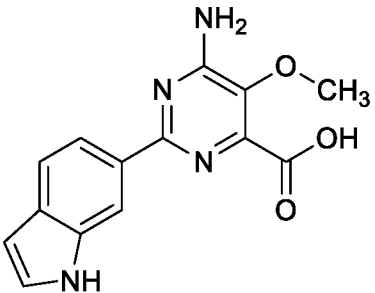
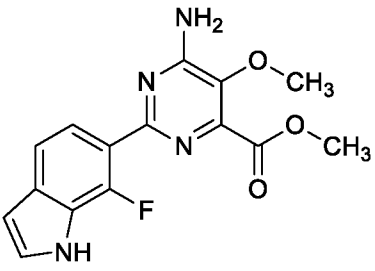
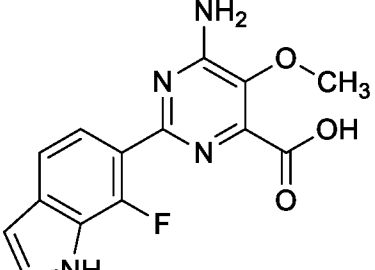
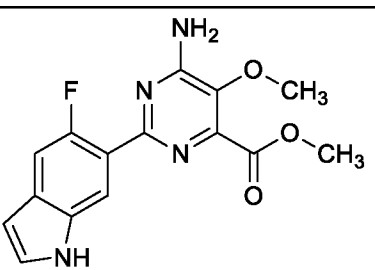
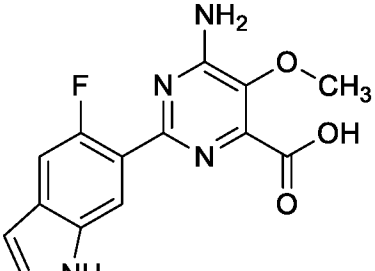
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,07		Sólido branco	Acoplamento 9	Head H
1,08		Espuma Esbranquiçada	Acoplamento 2	Head B; Ácido 1 <i>H</i> -Indol-6-ilborônico
1,09		Pó branco	Hidrólise 1	Composto 1,08
1,10		Pó cor de bronze	Acoplamento 2	Head B; 1-Metil-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol
1,11		Pó amarelo claro	Hidrólise 1	Composto 1,10

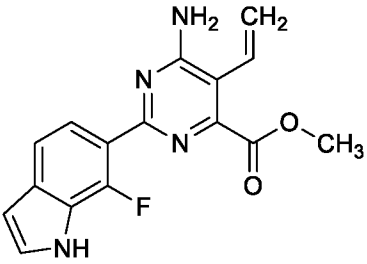
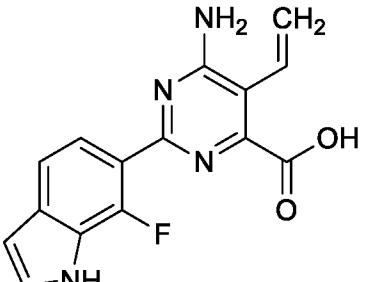
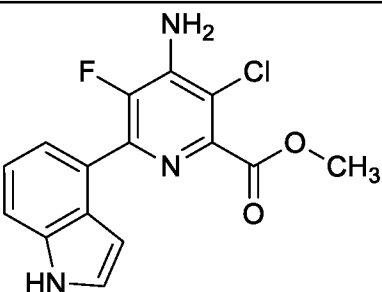
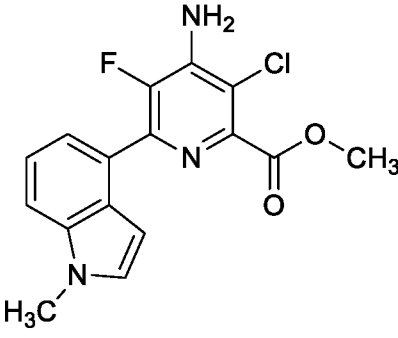
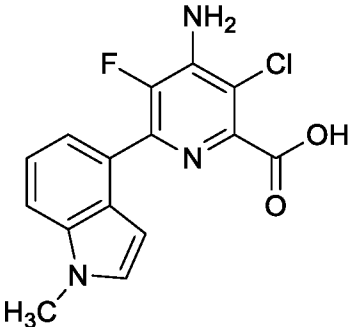
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,12		Sólido branco	Acoplamento 10	Head B
1,13		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 4	Head B; 5-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,14		Sólido cor de bronze	Hidrólise 2	Composto 1,13
1,15		Sólido branco	Acoplamento 4	Head B; 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,16		Sólido cor bronze	Hidrólise 2	Composto 1,15

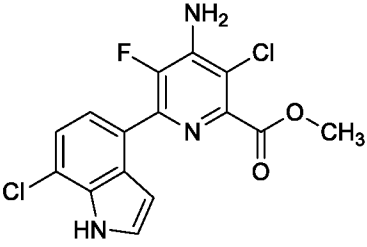
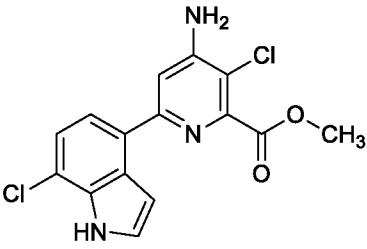
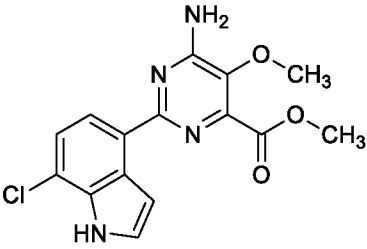
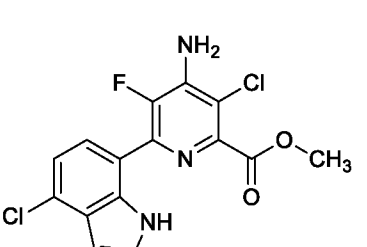
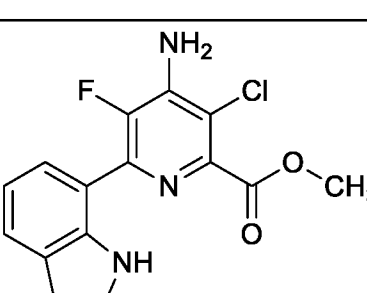
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,17		Sólido branco	Hidrólise 1	Composto 1,20
1,18		Sólido branco	Acoplamento 9	Head G
1,19		Sólido cor bronze	Hidrólise 1	Composto 1,18
1,20		Sólido branco	Acoplamento 8	Head F
1,21		Sólido branco	Acoplamento 1	Head A, Ácido (1 <i>H</i> -indol-6-il)borônico

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,22		Laranja sólido	Hidrólise 1	Composto 1,21
1,23		Sólido branco	Acoplamento 6	Conforme descrito
1,24		Sólido amarelo	Hidrólise 2	Composto 1,23
1,25		Sólido branco	Acoplamento 6	Head L; 5-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,26		Sólido branco	Hidrólise 2	Composto 1,25

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,27		Sólido branco	Acoplamento 7	Head K
1,28		Pó Amarelo	Acoplamento 1	Head D; Ácido (1 <i>H</i> -indol-6-il)borônico
1,29		Sólido rosa claro em flocos	Hidrólise 1	Composto 1,28
1,30		Sólido branco	Acoplamento 1	Head E
1,31		Sólido amarelo	Acoplamento 8	Head E
1,32		Sólido branco	Acoplamento 4	Head C; 6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,33		Sólido amarelo	Hidrólise 2	Composto 1,32
1,34		Sólido branco	Acoplamento 4	Head C; 7-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,35		Sólido amarelo	Hidrólise 2	Composto 1,34
1,36		Sólido branco	Acoplamento 4	Head C; 5-flúor-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,37		Sólido amarelo	Hidrólise 2	Composto 1,36

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,38		Sólido cor bronze	Acoplamento 8	Head P
1,39		Sólido branco	Hidrólise 1	Composto 1,38
1,40		Sólido branco	Acoplamento 1	Head B; 4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,41		Sólido branco	Acoplamento 1	Head B; 1-metil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,42		Sólido Esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 1,41

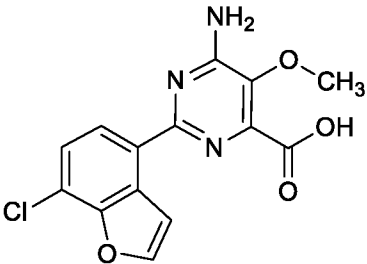
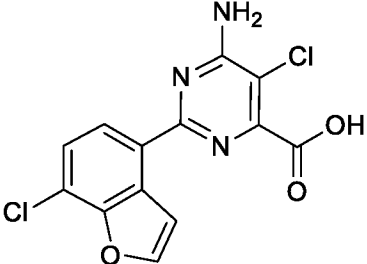
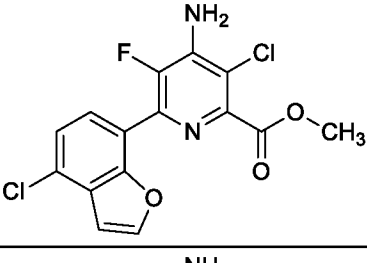
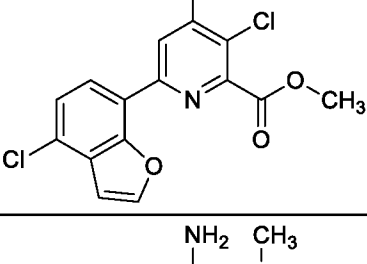
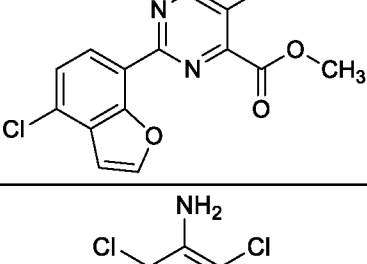
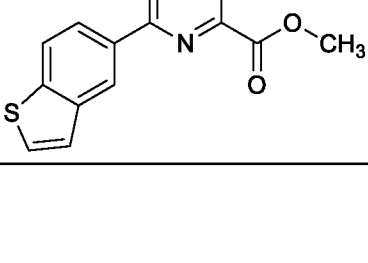
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,43		Sólido branco	Acoplamento 4	Head B; 7-cloro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol
1,44		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 6	Head L; 7-cloro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol
1,45		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 4	Head C; 7-cloro-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol
1,46		Sólido branco	Acoplamento 4	Head B; 4-cloro-7-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol
1,47		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head B; 7-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1 <i>H</i> -indol

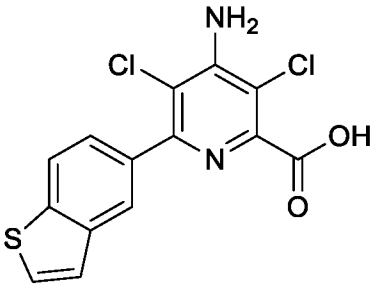
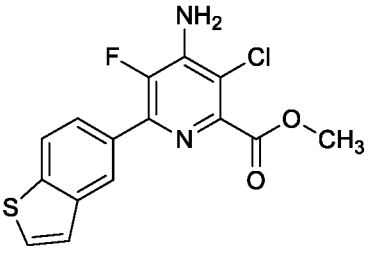
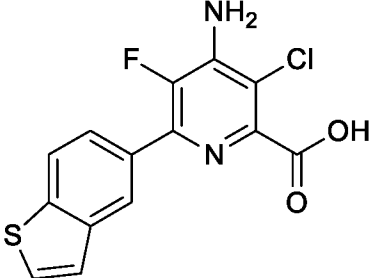
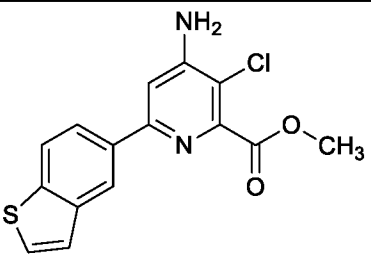
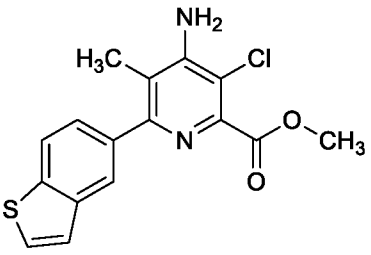
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
1,48		Sólido cor bronze	Hidrólise 1	Composto 1,47
1,49		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 6	Head L; 4-cloro-7-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
1,50		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 4	Head C; 4-cloro-7-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indol
2,01		Sólido amarelo	134	Head B; 2-(benzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
2,02		Sólido branco	Hidrólise 1	Composto 2,01
2,03		Sólido amarelo	Acoplamento 1	Head L; ácido benzofuran-5-ilborônico

