



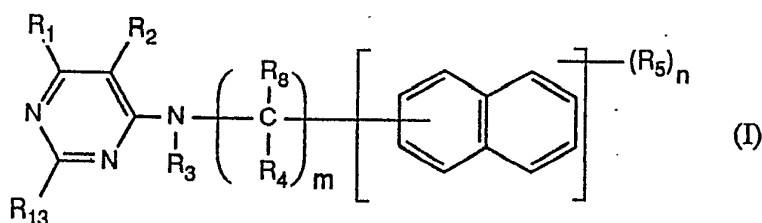
CIBA-GEIGY AG

"PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE PESTICIDAS A BASE DE DERIVADOS DE
PIRIMIDINA"

MEMÓRIA DESCRITIVA

Resumo

O presente invento diz respeito a um processo para a
preparação de compostos da fórmula I

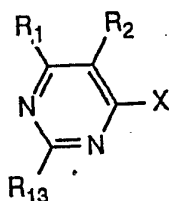


em que R_1 , R_2 , R_3 , R_4 e R_8 são, por exemplo, hidrogénio ou C_1 - C_5 alquilo; R_5 é, por exemplo, halogénio ou C_1 - C_3 ; R_6 é C_1 - C_5 alquilo ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1 - C_3 alquilo; R_7 é, por exemplo, fenilo ou benzilo; R_{13} é, por exemplo, hidrogénio ou C_1 - C_4 alquilo; m é 1, 2 ou 3; e n é 0, 1, 2 ou 3.

Os novos compostos têm propriedades biocidas importan-
tes. Podem ser usados na protecção das colheitas para protecção

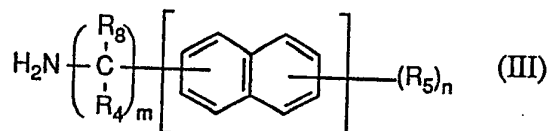
das plantas cultivadas contra o ataque de pragas, e para o controle dessas pragas.

O referido processo consiste na reacção de um composto da fórmula (II):



(II),

em que X é um radical facilmente removível, com um composto da fórmula (III):

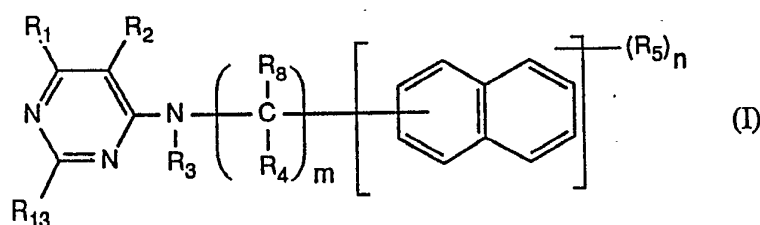


de preferência na presença de uma base, e, se desejado, a introdução em seguida do substituinte R₃ (alquilo, benzilo, acilo ou -S-R₇) por meio de correspondente alquilação em N, benzilação em N, acilação em N ou ticalquilação em N ou ticarilação em N, respectivamente.



O presente invento relaciona-se com compostos da fórmula I, com processos para a sua preparação e com a sua utilização para o controlo de pragas, e com pesticidas que compreendem aqueles compostos como ingrediente activo, juntamente com um veículo apropriado.

Nos compostos da fórmula I



R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi ou por $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; C_2-7 alquenilo que é não substituído ou substituído por halogénio; C_3-C_7 cicloalquilo; halogénio ou C_2-C_4 alquinilo;

R_2 é hidrogénio; hidroxí; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; C_1-C_4 alcoxi;

$S(O)_p-C_1-C_4$ alquilo; halogénio, nitro, ciano; amino; NHR_3 ;

$N(R_3)R_9$; ou $N=C(R_9)R_{10}$;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por C_1-C_7

cicloalquilo; R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_2-C_6 alcóxialquilo; C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxi; C_1-C_3 haloalquiltio; CN ; NO_2 ; ou um grupo $-X$ -fenilo que ocorre uma vez no anel naftilo e que é não substituído ou é mono- a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi; R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

R_{13} é hidrogénio; C_1-C_4 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; ciclopropilo; halogénio; C_1-C_3 alquiltio; ou $-N(C_1-C_3 \text{ alquilo})_2$; X é oxigénio ou enxofre;