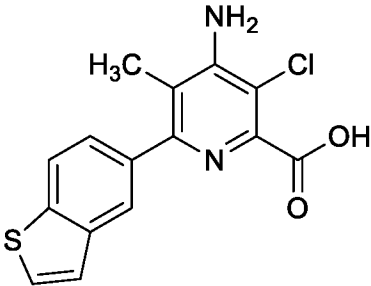
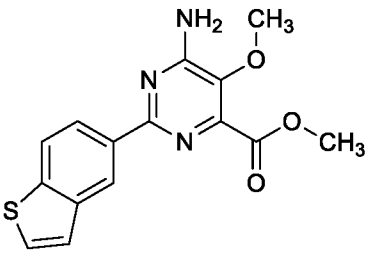
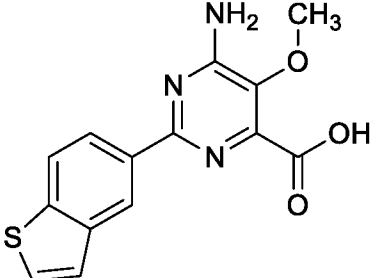
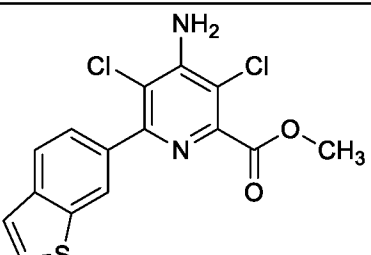
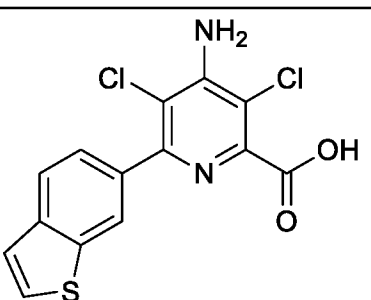
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
2,04		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head A; 2-(6-fluorobenzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
2,05		Sólido branco	Acoplamento 1	Head C; 2-(6-fluorobenzofuran-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
2,06		Óleo amarelo claro à temp ambiente	Acoplamento 1	Head C; ácido benzofuran-5-borônico
2,07		Sólido branco	134	Head B; 2-(benzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
2,08		Sólido Esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 2,07
2,09		Sólido amarelo claro	Acoplamento 1	Head B; 2-(7-fluorobenzofuran-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano



Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
2,16		Sólido branco	Acoplamento 5	Head B; 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinano
2,17		Sólido escuro	Hidrólise 1	Composto 2,15
2,18		Sólido Esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 2,16
2,19		Sólido amarelo claro	Acoplamento 5	Head M; 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinane
2,20		Sólido escuro	Acoplamento 5	Head E; 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinano
2,21		Sólido escuro	Acoplamento 5	Head C; 2-(7-clorobenzofuran-4-il)-5,5-dimetil-1,3,2-dioxaborinano

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
2,22		Sólido escuro	Hidrólise 1	Composto 2,21
2,23		Sólido escuro	Hidrólise 1	Composto 2,20
2,24		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head B; 2-(4-clorobenzofuran-7-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
2,25		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head A; 2-(4-clorobenzofuran-7-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
2,26		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head C; 2-(4-clorobenzofuran-7-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,01		Sólido branco	Acoplamento 4	Head H; 2-(benzo[b]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
3,02		Sólido branco	Hidrólise 2	Head H; 2-(benzo[b]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,03		Sólido branco	Acoplamento 2	Head B; 2-(benzo[b]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,04		Sólido queimado	Hidrolise 1	Composto 3,03
3,05		Sólido amarelo	Acoplamento 1	Head L; 2-(benzo[b]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,06		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head D; 2-(benzo[b]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano

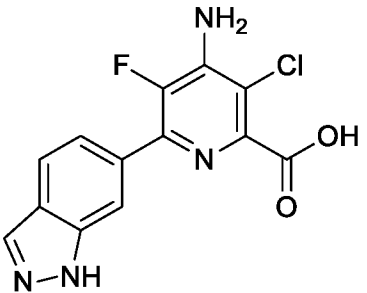
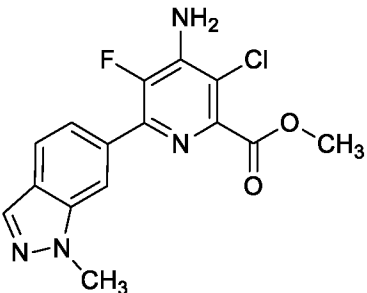
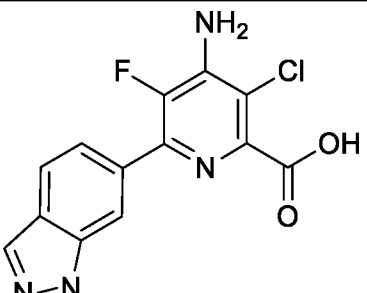
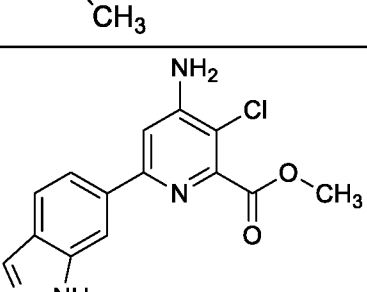
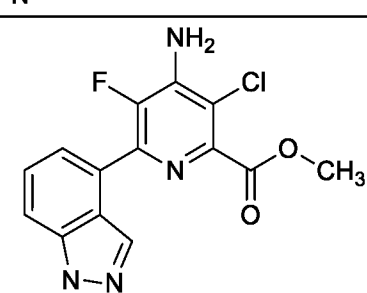
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
3,07		Sólido Esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 3,06
3,08		Sólido branco	Acoplamento 4	Head C; 2-(benzo[b]tiofen-5-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,09		Sólido branco	Hidrólise 2	Composto 3,08
3,10		Sólido branco	Acoplamento 1	Head H; 2-(benzo[b]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,11		Sólido amarelo	Hidrólise 1	Composto 3,10

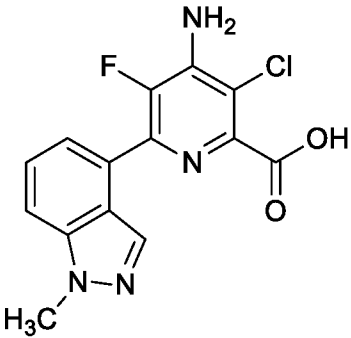
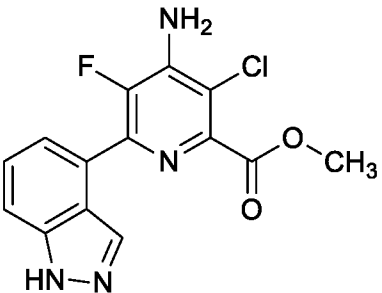
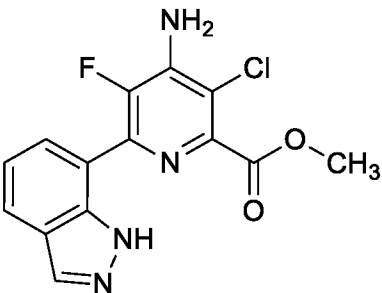
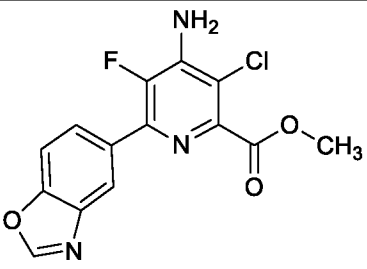
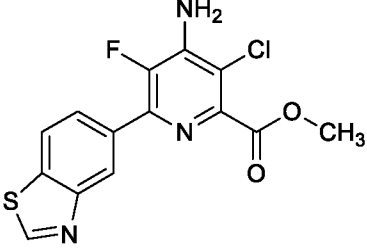
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
3,12		Sólido amarelo claro	Acoplamento 5	Head B; 2-(benzotiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,13		Sólido cor de bronze	Hidrólise 1	Composto 3,12
3,14		Sólido amarelo claro	Acoplamento 1	Head B; 2-(5-flúorbenzotiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,15		Sólido Esbranquiçado quebradiço	Acoplamento 1	Head A; 2-(benzo[b]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,16		Sólido branco	Hidrolise 1	Composto 3,15

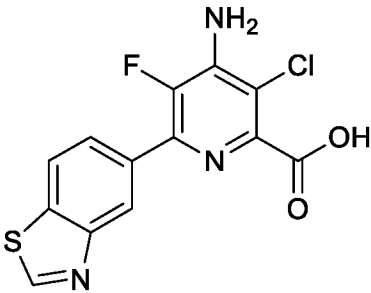
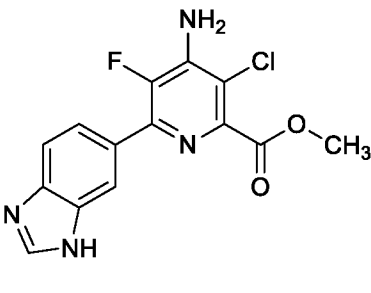
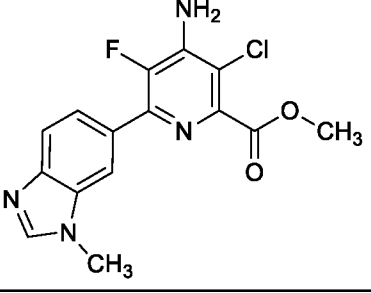
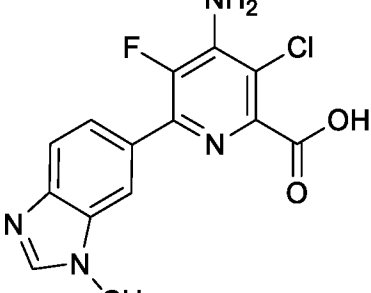
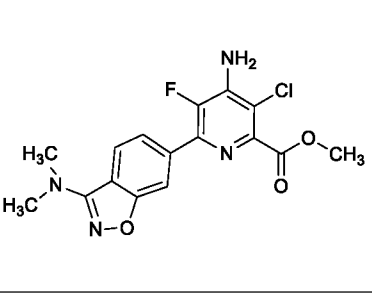
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
3,17		Sólido branco	Acoplamento 1	Head A; 2-(5-fluorobenzo[b]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,18		Sólido Amarelo	Acoplamento 1	Head D; 2-(benzo[b]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,19		Sólido Esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 3,18
3,20		Sólido amarelo claro	Acoplamento 4	Head C; 2-(benzo[b]tiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,21		Sólido branco	Hidrólise 2	Composto 3,20

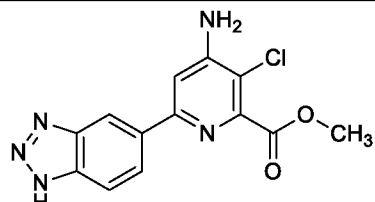
Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
3,22		Sólido Esbranquiçado	Acoplamento 1	Head C; 2-(5-flúorbenzotiofen-6-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano
3,23		Sólido branco	Acoplamento 1	Head B; ácido benzo[b]tiofen-4-ilborônico
3,24		Sólido branco	Acoplamento 1	Head B; ácido benzo[b]tiofen-7-ilborônico
3,25		Sólido branco	Hidrólise 1	Composto 3,24
3,26		sólido cinza	140	Como descrito

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
3,27		óleo amarelo	Acoplamento 1	Head L; ácido benzo[b]tiofen-7-ilborônico
4,01		Pó branco	Acoplamento 2	Head B; ácido 1H-Indazol-5-ilborônico
4,02		Pó branco	Hidrólise 1	Composto 4,01
4,03		Pó branco	Acoplamento 2	Head B; Ácido 1-metil-1H-indazol-5-ilborônico
4,04		Pó branco	Hidrólise 1	Composto 4,03
4,05		Pó branco	Acoplamento 2	Head B; Ácido 1H-Indazol-6-ilborônico