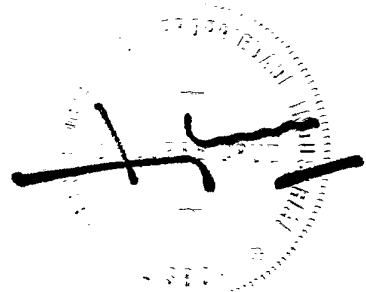
m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

É dada preferência a compostos da fórmula I em que:

1.1 R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 alquilo substituído por $S(O)_p-FIR-C_3$ alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 5 átomos



de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; C_2-C_7 alquênilo; C_2-C_7 haloalquênilo tendo 1 ou 2 átomos de halogénio; C_3-C_6 -cicloalquilo; halogénio; ou C_2-C_4 alquinilo;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 5 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_2-C_1-C_3$ alquilo; amino; $NHRF3r$; $N(R_3)^{F9R}$; $N=C(R_9)R_{10}$ ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_9 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_1-C_6 alcóxialquilo; C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxi; C_1-C_3 haloalquiltio; CN ; NO_2 ; ou um grupo X -fenilo que ocorre no anel naftilo e que é não substituído ou mono- a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre;

R_7 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

1.2 R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo substituído por $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_2-C_5 haloalquênilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 cicloalquilo; halogénio; ou C_2-C_4 alquínilo;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_1-C_6 alcóxialquilo; C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxí; C_1-C_3 haloalquiltio; CN ; NO_2 ; ou um grupo X-fenilo que ocorre no anel naftilo e que é não substituído ou mono- a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcóxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

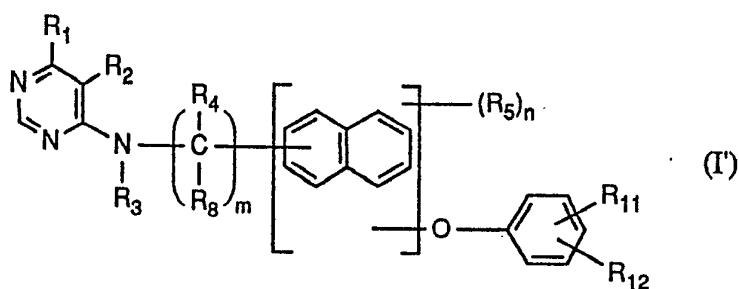
R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

1.3 Também compostos da fórmula I'



em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 alquilo substituído por $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênio; C_2-C_5 haloalquênio tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 cicloalquilo; halogénio; ou C_2-C_4 alquinilo;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_1-C_3 haloalquilo; ou C_1-C_3 haloalcóxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

1.4 Também compostos da fórmula I'

em que

R_1 a R_4 e R_8 são tal como foram definidos na fórmula I;

R_5 é halogénio, C_1-C_3 alquilo, CF_3 , C_2-C_5 alcóxialquilo ou C_1-C_3 alquilo;

m é 1, 2 ou 3; e

n é 0, 1 ou 2.

1.5 Compostos da fórmula I em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquenilo; C_2-C_5 haloalquenilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano;

$S(O)_p-C_1-C_4$ alquilo; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_7$; $N=C(R_7)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou SR_7 ;

R_4 e R_5 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1C_3 alcóxi; C_1-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 haloalquiltio; ciano; ou nitro;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por halogénio, nitro ou por ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por halogénio, nitro ou ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_{13} é hidrogénio ou C_1-C_4 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1 ou 2; e

p é 0, 1 ou 2.

1.6 Compostos do grupo 1.5 em que:

R_1 é C_1-4 alquilo; CF_3 ; C_2-C_5 alcoxiálquilo; C_2-C_4 alquênilo;

C_2-C_4 monohaloalquênilo; ou halogênio;

R_2 é C_1-C_5 alquilo ou halogênio;

R_3 é hidrogênio ou C_1-C_3 alquilo;

R_4 é hidrogênio; C_1-C_3 alquilo; ou ciclopropilo;

R_5 é halogênio; C_1-C_2 alquilo; ou C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é hidrogênio;

n é 0, 1 ou 2; e

m é 1.

1.7 Compostos do grupo 1.6 em que:

R_1 é C_1-C_4 alquilo; CF_3 ; C_2-C_4 alcoxiálquilo; C_2-C_4 alquênilo; ou halogênio;

R_2 é C_1-C_4 alquilo ou halogênio;

R_3 é hidrogênio ou C_1-C_3 alquilo;

R_4 é hidrogênio ou C_1-C_3 alquilo;

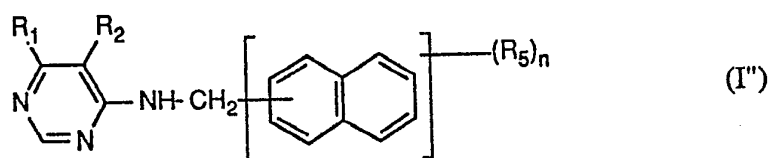
R_5 é halogênio; metilo; etilo; ou metoxi;

R_6 é hidrogênio;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

m é 1.

1.8 Compostos do grupo 1.7 da fórmula I''



em que:

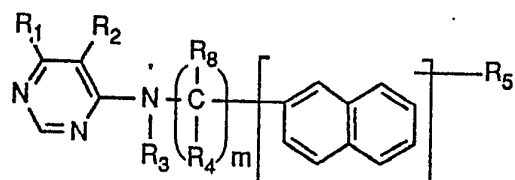
R₁ é C₁-C₄ alquilo, CF₃, C₂-C₄ alcóxialquilo ou halogénio;

R₂ é C₁-C₄ alquilo ou halogénio;

R₅ é cloro, bromo, metilo, etilo ou metoxi; e

n é 0, 1 ou 2.

1.9 Compostos da fórmula I'''



(I''')

em que:

R_1 é hidrogénio, C_1-C_3 alquilo, CF_3 ou halogénio;

R_2 é hidrogénio, C_1-C_3 alquilo, halogénio, NO_2 ou $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo;

R_3 é hidrogénio;

R_4 é metilo, etilo, isopropilo, n-propilo ou ciclopropilo;

R_8 é hidrogénio, metilo ou etilo; R_5 é hidrogénio, halogénio, C_1-C_3 alquilo, $OCHF_2$, CF_3 , NO_2 ou C_1-C_3 alcoxi;

m é 1 ou 2; e

p é 0, 1 ou 2.

1.10 Compostos do grupo 1.2 em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcoxiálquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_2-C_5

haloalqueno tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_4$ alquilo; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; CDR_6 ; ou SR_7 ;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxi; C_1-C_3 haloalquiltio; ciano; nitro; ou um grupo X-fenilo que ocorre no anel naftilo e que é não substituído ou mono- a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo; R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

1.11 Compostos do grupo 1.10 em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo, C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano;

$S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; amino; NH_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; R_3 é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_2-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 alcóxi; ciano; ou nitro;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

1.12 Compostos do grupo 1.11 em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; CF_3 ; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênio; C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_4$ alquilo; amino; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_2-C_6 alcóxialquilo; haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 haloalquiltio; nitro; ou ciano;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados a partir de halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_3 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 2;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

1.13 Compostos do grupo 1.12 em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; CF_3 ; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; amino; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio;

R_4-R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio;

C_1-C_5 alquilo; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_2-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 haloalquiltio; nitro; ou ciano;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro, e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_3 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

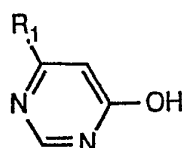
R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 3; n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

Um grupo especial de compostos do presente invento compreende os compostos da fórmula Ia:



(I^a)

em que:

R₁ é C₁-C₅ alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C₁-C₃ alcoxi; C₂-C₇ alquenilo que é não substituído ou substituído por halogénio; C₃-C₇ cicloalquilo; ou halogénio; R₂ é C₁-C₅ alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C₁-C₃ alcoxi; halogénio; nitro; ou ciano;

R₃ é hidrogénio; C₁-C₅ alquilo; benzilo; -CO-R₆ ou -S-R₇;

R₄ é hidrogénio; C₁-C₅ alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C₁-C₃ alcoxi; ou C₃-C₇ cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_1-C_3 alquiltio; ou um grupo -X-fenilo que ocorre uma vez no anel fenilo e que é não substituído ou mono- ou tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo sendo cada um deles não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou

C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre; e

n é 0, 1, 2 ou 3.