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
4,06		Pó esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 4,05
4,07		Pó branco	Acoplamento 2	Head B; Ácido 1-Metil-1 <i>H</i> -indazol-6-ilborônico
4,08		Pó branco	Hidrólise 1	Composto 4,07
4,09		Sólido branco	Acoplamento 1	Head A, Ácido (1 <i>H</i> -indazol-6-il)borônico
4,10		Sólido amarelo	Acoplamento 1	Head B; 1-metil-4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborlan-2-il)-1 <i>H</i> -indazol

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
4,11		Sólido Esbranquiçado	Hidrólise 1	Composto 4,10
4,12		Sólido branco	Acoplamento 1	Head B; ácido 1H-indazol-4-ilborônico
4,13		Sólido branco	Acoplamento 1	Head B; 7-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-indazol
5,01		Sólido esbranquiçado	Acoplamento 5	Head B; pinacol éster de ácido benzoxazol-5-borônico
6,01		Sólido marrom claro	Acoplamento 3	Conforme descrito

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
6,02		Sólido marrom claro	Hidrólise 1	Composto 6,01
7,01		Pó esbranquiçado	Acoplamento 2	Head B; 6-(4,4,5,5-Tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-1H-benzimidazol
7,02		Pó branco	Acoplamento 2	Head B; Ácido 1-metil-1H-benzimidazol-6-ilborônico
7,03		Pó branco	Hidrólise 1	Composto 7,02
8,01		Sólido amarelo	Acoplamento 1	Head B; N,N-dimetil-6-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)benzo[d]isoxazol-3-amina

Composto Número	Estrutura	Aparência	Método de Preparação:	Precursore(s)
9,01		Sólido branco	Acoplamento 7	Head K; 6-bromo-1H-benzotriazol

[0048] Tabela 11. Dados Analíticos para os Compostos na Tabela 1

## Tabela 1

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
1,01	166-168	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,06 (s, 1H), 7,67 (br d, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> = 8 Hz, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 6,77 (br s, 2H), 6,54 (d, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H)
1,02	221-224	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,04 (s, 1H), 7,59 (dt, <i>J</i> = 7, 1,5 Hz, 1H), 7,48 (d, <i>J</i> = 7 Hz, 1H), 7,41 (t, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 6,85 (br s, 2H), 6,54 (m, 1H), 3,89 (s, 3H)
1,03	125-127	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,21 (s, 1H), 7,82 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,08 (d, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 6,56 (d, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 4,84 (br s, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,82 (s, 3H)
1,04	180-182	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,26 (br s, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,61 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 7,48 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,41 (t, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 7,67 (br s, 2H), 6,54 (m, 1H)
1,05	174-179	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,50 (s, 1H), 7,65 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 2H), 7,40 (dd, <i>J</i> = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,23 – 7,17 (m, 1H), 6,54 – 6,48 (m, 1H), 5,30 (d, <i>J</i> = 3,9 Hz, 2H), 3,94 (s, 3H)
1,06	160-164	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,64 (s, 1H), 11,26 (s, 1H), 7,67 – 7,63 (m, 1H), 7,60 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,48 – 7,41 (m, 1H), 7,25 (dd, <i>J</i> = 8,2, 1,5 Hz, 1H), 6,89 (s, 2H), 6,48 (dd, <i>J</i> = 2,5, 1,5 Hz, 1H)
1,07	185-190	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,79 (s, 1H), 7,94 (s, 2H), 7,55 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,40 (d, <i>J</i> = 8,4 Hz, 1H), 6,55 (m, 1H), 3,93 (s, 3H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ -132,43. ESIMS <i>m/z</i> 321 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,08	66-69	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,31 (br s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,71 (s, 2H), 7,29 (t, <i>J</i> = 3 Hz, 1H), 6,58 (m, 1H), 4,86 (br s, 2H), 3,99 (s, 3H)
1,09	138-140	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 7,95 (s, 1H), 7,63 (d, <i>J</i> = 8

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
		Hz, 1H), 7,54 (dt, $J = 8, 2$ Hz, 1H), 7,47 (t, $J = 3$ Hz, 1H), 6,79 (br s, 2H), 6,48 (m, 1H)
1,10	116-119	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,94 (t, $J = 1$ Hz, 1H), 7,69 (br s, 2H), 7,13 (d, $J = 3$ Hz, 1H), 6,50 (dd, $J = 3, 1$ Hz, 1H), 4,85 (br s, 2H), 3,99 (s, 3H), 3,84 (s, 3H)
1,11	173-176	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 7,93 (s, 1H), 7,66 (d, $J = 8,5$ Hz, 1H), 7,59 (d, $J = 8,5$ Hz, 1H), 7,46 (d, $J = 3$ Hz, 1H), 6,50 (d, $J = 3$ Hz, 1H), 6,37 (br s, 2H), 3,87 (s, 3H)
1,12	181-182	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,49 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 7,40 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,29 (dd, $J = 8,1, 5,9$ Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,98 (s, 3H), 1,68 (m, 3H), 1,14 (d, $J = 7,6$ Hz, 18H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ -124,55, -124,65, -136,90, -137,00. ESIMS $m/z$ 492 [(M-H)].
1,13		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,88 (s, 3H), 6,49 (ddd, $J = 2,9, 1,9, 0,8$ Hz, 1H), 6,96 (s, 2H), 7,43 (d, $J = 11,1$ Hz, 1H), 7,50 (d, $J = 6,0$ Hz, 1H), 7,54 (t, $J = 2,8$ Hz, 1H), 11,32 (s, 1H)
1,14		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 6,46 – 6,52 (m, 1H), 6,88 (s, 2H), 7,42 (d, $J = 11,1$ Hz, 1H), 7,49 – 7,56 (m, 2H), 11,33 (s, 1H), 13,56 (s, 1H)
1,15		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,88 (s, 3H), 6,59 (td, $J = 3,2, 1,9$ Hz, 1H), 6,99 (s, 2H), 7,08 (dd, $J = 8,2, 6,2$ Hz, 1H), 7,47 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,52 (t, $J = 2,8$ Hz, 1H), 11,82 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H)
1,16		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 6,59 (td, $J = 3,2, 1,9$ Hz, 1H), 6,90 (s, 2H), 7,10 (dd, $J = 8,2, 6,2$ Hz, 1H), 7,47 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 7,51 (t, $J = 2,8$ Hz, 1H), 11,81 (s, 1H), 13,57 (s, 1H)
1,17	133-140	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,76 (s, 1H), 7,49 (dd, $J = 3,0, 2,5$ Hz, 1H), 7,44 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,09 (dd, $J = 8,2, 6,2$ Hz, 1H), 6,57 (td, $J = 3,3, 1,9$ Hz, 1H), 6,41 (s, 2H), 3,80 (s, 3H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ -134,66, -134,73. ESIMS $m/z$ 320 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,18	164-166	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,45 (s, 1H), 7,49 (dd, $J = 8,2, 0,8$ Hz, 1H), 7,35 – 7,28 (m, 2H), 6,94 (dd, $J = 18,1, 11,5$ Hz, 1H), 6,61 (td, $J = 3,4, 2,1$ Hz, 1H), 5,72 (dd, $J = 11,5, 1,5$ Hz, 1H), 5,60 (dd, $J = 18,1, 1,5$ Hz, 1H), 4,72 (s, 2H), 3,91 (s, 2H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ -135,79, -135,87, -140,98, -141,07. ESIMS $m/z$ 330 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,19		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,76 (d, $J = 16,4$ Hz, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,11 (dd, $J = 8,2, 6,2$ Hz, 1H), 6,79 (dd, $J = 17,8, 11,5$ Hz, 1H), 6,58 (dd, $J = 5,1, 3,2$ Hz, 1H), 6,38 (s, 1H), 5,56 (m, 1H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ -

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
		134,07, -134,15, -143,26, -143,34. ESIMS <i>m/z</i> 316 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,20	203-205	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,76 (s, 1H), 7,49 (dd, <i>J</i> = 6,0, 3,3 Hz, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,05 (dd, <i>J</i> = 8,1, 6,3 Hz, 1H), 6,57 (m, 1H), 6,49 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 3,79 (s, 3H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ -134,75, -134,82, -138,34, -138,42. ESIMS <i>m/z</i> 334 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,21	83-85	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,20 (s, 1H), 8,00 (m, 1H), 7,59 (m, 1H), 7,53 (m, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> = 3,1, 2,4 Hz, 1H), 7,32 (s, 1H), 6,61 (s, 2H), 6,45 (s, 1H), 3,91 (s, 3H)
1,22	172-174	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,47 (s, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 7,67 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 2H), 7,52 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,46 (dd, <i>J</i> = 8,4, 1,7 Hz, 1H), 6,51 (t, <i>J</i> = 2,5 Hz, 1H), NaN (m, 2H)
1,23		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,89 (s, 3H), 6,54 (td, <i>J</i> = 3,4, 1,9 Hz, 1H), 6,75 (s, 2H), 7,31 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 7,37 – 7,52 (m, 3H), 11,76 (s, 1H)
1,24		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 6,50 – 6,62 (m, 1H), 6,71 (s, 2H), 7,27 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 7,41 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,45 – 7,53 (m, 2H), 11,76 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 13,48 (s, 1H)
1,25		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,90 (s, 3H), 6,45 (ddd, <i>J</i> = 2,9, 1,9, 0,9 Hz, 1H), 6,75 (s, 2H), 7,29 (d, <i>J</i> = 1,7 Hz, 1H), 7,40 (d, <i>J</i> = 12,7 Hz, 1H), 7,52 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,93 (dd, <i>J</i> = 6,8, 0,8 Hz, 1H), 11,27 (t, <i>J</i> = 2,3 Hz, 1H)
1,26		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 6,45 (t, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 6,68 (s, 2H), 7,24 (d, <i>J</i> = 1,6 Hz, 1H), 7,40 (d, <i>J</i> = 12,8 Hz, 1H), 7,52 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> = 6,7 Hz, 1H), 11,29 (s, 1H), 13,54 (s, 1H)
1,27	169-171	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,45 (s, 1H), 7,29 (t, <i>J</i> = 2,7 Hz, 1H), 7,16 (d, <i>J</i> = 10,0 Hz, 1H), 6,93 (dd, <i>J</i> = 1,5, 0,8 Hz, 1H), 6,54 (s, 1H), 4,82 (s, 2H), 3,98 (s, 3H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ -126,04, -135,41. ESIMS <i>m/z</i> 336 [(M-H)].
1,28	231-234	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,15 (s, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,42 (dd, <i>J</i> = 6,3, 3,6 Hz, 2H), 7,05 (dd, <i>J</i> = 8,2, 1,5 Hz, 1H), 6,47 (dd, <i>J</i> = 2,5, 1,6 Hz, 1H), 6,39 (s, 2H), 3,85 (s, 3H), 2,14 (s, 3H)
1,29	168-175	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,31 (s, 1H), 7,66 – 7,60 (m, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,48 – 7,43 (m, 1H), 7,07 (dt, <i>J</i> = 15,8, 7,9 Hz, 3H), 6,53 – 6,48 (m, 1H), 2,13 (s, 3H)
1,30	240-242	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,33 (s, 1H), 8,37 (s,