Tendo em vista a sua actividade biológica no controlo de pragas, os compostos que se seguem devem ser considerados como preferidos:

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-etilamino]-5-cloro-6-etilpirimidina (comp. 1.2);

(-)-4-[1'-(β -naftil)-etilamino]-5-cloro-6-etilpirimidina (comp. 1.73);

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-propilamino]-5-cloro-6-etilpirimidina (comp. 1.3);

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-etilamino]-5-cloro-6-metilpirimidina
(comp. 1.53);

(d,l)-4-[1'-(2-(6-bromonaftil)-etilamino)-5-cloro-6-etilpirimidina
(comp. 1.149);

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-etilamino]-5-bromo-6-etilpirimidina (comp.
1.84);

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-etilamino]-5-cloro-6-n-propilpirimidina
(comp. 1,86);

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-etilamino]-5-iodo-6-etilpirimidina (comp.
1.100).

Dependendo do número de átomos de carbono indicados, alquilo por si próprio ou como um constituinte de um outro substituinte, tal como haloalquilo, alcoxi ou alquiltio, deve ser considerado como sendo, por exemplo, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo e seus isômeros, por exemplo isopropilo, isobutilo, isocamilo, terc-butilo ou sec-butilo.

C₂-C₇ alquenilo é um radical alifático tendo uma dupla ligação, por exemplo alilo, vinilo, metililo, crotilo, butenilo, pentenilo, etc..

Halogênio é fluoro, cloro, bromo ou iodo.

Haloalquilo indica radicais mono- a per-halogenados, por exemplo CHCl₂, CH₂F, CCl₃, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CH₂Br, C₂Cl₅, CH₂Br, CHBrCl, etc., de preferência CF₃ e CHF₂.

Dependendo do número de átomos de carbono indicados, cicloalquilo é, por exemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo ou cicloheptilo.

Os compostos 4-aminopirimidina são já conhecidos, por exemplo EP-A-264 217. Os compostos da fórmula I de acordo com o invento diferem caracteristicamente dos compostos conhecidos pela combinação de um anel 4-aminopirimidina com um radical naftilalquilo, combinação essa que tem como resultado uma actividade microbicide e insecticide/acaricide inesperadamente elevada nos novos compostos.

Os compostos da fórmula I são óleos, resinas ou sólidos que são estáveis à temperatura ambiente. Podem ser utilizados preventivamente e curativamente no sector agrícola ou em campos afins para o controlo de microorganismos, insectos e pragas destruidoras das plantas da ordem Acarina. Os compostos da fórmula I de acordo com o invento distinguem-se, quando usados em baixas concentrações, não apenas por uma excelente actividade, mas também pelo facto de serem especialmente bem tolerados pelas plantas.

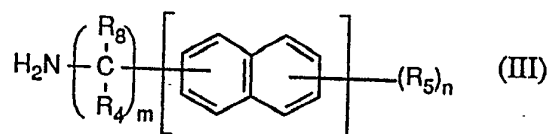
Os compostos da fórmula I podem ter um átomo de carbono assimétrico na posição adjacente a R_4 e podem desse modo apresentar-se sob formas enantioméricas e diastereoisoméricas. Em geral, a preparação destes compostos resulta numa mistura de enantiómeros ou diastereómeros. Estas misturas podem ser clivadas em antipodas ópticos puros de um modo habitual, por exemplo por cristalização fraccionada de sais com ácidos ópticamente activos. Contudo, esses compostos podem também ser preparados selectivamente por métodos diastereo ou enatio-selectivos. Os enantiómeros podem ter actividades biológicas diferentes.

O presente invento relaciona-se assim com compostos racêmicos e com todos os isómeros da fórmula I, com a sua preparação e com a sua utilização na protecção de colheitas, e com composições que compreendem esses compostos como ingredientes activos.

Os compostos da fórmula I podem ser obtidos por várias variantes do processo de preparação, por exemplo por reacção de um composto da fórmula II



em que R_1 , R_2 e R_{13} são tal como foram definidos para a fórmula I e X é um radical rapidamente removível, com um composto da fórmula III



em que R_4 , R_5 , R_3 , m e n são tal como foram definidos para a fórmula I, de preferência na presença de uma base. O substituinte

R_3 (alquilo, benzilo, acilo ou $-S-R_7$) pode ser introduzido por respectivamente, N-alquilação, N-benzilação, N-acilação, N-tioalquilação ou N-tioarilação correspondentes.

Exemplos de radicais rapidamente removíveis são halogénio, tal como cloro, bromo ou iodo; radicais C_1-C_6 alquiltio, tais como metiltio, etiltio ou propiltio; grupos (halo)alcanessulfonilo, tais como mesilo, etanessulfonilo ou trifluorometanessulfonilo; e grupos arilssulfonilo, tais como benzenessulfonilo ou tosililo.

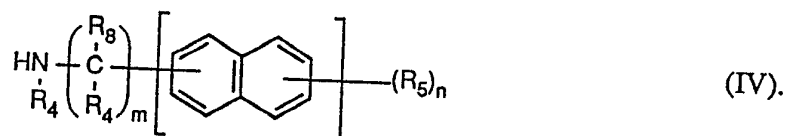
Bases apropriadas para facilitar a remoção de HX são bases inorgânicas, tais como carbonato de potássio ou de sódio, NaH, etc.. Também apropriadas são bases orgânicas tais como, trietilamina, piridina, N,N-dietilanilina, trietilenodiamina, etc.. 4-(N,N-dimetilamino)piridina é preferida devido à sua actividade catalítica.

Os reagentes podem reagir uns com os outros como tal sem a adição de um solvente, por exemplo num estado amolecido. Na maior parte dos casos, contudo, é vantajoso adicionar um solvente ou vários solventes ou diluentes. Podem ser mencionados como exemplos hidrocarbonetos aromáticos, alifáticos e alicíclicos e hidrocarbonetos halogenados, por exemplo benzeno, tolueno, xileno, clorobenzeno, bromobenzeno, éter de petróleo, hexano, ciclohexano, cloreto de metileno, clorofórmio, dicloroetano, tricloroetileno; éteres, tais como éter dietílico, tetrahydrofurano (THF), dioxano, éter terc-butil metílico; cetonas, tais como acetona, metil etil cetona; alcoóis, tais como metanol, etanol, propanol, butanol, etileno glicol, glicerol; amidas, tais como dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida; também acetonitrilo, dimetil sulfoxido (DMSO), e também uma base adicionada em

excesso, tal como piridina, N,N-dietilanilina, trietilamina, etc..

A subsequente N-alquilação ou N-benzilação para introduzir o substituinte R_3 é efectuada de um modo habitual com um haleto de alquilo ou de benzilo, especialmente o brometo correspondente, na presença de uma base forte. Uma N-acilação é realizada de um modo habitual com um ácido C_1-C_6 -alcanecarboxílico ou com ácido benzoico ou com um seu haleto ácido, especialmente um cloreto ou brometo ácido, em solventes inertes. Uma N-tioalquilação ou N-tiocarilação é realizada vantajosamente com o correspondente cloreto de sulfenilo na presença de uma base.

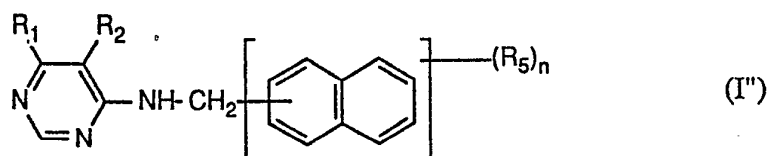
De acordo com uma outra variante do processo, quando o substituinte R_3 é C_1-C_5 alquilo, benzilo ou $-S-R_7$, o composto da fórmula II pode também ser feito reagir directamente com um composto da fórmula IV:



Neste caso, a presença de bases fortes é essencial.

A temperatura nos processos anteriormente referidos varia entre 0°C e 180°C , de preferência entre 20°C e 130°C , e em muitos casos corresponde à temperatura de refluxo do solvente.