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
		<sup>1</sup> H), 7,96 (dd, $J = 8,4, 1,5$ Hz, 1H), 7,58 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,50 (m, 1H), 6,47 (d, $J = 1,1$ Hz, 1H), 3,94 (s, 3H); ESIMS $m/z$ 303 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,31	185-190	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 11,79 (s, 1H), 7,94 (s, 2H), 7,55 (m, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,40 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 6,55 (m, 1H), 3,93 (s, 3H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- $d_6$ ) $\delta$ -132,43. ESIMS $m/z$ 321 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,32	190-191	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 3,74 (s, 3H), 3,92 (s, 3H), 6,46 (ddd, $J = 3,0, 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,27 (s, 2H), 7,46 (t, $J = 2,7$ Hz, 1H), 7,56 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,94 (dd, $J = 8,4, 1,5$ Hz, 1H), 8,33 (d, $J = 1,1$ Hz, 1H), 11,26 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H).
1,33	154-157	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 3,75 (s, 3H), 6,41 – 6,50 (m, 1H), 7,20 (s, 2H), 7,46 (t, $J = 2,7$ Hz, 1H), 7,56 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,96 (dd, $J = 8,4, 1,5$ Hz, 1H), 8,25 – 8,46 (m, 1H), 11,27 (s, 1H)
1,34		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 3,75 (s, 3H), 3,90 (s, 3H), 6,53 (td, $J = 3,2, 1,9$ Hz, 1H), 7,37 (d, $J = 8,3$ Hz, 3H), 7,44 – 7,54 (m, 2H), 11,71 (s, 1H)
1,35		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 3,77 (s, 3H), 6,53 (td, $J = 3,2, 1,9$ Hz, 1H), 7,12 – 7,35 (m, 2H), 7,37 (d, $J = 8,3$ Hz, 1H), 7,46 – 7,58 (m, 2H), 11,72 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 13,49 (s, 1H)
1,36		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 3,76 (s, 3H), 3,89 (s, 3H), 6,44 (ddd, $J = 3,0, 1,8, 0,9$ Hz, 1H), 7,32 (d, $J = 11,9$ Hz, 3H), 7,51 (t, $J = 2,8$ Hz, 1H), 7,85 (d, $J = 6,5$ Hz, 1H), 11,30 (s, 1H)
1,37		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 3,75 (s, 3H), 6,43 (ddd, $J = 2,9, 1,9, 0,8$ Hz, 1H), 7,10 – 7,46 (m, 3H), 7,50 (t, $J = 2,7$ Hz, 1H), 7,85 (dd, $J = 6,4, 0,8$ Hz, 1H), 11,29 (t, $J = 2,3$ Hz, 1H), 13,48 (s, 1H)
1,38	172-173	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 11,75 (s, 1H), 7,55 (dd, $J = 8,3, 6,7$ Hz, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,38 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,21 (s, 1H), 6,67 (dd, $J = 17,6, 11,5$ Hz, 1H), 6,54 (dd, $J = 5,1, 3,2$ Hz, 1H), 5,48 (ddd, $J = 11,4, 7,3, 1,1$ Hz, 1H), 3,83 (s, 1H), 3,33 (s, 1H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- $d_6$ ) $\delta$ -132,89. ESIMS $m/z$ 313 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,39	209-211	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- $d_6$ ) $\delta$ 13,51 (s, 1H), 11,75 (s, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,50 (t, $J = 2,5$ Hz, 1H), 7,38 (d, $J = 8,3$ Hz, 1H), 7,14 (s, 1H), 6,67 (dd, $J = 17,7, 11,5$ Hz, 1H), 6,54 (s, 1H), 5,60 (d, $J = 17,8$ Hz, 1H), 5,49 (d, $J = 11,4$ Hz, 1H). <sup>19</sup> F RMN (376 MHz, DMSO- $d_6$ ) $\delta$ -132,98. ESIMS $m/z$ 299 [(M+H) <sup>+</sup> ].
1,40	233-236	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ 8,27 (s, 1H), 7,51 – 7,45 (m,

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
		2H), 7,32 – 7,28 (m, 2H), 6,93 – 6,79 (m, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)
1,41	167-169	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,46 (ddd, <i>J</i> = 7,3, 2,1, 0,8 Hz, 1H), 7,41 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,33 – 7,28 (m, 1H), 7,13 (d, <i>J</i> = 3,1 Hz, 1H), 6,79 – 6,68 (m, 1H), 4,89 (s, 2H), 3,98 (s, 3H), 3,83 (s, 3H)
1,42	158-160	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 7,55 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,38 (d, <i>J</i> = 3,1 Hz, 1H), 7,32 – 7,22 (m, 2H), 6,77 (s, 2H), 6,50 (t, <i>J</i> = 2,3 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H)
1,43		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,88 (s, 3H), 6,61 (dt, <i>J</i> = 3,1, 2,0 Hz, 1H), 6,95 (s, 2H), 7,22 – 7,35 (m, 2H), 7,49 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H)
1,44	116	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,91 (s, 3H), 6,74 (s, 2H), 6,97 (dd, <i>J</i> = 3,2, 1,8 Hz, 1H), 7,28 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,43 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,54 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 11,65 (s, 1H)
1,45	226	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,76 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 7,25 (d, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,34 (s, 2H), 7,49 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,59 (dd, <i>J</i> = 3,0, 2,0 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 11,55 (s, 1H)
1,46		<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,93 (s, 3H), 6,60 (dd, <i>J</i> = 3,2, 2,0 Hz, 1H), 7,03 (s, 2H), 7,24 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,50 (dd, <i>J</i> = 8,0, 0,9 Hz, 1H), 7,55 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 11,44 (s, 1H)
1,47	96-100	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 11,33 (s, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,76 (d, <i>J</i> = 7,8 Hz, 1H), 7,37 – 7,29 (m, 1H), 7,18 (t, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 6,65 – 6,55 (m, 1H), 4,83 (s, 2H), 4,03 (s, 3H)
1,48	171-175	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 11,12 (s, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> = 7,8 Hz, 1H), 7,51 (d, <i>J</i> = 7,4 Hz, 1H), 7,41 (t, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,13 (t, <i>J</i> = 7,6 Hz, 1H), 6,89 (s, 2H), 6,53 (dd, <i>J</i> = 3,0, 2,1 Hz, 1H)
1,49	186-188	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,96 (s, 3H), 6,57 (dd, <i>J</i> = 3,2, 2,2 Hz, 1H), 6,81 (s, 2H), 7,23 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,55 – 7,59 (m, 1H), 11,51 (s, 1H)
1,50	147-149	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,78 (s, 3H), 3,94 (s, 3H), 6,60 (dd, <i>J</i> = 3,2, 2,2 Hz, 1H), 7,20 (d, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,29 – 7,88 (m, 3H), 8,09 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 11,75 (s, 1H)
2,01	114-117	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,16 (t, <i>J</i> = 1,4 Hz, 1H), 7,87 (dt, <i>J</i> = 8,7, 1,8 Hz, 1H), 7,66 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,61 – 7,54 (m, 1H), 6,86 – 6,81 (m, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
2,02	165-167	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,60 (s, 1H), 8,13 (s, 1H), 8,07 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> = 8,7 Hz, 1H), 7,75 – 7,64 (m, 1H), 7,07 (dd, <i>J</i> = 7,9, 6,5 Hz, 1H), 6,88 (s, 2H)
2,03	84-87	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,90 (d, <i>J</i> = 3,3 Hz, 3H), 6,75 (d, <i>J</i> = 19,2 Hz, 2H), 6,92 – 8,22 (m, 6H)
2,04	98	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,19 (d, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,63 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,28 (d, <i>J</i> = 11,2 Hz, 1H), 7,22 (d, <i>J</i> = 2,0 Hz, 1H), 6,79 (dd, <i>J</i> = 2,2, 0,9 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)
2,05	160	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,11 (d, <i>J</i> = 7,4 Hz, 1H), 7,63 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> = 10,6 Hz, 1H), 6,78 (dd, <i>J</i> = 2,2, 0,9 Hz, 1H), 5,40 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)
2,06		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,20 (dd, <i>J</i> = 7,7, 0,8 Hz, 1H), 7,79 (dd, <i>J</i> = 2,1, 0,9 Hz, 1H), 7,69 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,62 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 6,79 (dd, <i>J</i> = 2,1, 1,0 Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 3,95 (s, 3H), 3,93 (s, 3H)
2,07		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,10 (s, 1H), 7,88 – 7,83 (m, 1H), 7,70 (t, <i>J</i> = 2,5 Hz, 1H), 7,69 – 7,66 (m, 1H), 6,81 (dd, <i>J</i> = 2,2, 1,0 Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,00 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 3H)
2,08	168-170	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,59 (s, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,77 (s, 2H), 7,04 (dd, <i>J</i> = 2,1, 0,9 Hz, 1H), 6,90 (s, 2H)
2,09	151	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,73 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,48 – 7,41 (m, 2H), 6,85 (s, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,97 (d, <i>J</i> = 5,6 Hz, 3H)
2,10	109	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,72 (t, <i>J</i> = 3,3 Hz, 2H), 7,34 (dd, <i>J</i> = 9,5, 5,3 Hz, 1H), 6,79 (dd, <i>J</i> = 2,2, 0,9 Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 3,98 (s, 3H)
2,11	148	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,87 (dd, <i>J</i> = 8,2, 6,5 Hz, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,42 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> = 1,6 Hz, 1H), 6,82 (dd, <i>J</i> = 3,0, 2,2 Hz, 1H), 4,82 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)
2,12	130	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,15 (d, <i>J</i> = 5,7 Hz, 1H), 7,70 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,35 – 7,28 (m, 2H), 6,75 (dd, <i>J</i> = 2,2, 0,9 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)
2,13	178	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,82 (dd, <i>J</i> = 8,2, 6,3 Hz, 1H), 7,71 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 6,84 – 6,75 (m, 1H), 5,40 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)
2,14	153	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,06 (d, <i>J</i> = 5,9 Hz, 1H), 7,70 (t, <i>J</i> = 3,4 Hz, 1H), 7,32 (d, <i>J</i> = 10,6 Hz, 1H), 6,75 (dd, <i>J</i> = 2,2, 0,9 Hz, 1H), 5,39 (s, 2H), 4,01 (s, 3H), 3,96 (s, 3H)

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
2,15	100-103	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,72 – 7,69 (m, 1H), 7,68 – 7,63 (m, 1H), 7,59 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,42 – 7,36 (m, 1H), 7,20 – 7,15 (m, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,00 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 3H)
2,16	184-186	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,76 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,61 (dd, <i>J</i> = 8,2, 2,1 Hz, 1H), 7,42 – 7,38 (m, 1H), 7,26 – 7,24 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)
2,17	170-173	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,63 (s, 1H), 8,07 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,72 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,44 (t, <i>J</i> = 7,9 Hz, 1H), 7,09 (s, 1H), 6,93 (s, 2H)
2,18		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,81 (d, <i>J</i> = 2,3 Hz, 1H), 7,54 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 2H), 7,45 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 6,96 (s, 1H), 5,20 (s, 2H)
2,19	158-159	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,24 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,55 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,50 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,37 (s, 1H), 6,83 (s, 2H), 3,93 (s, 3H)
2,20		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,22 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,79 (dd, <i>J</i> = 12,0, 2,1 Hz, 2H), 7,38 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 5,61 (s, 2H), 4,05 (s, 3H)
2,21		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,22 – 8,09 (m, 1H), 7,86 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,77 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,42 – 7,34 (m, 1H), 5,39 (s, 2H), 4,04 (s, 3H), 3,95 (s, 3H)
2,22	204-206	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,22 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 8,20 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 8,00 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,42 (s, 1H), 3,78 (s, 3H)
2,23	173-174,5	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,76 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,61 (dd, <i>J</i> = 8,2, 2,1 Hz, 1H), 7,42 – 7,38 (m, 1H), 7,26 – 7,24 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)
2,24	167	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,68 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,54 (d, <i>J</i> = 8,1 Hz, 1H), 7,37 – 7,34 (m, 1H), 6,93 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 3,99 (d, <i>J</i> = 4,7 Hz, 3H)
2,25	169	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,14 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> = 10,0 Hz, 2H), 7,34 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 6,97 (t, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)
2,26	178	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,09 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,79 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 7,32 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 6,92 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 5,44 (s, 2H), 4,04 (s, 3H), 3,96 (s, 3H)
3,01	50-56	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,89 (s, 3H), 7,09 (s, 2H), 7,52 – 7,63 (m, 2H), 7,86 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 8,07 – 8,17 (m, 2H)
3,02	157-159	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 6,98 (s, 2H), 7,53 – 7,61 (m, 2H), 7,84 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 8,06 – 8,13 (m, 2H), 13,70 (s, 1H)

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
3,03	84-85	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,34 (s, 1H), 8,12 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,87 – 7,78 (m, 2H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 5,5, 0,6 Hz, 1H), 6,95 (s, 2H), 3,90 (s, 3H)
3,04	149-150	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,36 (s, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,83 (t, <i>J</i> = 6,1 Hz, 2H), 7,58 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 6,71 (s, 2H)
3,05	142-144	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,41 (d, <i>J</i> = 1,7 Hz, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,82 – 7,88 (m, 2H), 7,51 – 7,72 (m, 3H), 7,39 (s, 1H), 3,92 (s, 3H)
3,06	155-159	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,94 – 7,88 (m, 2H), 7,48 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,41 (dd, <i>J</i> = 8,3, 1,7 Hz, 1H), 7,36 (dd, <i>J</i> = 5,4, 0,6 Hz, 1H), 4,83 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,19 (s, 3H)
3,07	159-165	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,10 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,54 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 6,81 (s, 2H), 2,12 (s, 3H)
3,08	125-127	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,76 (s, 3H), 3,92 (s, 3H), 7,40 (s, 2H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 5,4, 0,7 Hz, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 8,06 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 1H), 8,24 (dd, <i>J</i> = 8,5, 1,7 Hz, 1H), 8,73 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H)
3,09	137-139	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,76 (s, 3H), 7,31 (s, 2H), 7,59 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,81 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 8,06 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 8,26 (dd, <i>J</i> = 8,5, 1,7 Hz, 1H), 8,76 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 13,54 (s, 1H)
3,10	134-135	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,22 – 8,09 (m, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,66 (dd, <i>J</i> = 8,3, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,36 (dd, <i>J</i> = 5,5, 0,6 Hz, 1H), 5,34 (s, 2H), 3,97 (s, 3H)
3,11	239 (dec)	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,22 (d, <i>J</i> = 0,7 Hz, 1H), 7,96 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,59 (dd, <i>J</i> = 8,3, 1,6 Hz, 1H), 7,53 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,02 (s, 2H)
3,12	185-189	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,48 (s, 1H), 7,95 (dt, <i>J</i> = 8,4, 1,6 Hz, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,54 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,37 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,01 (s, 3H)
3,13	165-167	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,60 (s, 1H), 8,45 (d, <i>J</i> = 6,7 Hz, 1H), 7,99 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 7,88 (dd, <i>J</i> = 13,5, 6,4 Hz, 2H), 7,52 (t, <i>J</i> = 4,7 Hz, 1H), 6,83 (d, <i>J</i> = 64,9 Hz, 2H)
3,14	112	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,08 (d, <i>J</i> = 6,2 Hz, 1H), 7,60 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,33 (s, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,99 (s, 3H)
3,15		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,55 – 8,44 (m, 1H), 7,92 – 7,79 (m, 2H), 7,50 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,34 (dd, <i>J</i> = 5,4,

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
		0,7 Hz, 1H), 7,17 (s, 1H), 4,82 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)
3,16	176-177	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,51 (s, 1H), 8,60 – 8,51 (m, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 1H), 7,91 (dd, <i>J</i> = 8,4, 1,6 Hz, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,51 (dd, <i>J</i> = 5,4, 0,6 Hz, 1H), 7,35 (s, 1H), 6,69 (s, 2H)
3,17	70	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,53 (d, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 7,58 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,55 (d, <i>J</i> = 7,1 Hz, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 4,81 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)
3,18	143-146	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,01 – 7,94 (m, 1H), 7,85 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,49 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,43 (dd, <i>J</i> = 8,2, 1,5 Hz, 1H), 7,36 (dd, <i>J</i> = 5,5, 0,6 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 3,96 (s, 3H), 2,19 (s, 3H)
3,19	157-162	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,11 (s, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,54 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,46 (dd, <i>J</i> = 8,2, 1,5 Hz, 1H), 6,86 (s, 2H), 2,12 (s, 3H)
3,20	143-145	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,76 (s, 3H), 3,92 (s, 3H), 7,40 (s, 2H), 7,51 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> = 8,4 Hz, 1H), 8,26 (dd, <i>J</i> = 8,5, 1,5 Hz, 1H), 8,79 (d, <i>J</i> = 1,1 Hz, 1H)
3,21	134-136	<sup>1</sup> H RMN (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 3,77 (s, 3H), 7,32 (s, 1H), 7,51 (dd, <i>J</i> = 5,4, 0,8 Hz, 1H), 7,88 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 7,94 (d, <i>J</i> = 8,4 Hz, 1H), 8,28 (dd, <i>J</i> = 8,4, 1,5 Hz, 1H), 8,81 – 8,86 (m, 1H)
3,22	168	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,44 (d, <i>J</i> = 6,8 Hz, 1H), 7,58 (t, <i>J</i> = 4,0 Hz, 1H), 7,54 – 7,52 (m, 1H), 7,30 (d, <i>J</i> = 5,4 Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 4,02 (s, 3H), 3,96 (s, 3H)
3,23	219-221	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,01 (d, <i>J</i> = 1,7 Hz, 1H), 7,85 (ddt, <i>J</i> = 9,5, 7,3, 3,6 Hz, 2H), 7,43 – 7,33 (m, 2H), 4,93 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)
3,24	121-123	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 7,97 – 7,85 (m, 2H), 7,54 (d, <i>J</i> = 5,6 Hz, 1H), 7,47 (t, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> = 5,6 Hz, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,04 (s, 3H)
3,25	183-185	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,00 (dd, <i>J</i> = 7,9, 0,8 Hz, 1H), 7,87 – 7,82 (m, 1H), 7,80 (d, <i>J</i> = 5,5 Hz, 1H), 7,56 – 7,50 (m, 2H), 6,97 (s, 2H)
3,26	181-184	<sup>1</sup> H RMN (600 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,05 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,58 (t, <i>J</i> = 7,8 Hz, 1H), 7,56 (s, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,05 (s, 3H)
3,27		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 7,96 (dd, <i>J</i> = 7,8, 1,0 Hz, 1H), 7,76 – 7,84 (m, 2H), 7,53 (d, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 7,47 – 7,51 (m, 2H), 6,82 (s, 2H), 3,94 (s, 3H)

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
4,01	188-190	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 10,09 (br s, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,03 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 7,57 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 4,90 (br s, 2H), 4,00 (s, 3H)
4,02	284-287	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,49 (br s, 1H), 13,19 (br s, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,89 (dt, <i>J</i> = 9, 1 Hz, 1H), 7,66 (dt, <i>J</i> = 9, 1 Hz, 1H), 6,82 (br s, 2H)
4,03	156-159	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,34 (m, 1H), 8,07 (d, <i>J</i> = 1 Hz, 1H), 8,03 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 7,47 (dt, <i>J</i> = 9, 1 Hz, 1H), 4,89 (br s, 2H), 4,10 (s, 3H), 3,99 (s, 3H)
4,04	186-188	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,53 (br s, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,92 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 6,81 (br s, 2H), 4,10 (s, 3H)
4,05	185-187	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,21 (br s, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,88 (dd, <i>J</i> = 9, 1 Hz, 1H), 7,61 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 6,96 (br s, 2H), 3,91 (s, 3H)
4,06	>300	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,20 (br s, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,87 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,64 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 6,66 (br s, 2H)
4,07	187-190	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,03 (d, <i>J</i> = 1 Hz, 1H), 8,00 (t, <i>J</i> = 1 Hz, 1H), 7,82 (dd, <i>J</i> = 9, 1 Hz, 1H), 7,72 (m, 1H), 4,94 (br s, 2H), 4,15 (s, 3H), 4,01 (s, 3H)
4,08	182-184	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,68 (br s, 1H), 8,14 (d, <i>J</i> = 1 Hz, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,89 (dd, <i>J</i> = 9, 0,5 Hz, 1H), 7,62 (dt, <i>J</i> = 9, 1 Hz, 1H), 6,88 (br s, 2H), 4,13 (s, 3H)
4,09	191 - 193	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,19 (s, 1H), 8,08 (d, <i>J</i> = 21,7 Hz, 2H), 7,84 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,63 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,38 (s, 1H), 6,76 (s, 2H), 3,91 (s, 3H)
4,10	170-175	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,42 (s, 1H), 7,63 (dt, <i>J</i> = 5,8, 2,2 Hz, 1H), 7,53 – 7,45 (m, 2H), 4,96 (s, 2H), 4,12 (s, 3H), 4,01 (s, 3H)
4,11	173-175	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,62 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,88 – 7,70 (m, 1H), 7,63 – 7,45 (m, 2H), 6,93 (s, 2H), 4,11 (d, <i>J</i> = 10,3 Hz, 4H)
4,12	212-215	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 10,10 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 7,66 (dd, <i>J</i> = 7,2, 1,5 Hz, 1H), 7,59 (d, <i>J</i> = 8,4 Hz, 1H), 7,54 – 7,45 (m, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,02 (s, 3H)
4,13	207-210	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 12,67 (s, 1H), 8,23 (d, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 8,15 (d, <i>J</i> = 1,9 Hz, 1H), 7,89 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> = 7,7 Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,12 (s, 3H)
5,01		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ 8,36 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 8,16

C. No.	PF (°C)	<sup>1</sup> H RMN
		(s, 1H), 8,06 – 7,98 (m, 1H), 7,68 (d, <i>J</i> = 8,6 Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,00 (s, 3H)
6,01	216	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 9,48 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,30 (d, <i>J</i> = 8,8 Hz, 1H), 7,95 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 6,99 (s, 2H), 3,91 (s, 3H)
6,02	186-187	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 13,54 (s, 1H), 9,47 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,30 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,98 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 6,91 (s, 2H)
7,01	219-221	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,31 (s, 1H), 8,04 (br s, 1H), 7,70 (br s, 2H), 6,92 (br s, 2H), 3,89 (s, 3H)
7,02	218-220	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,28 (s, 1H), 7,97 (br s, 1H), 7,75 (d, <i>J</i> = 9 Hz, 1H), 7,68 (dt, <i>J</i> = 9, 1,5 Hz, 1H), 6,94 (br s, 2H), 3,90 (s, 6H)
7,03	230-235 (dec)	<sup>1</sup> H RMN (300 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,76 (s, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,83 (s, 2H), 6,92 (br s, 2H), 3,98 (s, 3H)
8,01		<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 8,10 (t, <i>J</i> = 9,8 Hz, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,70 (t, <i>J</i> = 8,2 Hz, 1H), 7,08 (s, 2H), 3,94 – 3,85 (m, 3H), 3,16 (s, 6H)
9,01	129-33	<sup>1</sup> H RMN (400 MHz, DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ 15,84 (s, 1H), 8,35 (s, 1H), 7,98 (s, 2H), 7,41 (s, 1H), 6,79 (s, 2H), 3,91 (s, 3H)

**Tabela 12:** Tabela de Conversão da porcentagem de controle de avaliação

Classificação	Redução do crescimento em % Visual
A	95-100
B	85-94
C	75-84
D	60-74
E	45-59
F	30-44
G	0-29

[0049] Exemplo A. Avaliação da Atividade Herbicida pós emergente

[00399] Teste I pós emergente Sementes de espécies de teste foram obtidas a partir de fornecedores comerciais e plantadas em um pote redondo de 12,7 cm (5 polegadas) contendo uma mistura de mei-

os livres de solo (Metro-Mix 360<sup>®</sup>, Sun Gro Horticulture). Os tratamentos de pós emergência foram plantados 8-12 dias (d) antes da aplicação e cultivados em uma estufa equipada com fontes de luz suplementares para fornecer um fotoperíodo de 16 horas a 24-29°C. Todos os potes foram irrigados na superfície.

[00400] Aproximadamente 10 miligramas (mg) de cada composto foram dissolvidos em 1,3 mL de acetona-DMSO (97:3, v/v) e diluídos com 4,1 mL de água-isopropanol-concentrado de óleo de cultura (78:20:2, v/v/v) contendo 0,02% de Triton X-155. Os tratamentos foram diluídos em série com a formulação do solvente acima para fornecer 1,85, 0,926, 0,462 e 0,231 mg/mL do composto teste fornecido em 2,7 mL/pote (aproximadamente equivalente a 4,0, 2,0, 1,0, e 0,5 quilogramas por hectare (kg/ha), respectivamente).

[00401] Os compostos formulados foram aplicados usando um borrifador de ar comprimido DeVilbiss<sup>®</sup> a 138 milibar – 276 milibar (2-4 libras por polegada quadrada (psi)). Após o tratamento, os potes foram recolocados na estufa durante o período do experimento. Todos os potes foram sub-irrigados como necessário para fornecer ótimas condições de crescimento. Todos os potes foram fertilizados uma vez por semana subirrigando-os com o fertilizante Peters Peat-Lite Special<sup>®</sup> (20-10-20).