Os compostos pirimidina que se seguem da fórmula II' são novos:



em que

R'₁ é CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, n-C₄H₉, CH(CH₃)₂ ou CF₃;

R'₂ é hidrogénio, fluoro, cloro, bromo, iodo, nitro ou amino; e

X' é hidroxí ou cloro;

com a condição de que as condições que se seguem não podem ser aplicadas simultaneamente:

1) R'₁ é CH₃ ou C₂H₅; R'₂ é hidrogénio ou cloro; e X' é hidroxí ou cloro;

2) R'₁ é CH₃; R'₂ é bromo, iodo, nitro ou amino; e X' é hidroxí ou cloro;

3) R'₁ é n-C₃H₇ ou CH(CH₃)₂; R'₂ é hidrogénio; e X' é hidroxí;

4) R'₁ é CF₃; R'₂ é hidrogénio; e X' é hidroxí ou cloro;

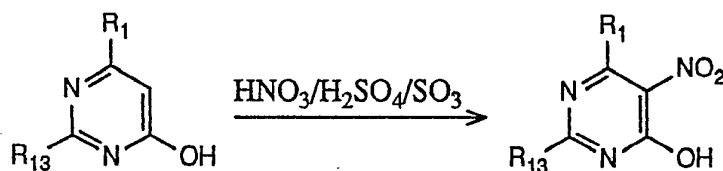
5) R'₁ é CF₃; R'₂ é cloro, bromo ou iodo; e X' é hidroxí;

6) R'_1 é CH_3 ou $n-C_4H_9$; R'_2 é fluoro; e X' é hidroxil.

O presente invento relaciona-se com os novos compostos da fórmula II'.

As pirimidinas da fórmula II são ou já conhecidas ou são preparadas de acordo com métodos gerais de síntese (ver D.J. Brown "The Pyrimidines" in Heterocyclic Compounds).

De acordo com D.J. Brown (ibid., página 10), a azotação das pirimidinas requer pelo menos dois dadores de electrão como substituintes, e por essa razão a azotação de 6-alkil-4-hidroxipirimidinas não ocorre nas condições de azotação habituais mesmo em misturas de 100% de ácido azótico e 100% de ácido sulfúrico. Surpreendentemente, contudo, as 6-alkil-4-hidroxipirimidinas podem ser preparadas em óleo em vez de em 100% de ácido sulfúrico:

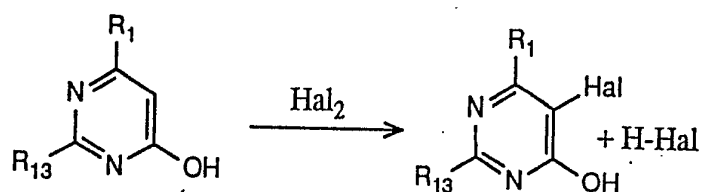


Nesta reacção, é necessário manter as temperaturas tão baixo quanto possível a fim de suprimir reacções secundárias. Provaram ser vantajosas temperaturas variando entre 10°C e 70°C, de preferência entre 20°C e 40°C. Vem a ser considerado como o

óleo H_2SO_4 contendo de 5 a 70% de SO_3 , especialmente de 10 a 40% de SO_3 .

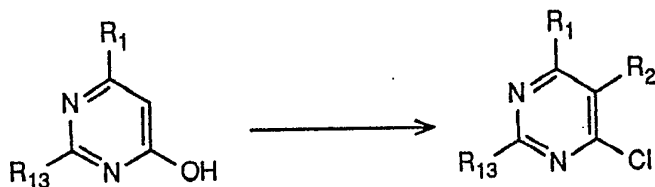
A azotação anteriormente descrita dos compostos da pirimidina constitui um novo processo de preparação, e o presente invento relaciona-se especialmente com esse processo.

Cloro, bromo e iodo podem ser rapidamente introduzidos na posição 5 das 4-hidroxipirimidinas de um modo análogo ao dos métodos descritos na bibliografia:



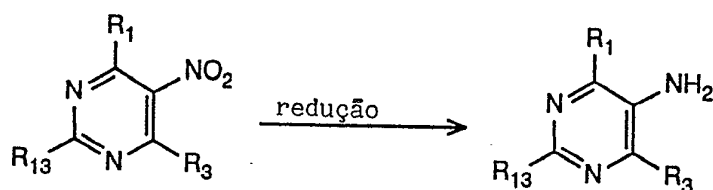
Nesta reacção, os halogénios são introduzidos com medição em solução ou suspensão aquosa das pirimidinas, e o ácido resultante é neutralizado. Ácidos carboxílicos alifáticos, por exemplo ácido acético, são também solventes apropriados para as reacções de halogenação.