[00402] As classificações da fitotoxicidade foram obtidas 10 dias após aplicações com o tratamento de pós emergência. Todas as avaliações foram feitas visualmente em uma escala de 0 até 100 em que 0 representa nenhuma atividade e 100 representa morte completa da planta.

[00403] Alguns dos compostos testados, taxas de aplicação empregadas, espécies de plantas testadas, e resultados são dados na Tabela 13.

[00404] Tabela 13. Teste I de Atividade Herbicida pós-emergente

em latifoliadas chave e ervas daninhas gramíneas bem como espécies de cultura

Composto Número	Taxa de Aplicação (kg ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 10 Dias Após a aplicação				
		AVEFA	ECHCG	HELAN	IPOHE	SETFA
1,10	3,96	G	G	A	F	G
1,48	4	G	G	C	n/t	G
3,05	4	C	A	B	B	A

AVEFA: aveias selvagens (*Avena fatua*)

ECHCG: echinochloa (*Echinochloa crus-galli*)

HELAN: girassol (*Helianthus annuus*)

IPOHE: jeticuçu (*Ipomoea hederecea*)

SETFA: setaria (*Setaria faberi*)

kg ia/ha: quilogramas de ingrediente ativo por hectare

n/t: não testado

Exemplo B. Avaliação da atividade herbicida pré emergente

[00405] Teste I pré-emergência Sementes de espécies de teste foram plantadas em potes plásticos redondos 12,7 cm (5 polegadas) de diâmetro contendo solo arenoso argiloso. Após o plantio, todos os potes foram sub-irrigados por 16 horas antes da aplicação do composto.

[00406] Os compostos foram dissolvidos em uma mistura de 97:3 v/v (volume/volume) de acetona e DMSO e diluídos até a concentração apropriada em uma solução de aplicação final contendo água, acetona, isopropanol, DMSO e Agri-dex (concentrado de óleo de cultura) em uma proporção de 59:23:15:1,0:1,5 v/v e 0,02% p/v (peso/volume) de Triton X-155 para obter a solução de borrifo contendo a maior taxa de aplicação. A maior taxa de aplicação foi diluída em série com a solução acima para fornecer o composto a taxas de 1/2X, 1/4X e 1/8X da maior taxa (equivalente a 4,0, 2,0, 1,0, e 0,5 kg/ha, respecti-

vamente).

[00407] O composto formulado (2,7 mL) foi aplicado/pipetado homogeneamente por toda a superfície do solo seguido por incorporação de água (15 mL). Seguindo o tratamento, os potes foram retornados à estufa pela duração do experimento. A estufa foi programada por um fotoperíodo de aproximadamente 15 h que foi mantido a aproximadamente 23-29 °C durante o dia e 22-28°C durante a noite. Nutrientes e água foram adicionados em uma base regular através de irrigação da superfície e iluminação suplementar foi fornecida com lâmpadas de 1000 – watts de haleto metálico suspensas, se necessário.

[00408] Classificações de efeito herbicida foram obtidas 14 dias após o tratamento. Todas as avaliações foram feitas relativo aos controles apropriados em uma escala de 0 a 100, em que 0 representa nenhum efeito herbicida e 100 representa morte de planta ou falta de emergência do solo. Alguns dos compostos testados, taxas de aplicação empregadas, espécies de plantas testadas e resultados são dados na Tabela 14.

Tabela 14. Teste I de Pré-emergência Atividade Herbicida em latifolias chave e ervas daninhas gramíneas bem como em espécies de cultura

Número do Composto	Taxa de Aplicação (kg ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a aplicação				
		AVEFA	ECHCG	HELAN	IPOHE	SETFA
1,10	3,96	G	F	G	G	G
1,48	4	G	G	C	D	G
3,05	4	F	A	F	A	A

AVEFA: aveias (*Avena fatua*)

ECHCG: echinochloa (*Echinochloa crus-galli*)

HELAN: girassol (*Helianthus annuus*)

IPOHE: juticuçu (*Ipomoea hederecea*)

SETFA: setária (*Setaria faberi*)

kg ia/ha: quilogramas de ingrediente ativo por hectare

Exemplo C. Avaliação da atividade herbicida pós emergente

[00409] Teste II de pós emergência: Sementes ou coquinhos da espécie de planta desejada foram plantadas em uma mistura para plantio Sun Gro Metro-Mix<sup>®</sup> 360, que possui tipicamente um pH de 6,0 a 6,8 e um teor de matéria orgânica de aproximadamente 30 por cento, em potes plásticos com uma área de superfície de 64 centímetros quadrados (cm<sup>2</sup>). Quando requisitado para garantir uma boa germinação e plantas saudáveis, foi aplicado um tratamento fungicida e/ou outro tratamento químico ou físico. As plantas foram cultivadas por 7-21 dias em uma estufa com um foto período de aproximadamente 15 h, que foi mantido em cerca de 23-29°C durante o dia e 22-28°C durante a noite. Nutrientes e água foram adicionados em uma base regular e iluminação suplementar foi fornecida, se necessário, com lâmpadas de 1000 watts de haleto metálico suspensas. As plantas foram empregadas para teste quando elas atingiram o primeiro ou segundo estágio de folha verdadeiro.

[00410] Uma quantidade pesada, determinada pela taxa mais alta a ser testada, de cada composto teste foi colocada em um frasco de vidro de 25 mL e foi dissolvida em 4 mL de uma mistura 97:3 v/v de acetona e DMSO para obter soluções concentradas de estoque. Se o composto teste não dissolveu prontamente, a mistura foi aquecida e/ou sonicada. As soluções de estoque concentradas obtidas foram diluídas com 20 mL de uma mistura aquosa contendo acetona, água, álcool isopropílico, DMSO, concentrado de óleo de cultura Atplus 411F e agente tenso ativo Triton<sup>®</sup> X-155 em uma proporção de 48,5:39:10:1,5:1,0:0,02 v/v para obter soluções de borrifo contendo as maiores taxas de aplicação. Taxas de aplicação adicionais foram obtidas por diluição em série de 12 mL da solução de maior taxa em uma solução contendo 2 mL de

uma mistura 97:3 v/v de acetona e DMSO e 10 mL de uma mistura aquosa contendo acetona, água, álcool isopropílico, DMSO, concentrado de óleo de cultura Atplus 411F e agente tenso ativo Triton X-155 em uma proporção v/v de 48,5:39:10:1,5:1,0:0,02, para obter taxas 1/2X, 1/4X, 1/8X e 1/16X da maior taxa. Exigências do composto são baseadas em um volume de aplicação de 12 mL a uma taxa de 187 litros por hectare (l/ha). Compostos formulados foram aplicados ao material planta com um borrifador de trilha suspenso Mandel equipado com tubeiras 8002E calibradas para fornecer 187 L/ha por uma área de aplicação de 0,503 metros quadrados a uma altura de borribo de 18 polegadas (43 cm) acima da altura média da copa da planta. Plantas de controle foram borrifadas da mesma maneira com um solvente em branco.

[00411] As plantas tratadas e plantas de controle foram colocadas em uma estufa conforme descrito acima e molhadas por subirrigação para evitar a lavagem do composto do teste. Depois de 14 dias, a condição das plantas do teste, se comparadas com aquelas das plantas não tratadas, foi determinada visualmente e elas foram classificadas em uma escala de 0 até 100 por cento, em que 0 corresponde a nenhum dano e 100 corresponde à morte completa. Alguns dos compostos testados, taxas de aplicação empregadas, espécies de plantas testadas, e resultados são dados nas Tabelas 15 e 16.

Tabela 15. Teste Pós - emergência II da atividade herbicida em ervas daninhas latifoliadas chave e espécies de culturas

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
1,01	35	G	n/a	G	G	A	G
	70	G	G	G	G	A	C
	140	F	E	G	G	A	C

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
1,02	35	G	n/t	G	C	E	E
	70	G	B	G	B	E	D
	140	G	B	G	A	D	D
1,03	35	G	n/t	G	B	A	G
	70	G	n/t	G	B	A	G
	140	C	B	G	A	B	E
1,04	35	E	D	F	E	A	E
	70	G	D	E	D	A	E
	140	G	D	E	D	A	B
1,05	35	E	D	F	B	F	A
	70	A	C	E	A	F	A
	140	B	A	D	A	E	A
1,06	35	G	A	C	B	G	G
	70	G	B	B	A	G	G
	140	G	C	B	A	G	G
1,07	35	G	B	G	B	D	A
	70	G	A	G	B	D	A
	140	G	A	G	B	D	A
1,08	35	B	A	E	A	A	B
	70	A	A	C	A	A	A
	140	A	A	B	A	A	A
1,09	35	A	A	A	A	B	A
	70	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A
1,10	35	G	G	G	A	G	G
	70	G	B	G	A	G	G
	140	G	A	G	A	G	E
1,13	35	G	G	G	D	G	E
	70	G	F	G	C	G	D
	140	G	F	F	B	F	D
1,14	35	G	C	E	D	G	D
	70	G	B	D	D	G	C
	140	G	B	C	C	D	C

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
1,15	35	A	A	C	A	A	A
	70	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	A
1,16	35	B	A	A	A	A	A
	70	A	A	A	A	A	A
	140	A	A	A	A	A	B
1,17	35	E	A	A	A	A	A
	70	E	A	A	A	A	A
	140	D	A	A	A	A	A
1,19	35	A	A	A	A	A	D
	70	A	A	A	A	A	C
	140	A	A	A	A	A	A
1,20	35	E	C	A	A	A	A
	70	D	B	A	A	A	A
	140	D	A	A	A	A	A
1,21	35	D	G	G	E	C	E
	70	D	G	G	B	B	C
	140	D	E	D	B	A	C
1,22	35	G	C	E	G	E	C
	70	G	C	D	G	C	B
	140	G	B	D	G	B	B
1,23	35	A	A	D	A	A	D
	70	A	A	C	A	A	C
	140	A	A	B	A	A	B
1,24	35	B	A	B	B	A	D
	70	A	A	E	A	A	C
	140	A	A	A	A	A	B
1,25	35	G	C	D	G	G	G
	70	G	B	C	D	G	G
	140	F	A	B	D	F	G
1,26	35	G	C	B	G	G	G
	70	G	B	A	F	F	G
	140	G	A	A	F	E	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
1,27	35	D	D	B	B	A	G
	70	B	A	A	B	A	G
	140	B	A	A	B	A	G
1,28	35	B	G	C	E	G	A
	70	B	G	B	D	G	A
	140	A	D	B	D	G	A
1,29	35	G	E	C	E	G	D
	70	G	G	C	E	G	D
	140	G	G	B	C	G	C
1,30	35	G	G	E	F	G	G
	70	G	C	E	F	E	G
	140	C	D	D	E	D	G
1,31	35	E	D	B	A	A	F
	70	D	A	A	A	A	E
	140	D	A	A	A	A	D
1,32	35	G	G	F	G	G	E
	70	G	F	E	G	D	D
	140	G	D	D	C	B	C
1,33	35	G	D	A	G	E	D
	70	G	D	A	E	D	D
	140	G	C	A	D	C	C
1,34	35	G	G	C	G	G	B
	70	G	G	B	E	G	A
	140	G	F	A	D	D	A
1,35	35	G	C	A	G	C	F
	70	G	B	A	G	C	D
	140	G	A	A	B	B	A
1,37	35	G	G	F	G	G	G
	70	G	G	D	G	G	G
	140	G	G	C	G	G	G
1,39	35	G	A	C	A	B	G
	70	G	A	B	C	C	G
1,40	35	G	n/t	G	G	G	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
	70	G	A	G	G	G	F
	140	G	n/t	G	G	G	E
1,43	35	G	A	G	C	G	D
	70	G	A	G	B	G	C
	140	D	A	G	B	F	C
1,44	35	G	B	G	B	E	G
	70	C	A	G	B	C	G
	140	B	A	F	A	B	G
1,45	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	E	G	G	G	F
1,46	35	G	G	G	C	G	G
	70	G	G	G	B	G	F
	140	G	D	G	A	G	E
1,47	35	G	G	G	C	G	G
	70	G	G	G	C	G	G
	140	G	F	G	B	G	E
1,48	140	G	G	G	D	G	C
1,49	35	B	G	G	B	G	G
	70	B	F	G	B	G	G
	140	B	G	G	A	G	E
2,02	35	E	C	G	A	C	C
	70	B	A	F	A	A	B
	140	B	A	F	A	A	A
2,03	35	A	D	G	B	E	G
	70	A	B	G	A	C	D
	140	A	B	G	A	C	C
	280	A	A	F	A	B	B
2,04	35	C	A	G	A	A	G
	70	B	A	G	A	A	G
	140	A	A	F	A	A	F
2,05	35	G	B	G	G	F	G
	70	G	C	G	G	F	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
	140	G	A	G	E	E	F
2,06	35	G	C	F	D	F	D
	70	G	A	D	C	C	C
	140	C	A	B	B	A	B
2,09	35	B	B	D	A	A	D
	70	B	A	C	A	A	C
	140	B	A	B	A	A	B
2,10	35	D	B	F	B	A	C
	70	D	A	D	A	A	B
	140	B	A	C	B	A	A
2,11	35	A	A	C	A	A	E
	70	A	A	B	A	A	D
	140	A	A	A	A	A	C
2,12	35	B	A	C	A	A	F
	70	A	A	B	A	A	D
	140	A	A	A	A	A	D
2,13	35	A	D	A	A	A	C
	70	A	A	A	A	A	B
	140	A	A	A	A	A	A
2,14	35	G	A	A	B	B	D
	70	G	A	A	A	A	B
	140	G	A	A	A	A	A
2,15	35	E	A	E	A	G	E
	70	C	A	C	A	G	C
	140	A	A	B	A	G	C
2,16	35	B	A	E	A	G	A
	70	A	A	D	A	G	A
	140	A	A	D	A	G	A
2,17	140	C	A	C	A	A	B
2,18	35	G	A	E	B	G	C
	70	G	A	D	B	G	C
	140	G	A	D	B	G	B
2,19	35	A	A	G	A	G	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
	70	A	A	D	A	G	C
	140	A	A	D	A	G	C
2,20	35	E	A	G	B	G	B
	70	D	A	G	A	G	A
	140	D	A	F	A	G	A
2,21	35	F	A	F	B	G	D
	70	D	A	F	B	G	C
	140	D	A	E	A	G	C
2,22	35	F	A	G	A	G	C
	70	F	A	E	A	G	B
	140	E	A	D	A	G	A
2,23	35	G	A	G	A	G	B
	70	G	A	G	A	G	A
	140	G	A	G	A	G	A
2,24	35	C	A	D	A	D	C
	70	C	A	C	A	C	C
	140	A	A	C	A	C	B
2,25	35	C	A	G	A	G	G
	70	C	A	E	A	C	F
	140	A	A	C	A	B	B
2,26	35	E	A	E	A	E	C
	70	D	A	D	A	D	A
	140	D	A	D	A	C	A
3,01	35	D	B	G	A	G	C
	70	D	A	G	A	G	C
	140	C	A	G	A	G	B
3,02	35	G	A	G	B	G	D
	70	G	A	G	B	G	C
	140	G	A	G	B	G	B
3,03	35	A	A	G	A	A	A
	70	A	A	D	A	A	A
	140	A	A	D	A	A	A
3,05	35	B	F	G	C	D	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
	70	B	E	G	B	D	G
	140	A	D	G	B	C	F
	280	A	B	G	B	B	E
3,06	35	E	B	F	F	G	A
	70	D	B	F	D	G	A
	140	B	A	E	D	F	A
3,07	35	G	G	E	G	G	B
	70	G	D	D	G	G	B
	140	G	C	D	C	G	B
3,08	35	G	G	G	B	D	D
	70	F	F	G	B	C	C
	140	F	D	F	B	B	B
3,09	35	G	F	E	B	A	D
	70	G	C	B	B	A	C
	140	E	B	A	A	A	B
3,10	35	G	A	G	C	G	B
	70	G	A	G	C	G	B
	140	G	A	G	C	G	B
3,11	35	G	n/a	G	B	G	B
	70	G	n/a	G	B	G	B
	140	G	n/a	G	B	G	B
3,12	35	D	D	G	A	D	B
	70	A	D	G	A	D	B
	140	A	B	F	A	B	B
3,13	35	G	A	G	B	G	B
	70	G	A	G	A	G	B
	140	C	A	D	A	D	B
3,14	35	G	B	G	B	F	B
	70	G	A	G	B	F	B
	140	G	A	G	A	D	A
3,15	35	B	A	F	B	C	D
	70	A	A	E	B	C	D
	140	A	A	E	A	B	B

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
3,16	35	D	B	G	B	D	G
	70	D	A	G	B	D	G
	140	C	B	E	B	D	G
3,17	35	G	C	G	B	E	G
	70	E	A	G	A	D	G
	140	D	A	D	A	C	F
3,18	35	D	D	G	F	E	A
	70	C	C	G	D	G	A
	140	C	A	G	D	F	A
3,19	35	G	D	G	D	G	B
	70	G	A	G	D	G	B
	140	D	C	G	C	G	B
3,20	35	G	G	F	B	C	C
	70	G	D	D	A	A	B
	140	G	D	D	A	A	B
3,21	35	G	A	C	B	C	D
	70	F	A	B	B	B	D
	140	E	A	A	A	A	C
3,22	35	G	D	G	D	A	C
	70	G	A	F	C	A	B
	140	G	A	D	B	A	B
3,23	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	E	G	G
	140	G	G	G	B	G	G
3,24	35	G	B	E	B	G	D
	70	G	B	E	A	G	D
	140	G	A	E	A	G	B
3,25	140	G	A	C	A	G	E
3,27	35	G	B	E	C	G	E
	70	G	A	D	B	G	D
	140	E	A	D	A	G	C
	280	C	A	B	A	G	B
4,01	35	G	G	G	G	G	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
	70	G	E	G	D	G	G
	140	G	D	G	D	G	G
4,03	35	G	G	G	A	E	G
	70	G	E	G	A	D	E
	140	G	C	G	A	C	D
4,05	35	G	G	G	B	D	D
	70	G	A	G	B	A	D
	140	E	A	E	A	A	A
4,06	35	G	C	D	G	E	E
	70	G	A	C	E	D	D
	140	G	A	B	A	B	C
4,07	140	E	n/t	E	G	D	A
4,08	140	G	n/t	D	A	G	B
4,09	35	G	G	G	E	G	G
	70	G	E	G	C	G	F
	140	G	B	D	B	G	E
4,10	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	A	G	G	G	G
	140	G	A	G	G	G	E
4,13	35	G	n/t	G	G	G	G
	70	G	n/t	G	G	G	G
	140	G	n/t	G	D	G	G
5,01	35	D	C	B	D	n/t	B
	70	D	B	A	B	A	B
	140	D	B	A	B	n/t	A
6,01	35	B	B	A	A	G	B
	70	B	A	A	A	B	B
	140	B	A	A	A	A	B
6,02	35	B	A	A	A	A	A
	70	B	A	A	A	A	A
	140	B	A	A	A	A	A
7,02	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	C	G	G

Nº C.	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 Dias Após a Aplicação					
		ABUTH	AMARE	BRSNN	CHEAL	EPHHL	HELAN
	140	G	G	G	A	G	G
8,01	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G

ABUTH: abutilon (*Abutilon theophrasti*)

AMARE: amaranto (*Amaranthus retroflexus*)

BRSNN: canola (*Brassica napus*)

CHEAL: quenopódio (*Chenopodium album*)

EPHHL: euforbia (*Euphorbia heterophylla*)

HELAN: girassol (*Helianthus annuus*)

g ia/ha: gramas de ingrediente ativo por hectare

n/t: não testado

**Tabela 16.** Teste de pós-emergência II da atividade herbicida em grammas chave e tiriricas bem como em culturas de grammas

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g ia/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
1,01	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	n/t	G	G	G	A
	140	G	C	G	G	G	B
1,02	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	E	G	G	G	G
1,03	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	D	G	G	G	G
1,04	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	n/t	G	G	G	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
	140	G	B	G	G	G	G
1,05	35	G	G	F	G	G	G
	70	G	G	E	G	F	F
	140	G	D	D	G	E	E
1,06	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	D	G	G	G	G
	140	G	C	G	G	G	G
1,07	35	G	G	D	G	G	G
	70	G	G	C	G	G	G
	140	G	G	C	G	G	G
1,08	35	G	B	G	G	G	E
	70	G	A	D	G	G	C
	140	G	A	C	G	F	B
1,09	35	F	A	B	G	G	D
	70	C	A	B	G	G	C
	140	B	A	B	G	G	C
1,10	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,12	35	G	G	C	G	E	G
	70	G	G	D	G	G	G
	140	G	B	C	G	G	G
1,13	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,14	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,15	35	G	C	D	G	E	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
	70	D	B	D	G	D	F
	140	E	A	B	F	D	D
	35	G	C	D	F	F	G
1,16	70	D	B	C	D	D	F
	140	B	A	B	D	D	D
	35	E	B	C	G	D	D
1,17	70	E	B	B	G	D	C
	140	E	B	B	G	D	C
	35	B	B	D	F	D	D
1,19	70	C	B	C	E	C	D
	140	A	A	B	D	C	B
	35	G	G	E	G	G	F
1,20	70	G	D	C	G	E	E
	140	G	C	B	G	D	D
	35	G	G	n/t	G	G	G
1,21	70	G	G	n/t	G	G	G
	140	G	G	n/t	G	G	G
	35	G	G	G	G	G	G
1,22	70	G	G	D	G	G	G
	140	G	G	B	G	G	G
	35	G	G	G	G	G	G
1,23	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	D	D	G	F	G
	35	G	G	G	G	G	G
1,24	70	G	G	E	G	F	G
	140	G	G	D	G	E	G
	35	G	G	G	G	G	G
1,25	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
	35	G	G	G	G	G	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
1,26	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,27	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,28	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	F	G
	140	G	G	G	G	F	G
1,29	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	F	G	G	G	G	G
1,30	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,31	35	G	C	D	G	C	G
	70	G	C	C	G	G	G
	140	G	B	B	G	F	G
1,32	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,33	35	G	G	G	G	G	n/t
	70	G	G	G	G	G	n/t
	140	G	G	G	G	F	n/t
1,34	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	D	G	F	G
1,35	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	F	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
	140	G	G	G	G	E	G
1,37	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,39	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
1,40	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,43	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,44	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,45	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,46	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,47	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
1,48	140	G	G	G	G	G	G
2,02	35	G	B	D	G	G	A
	70	G	B	D	G	F	A
	140	G	A	C	G	E	A
2,03	35	G	F	G	G	G	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
	70	G	D	G	G	G	G
	140	G	B	F	G	G	G
	280	G	A	F	G	G	D
2,04	35	G	D	D	G	G	D
	70	G	A	C	G	F	C
	140	F	A	B	G	E	B
2,05	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
2,06	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	E	G	G	G	G
	140	G	A	G	G	G	G
2,08	35	G	B	E	G	G	E
	70	G	B	D	F	G	D
	140	G	A	B	F	G	D
2,09	35	G	D	E	G	G	E
	70	G	B	D	F	G	D
	140	G	B	D	F	G	D
2,10	35	G	D	D	G	G	G
	70	G	D	D	F	F	F
	140	F	B	C	F	D	E
2,11	35	G	B	E	G	G	E
	70	G	A	D	G	G	D
	140	F	A	C	G	F	B
2,12	35	G	A	E	G	G	G
	70	G	A	D	G	G	F
	140	G	A	D	G	G	D
2,13	35	F	C	G	G	G	G
	70	B	A	E	F	E	F

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
	140	B	A	D	F	E	E
2,14	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	C	G	G	G	G
2,15	35	G	G	G	G	G	A
	70	G	E	G	G	G	A
	140	G	C	G	G	G	A
2,16	35	G	G	G	G	G	E
	70	G	G	G	G	G	A
	140	G	G	G	G	G	A
2,17	140	A	C	G	G	G	F
2,18	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
2,19	35	G	G	n/t	G	G	G
	70	G	G	n/t	G	G	G
	140	G	G	n/t	G	G	G
2,20	35	G	n/t	G	G	G	G
	70	G	n/t	F	G	G	G
	140	G	n/t	D	G	G	G
2,21	35	G	n/t	G	G	G	G
	70	G	n/t	G	G	G	G
	140	G	n/t	G	G	G	G
2,22	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
2,23	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
2,24	35	D	G	G	G	G	G
	70	C	G	G	G	G	F
	140	B	G	G	G	G	D
2,25	35	G	G	G	G	G	G
	70	F	G	G	G	G	G
	140	C	G	G	G	G	E
2,26	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,01	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	E
	140	G	G	G	G	G	D
3,02	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	D
	140	G	G	G	G	G	D
3,03	35	E	B	G	G	G	A
	70	E	A	B	G	F	A
	140	E	A	B	G	E	A
3,05	35	G	E	G	G	G	G
	70	G	C	G	G	G	G
	140	G	B	F	G	G	E
	280	G	B	D	G	G	D
3,06	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,07	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,08	35	G	G	G	G	E	F

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
	70	G	G	G	G	D	D
	140	F	C	G	G	D	C
	35	G	B	G	G	D	D
3,09	70	G	B	G	G	C	C
	140	G	B	G	G	B	B
	35	G	G	G	G	G	D
3,10	70	G	G	G	G	G	D
	140	G	G	G	G	G	D
	35	G	G	G	G	G	G
3,11	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
	35	G	B	G	G	G	A
3,12	70	G	B	G	G	G	A
	140	G	B	G	G	G	A
	35	G	D	n/t	G	G	D
3,13	70	G	D	n/t	G	G	D
	140	G	C	n/t	G	G	D
	35	G	G	G	G	G	G
3,14	70	G	G	G	G	G	F
	140	G	G	G	G	G	D
	35	G	C	G	G	G	D
3,15	70	G	C	G	G	G	D
	140	G	A	G	G	G	D
	35	G	C	G	G	G	D
3,16	70	G	C	G	G	G	D
	140	E	C	G	G	G	C
	35	G	E	G	G	G	F
3,17	70	G	D	G	G	G	D
	140	G	A	F	G	G	C

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
3,18	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,19	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,20	35	F	G	G	G	G	G
	70	F	E	G	G	G	C
	140	B	D	D	G	F	B
3,21	35	G	C	G	G	F	F
	70	G	B	F	F	F	D
	140	G	B	D	F	E	C
3,22	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,23	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,24	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
3,25	140	G	G	G	G	G	G
3,27	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
	280	G	G	G	G	G	G
4,01	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHC G	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
4,03	35	G	D	n/t	G	G	G
	70	G	C	n/t	G	G	G
	140	G	C	n/t	G	G	G
4,05	35	G	n/t	n/t	G	G	G
	70	G	n/t	n/t	G	G	D
	140	G	B	A	G	G	D
4,06	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	E	G	G	G	G
	140	G	C	E	G	G	G
4,07	140	G	G	G	G	G	G
4,08	140	G	G	G	G	G	G
4,09	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
4,10	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
4,13	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
5,01	35	n/t	C	G	G	G	G
	70	n/t	C	G	G	G	G
	140	n/t	B	G	G	G	G
6,01	35	E	G	G	G	G	G
	70	E	E	G	G	G	G
	140	E	D	G	G	G	G
6,02	35	E	C	G	G	G	G
	70	E	C	E	G	G	G
	140	E	B	D	G	F	G

Nº do Composto	Taxa de Aplicação (g/ha)	Redução do Crescimento Visual (%) 14 dias após a Aplicação					
		CYPES	ECHCG	SETFA	ORYSA	TRZAS	ZEAMX
7,02	35	G	G	n/t	G	G	G
	70	G	G	n/t	G	G	G
	140	G	G	n/t	G	G	G
8,01	35	G	G	G	G	G	G
	70	G	G	G	G	G	G
	140	G	G	G	G	G	G
9,01	140	G	G	G	G	G	G

[0050] ECHCG: capim arroz (*Echinochloa crus-galli*)

[0051] CYPES: tiririca amarela (*Cyperus esculentus*)

[0052] ORYSA: arroz (*Oryza sativa*)

[0053] SETFA: foxtail gigante (*Setaria faberi*)

[0054] TRZAS: trigo estivo (*Triticum aestivum*)

[0055] ZEAMX: milho (*Zea mays*)

[0056] g/ha: gramas de ingrediente ativo por hectare

[0057] n/t: não testado

Exemplo D. Avaliação da atividade herbicida pós emergente em trigo e cevada

[00412] Teste III de pós-emergência. Sementes das espécies de plantas de teste desejadas foram plantadas em uma mistura de plantio Sun Gro MetroMix® 306, que tipicamente possui um pH de 6,0 a 6,8 e um teor de matéria orgânica de aproximadamente 30 por cento, em potes plásticos com uma área de superfície de 103,2 centímetros quadrados (cm<sup>2</sup>). Quando requisitado para garantir uma boa germinação e plantas saudáveis, foi aplicado um tratamento fungicida e/ou um outro tratamento químico ou físico. As plantas foram cultivadas por 7-36 dias (d) em uma estufa com um fotoperíodo aproximado de 14 horas (h) que foi mantido a aproximadamente 18°C durante o dia e 17°C durante

a noite. Nutrientes e água foram adicionados em uma base regular e iluminação suplementar foi fornecida com lâmpadas de 1000-Watts de haleto metálico suspensas se necessário. As plantas foram empregadas para teste quando elas atingiram o segundo ou terceiro estágio de folha verdadeiro.

[00413] Uma quantidade pesada, determinada pela mais alta taxa a ser testada, de cada composto teste foi colocada em um frasco de vidro de 25 mL e foi dissolvida em uma mistura de 4 mL 97:3 v/v de acetona e DMSO para obter as soluções de estoque concentradas. Se o composto do teste não dissolveu prontamente, a mistura foi aquecida e/ou sonicada. As soluções de estoque concentradas obtidas foram diluídas com 20 mL de uma mistura aquosa contendo acetona, água, álcool isopropílico, DMSO, concentrado de óleo de cultura Agri-Dex e, agente tenso ativo X-77 em uma proporção de 48:39:10:1,5:1,5:0,02 v/v para obter soluções de borrifo contendo as maiores taxas de aplicação. Taxas de aplicação adicionais foram obtidas por diluição em série de 12 mL da solução de maior taxa em uma solução contendo 2 mL da mistura 97:3 v/v de acetona e DMSO e 10 mL de uma mistura aquosa contendo acetona, água, álcool isopropílico, DMSO, concentrado de óleo de cultura Agri-Dex, e agente tenso ativo X-77 em uma proporção de 48:39:10:1,5:1,5:0,02 v/v para obter taxas 1/2X, 1/4X, 1/8X e 1/16X da alta taxa. As exigências do composto são baseadas em volume de aplicação de 12 mL a uma taxa de 187 litros por hectare (l/ha). Compostos formulados foram aplicados ao material planta com um borrifador de trilha suspenso Mandel, equipado com tubeiras 8002E calibradas para fornecer 187 l/ha por uma área de aplicação de 0,503 metros quadrados a uma altura de borrifo de 18 polegadas (43 cm) acima da altura média da copa da planta. Plantas de controle foram borrifadas da mesma maneira com o solvente em branco.

[00414] As plantas tratadas e plantas de controle foram colocadas

em uma estufa, conforme descrito acima, e irrigadas por subirrigação para evitar a lavagem completa dos compostos teste. Após 21 dias, a condição das plantas do teste se comparadas com aquelas das plantas não tratadas foi determinada visualmente e avaliada em uma escala de 0 até 100 por cento, em que 0 corresponde a nenhum dano, e 100 corresponde ao extermínio completo.

[00415] Aplicando a análise Probit bem aceita conforme descrito por J. Berkson no *Journal of the American Statistical Society*, 48, 565 (1953) e por D. Finney em "*Probit Analysis*" Cambridge University Press (1952), os dados acima podem ser usados para calcular os valores GR<sub>20</sub>, GR<sub>50</sub>, GR<sub>80</sub> e GR<sub>90</sub>, que são definidos como fatores da redução do crescimento que correspondem à dose eficaz de herbicida requisitado para matar ou controlar 20 por cento, 50 por cento, 80 por cento ou 90 por cento, respectivamente, de uma planta alvo.

[00416] Alguns dos compostos testados, taxas de aplicação empregadas, espécies de plantas testadas, e resultados são dados na Tabela 17.

**Tabela 17: Atividade dos Compostos herbicidas em trigo e cevada**

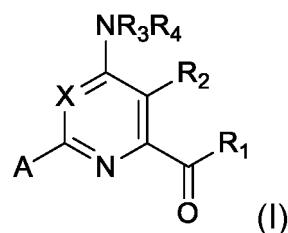
Redução do crescimento Visual (%) 21 Dias após a aplicação	VIOTR	E	D	C	--	22	63	111	E	D	C	--	19	56	99
	VERPE	A	A	A	--	0,28	2	6	A	A	A	--	0,0004	0,05	1
	SINAR	A	A	A	--	4	8	12	B	A	A	--	5	11	17
	SASKR	C	C	B	--	7	30	95	D	C	B	--	10	28	78
	PAPRH	A	A	A	--	0,06	1	2	A	A	A	--	0,0004	0,0004	0,0004
	MATCH	F	E	D	--	45	>140	>140	B	A	A	--	3	9	16
	LAMPU	A	A	A	--	0,1	1	2	C	A	A	--	3	10	19
	KCHSC	D	B	B	--	6	28	67	C	B	A	--	7	20	39
	GALAP	D	B	A	--	9	23	37	F	E	A	--	26	34	40
	CIRAR	F	D	C	--	30	70	109	D	B	A	--	9	25	43
	TRZAS	F	E	D	13	--	--	--	G	G	F	41	--	--	--
HORVS	F	E	E	8	--	--	--	G	G	F	44	--	--	--	
Taxa de Aplicação Rate] (g ia/ha)	17,5	35	70	GR20	GR50	GR80	GR90	17,5	35	70	GR20	GR50	GR80	GR90	
Composto N°.,	1,15							1,16							

174/175

Redução do crescimento Visual (%) 21 Dias após a aplicação	VIOTR	G	E	D	--	44	119	>140	E	D	C	--	24	78	>140
	VERPE	B	B	A	--	1	8	21	F	D	C	--	30	66	100
	SINAR	C	C	A	--	3	14	32	B	A	A	--	6	13	19
	SASKR	F	E	C	--	29	90	>140	D	B	B	--	3	28	95
	PAPRH	D	A	A	--	11	17	22	D	D	C	--	24	52	77
	MATCH	G	G	G	--	>140	>140	>140	G	G	G	--	114	>140	>140
	LAMPU	B	A	A	--	3	6	9	E	D	C	--	15	93	>140
	KCHSC	F	E	D	--	35	110	>140	D	C	B	--	4	33	103
	GALAP	A	A	A	--	1	4	7	D	B	B	--	7	23	44
	CIRAR	G	G	G	--	>140	>140	>140	D	C	B	--	14	35	57
	TRZAS	G	G	G	66	--	--	--	G	G	F	52	--	--	--
	HORVS	G	G	G	>140	--	--	--	G	G	G	66	--	--	--
Taxa de Apli-cação Rate (g ia/ha)		17,5	35	70	GR20	GR50	GR80	GR90	17,5	35	70	GR20	GR50	GR80	GR90
Composto N <sup>o</sup> ,		1,23						1,24							

## REIVINDICAÇÕES

1. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta a Fórmula:



na qual

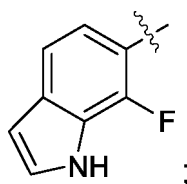
X é CF;

R<sup>1</sup> é OR<sup>1'</sup>, sendo que R<sup>1'</sup> é hidrogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> alquila ou C<sub>7</sub>-C<sub>10</sub> arilalquila;

R<sup>2</sup> é cloro, metóxi ou vinila;

R<sup>3</sup> e R<sup>4</sup> são hidrogênio; e

A é



ou um N-óxido ou sal agricolamente aceitável do mesmo.

2. Composto, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R<sup>2</sup> é cloro.

3. Composto, de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que é ácido 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolínico.

4. Composto, de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que é 4-amino-3-cloro-5-flúor-6-(7-flúor-1H-indol-6-il)picolinato de metila.

5. Processo para controle de vegetação indesejável, caracterizado pelo fato de que compreende:

(a) contatar vegetação indesejável ou uma área adjacente à vegetação, ou

(b) contatar pré-emergente o solo ou a água,  
com uma quantidade herbicida eficaz de pelo menos um composto, como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, ou uma composição herbicida, como definida em qualquer uma das reivindicações 5 a 8.