As 4-hidroxipirimidinas são convertidas nas 4-cloropirimidinas de acordo com métodos geralmente habituais, de preferência utilizando oxiclureto de fósforo:



é possível realizar esta reacção com um excesso de oxiclureto de fósforo sem um solvente, ou solventes inertes, sendo usados, por exemplo tolueno ou xileno. Em muitos casos, a adição de bases orgânicas, por exemplo dimetil- ou dietil-anilina, tem um efeito vantajoso sobre o rendimento. A reacção é realizada com uma variação de temperatura entre 20° e 140°C, de preferência entre 40° e 100°C.

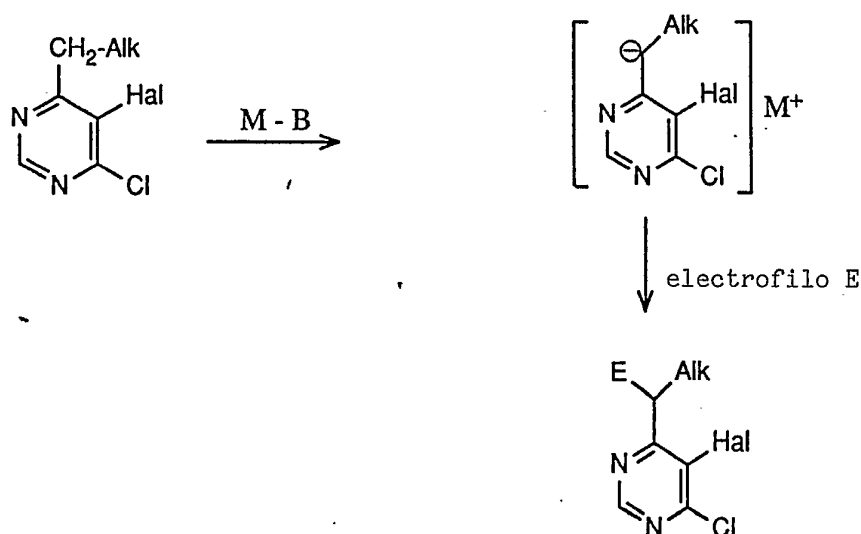
A redução das 5-nitropirimidinas dá origem a 5-aminopirimidinas:



Os agentes redutores geralmente habituais podem ser usados para esta finalidade, por exemplo pó de ferro ou de zinco

em solventes, por exemplo ácido acético, ou hidrogénio activado por um catalisador metálico.

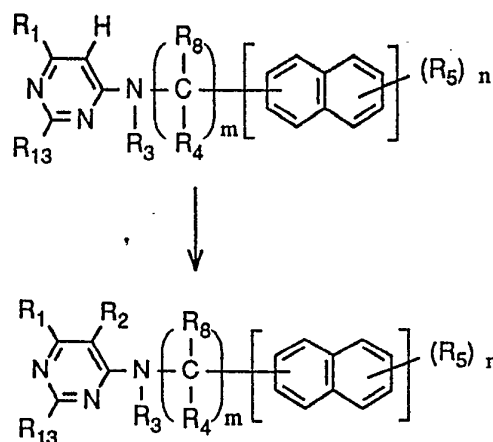
Algumas pirimidinas da fórmula II podem ser preparadas de acordo com o esquema de reacção que se segue.



As bases (M-B) usadas são compostos de metal organo-alcalino/metal terroso alcalino, por exemplo alquiltio, ou, de preferência, compostos de lítio dialquilamino, por exemplo diisopropilamina de lítio. Os electrófilos usados podem ser, por exemplo, compostos de haloalquilo, tais como iodetos de alquilo, brometos de alilo ou alquil-SO₂-S-alquilo, e outros electrófilos geralmente habituais.

Os radicais R₁ e R₂ mencionados nos processos de preparação descritos anteriormente são tal como foram definidos para a fórmula I, e Hal é halogénico.

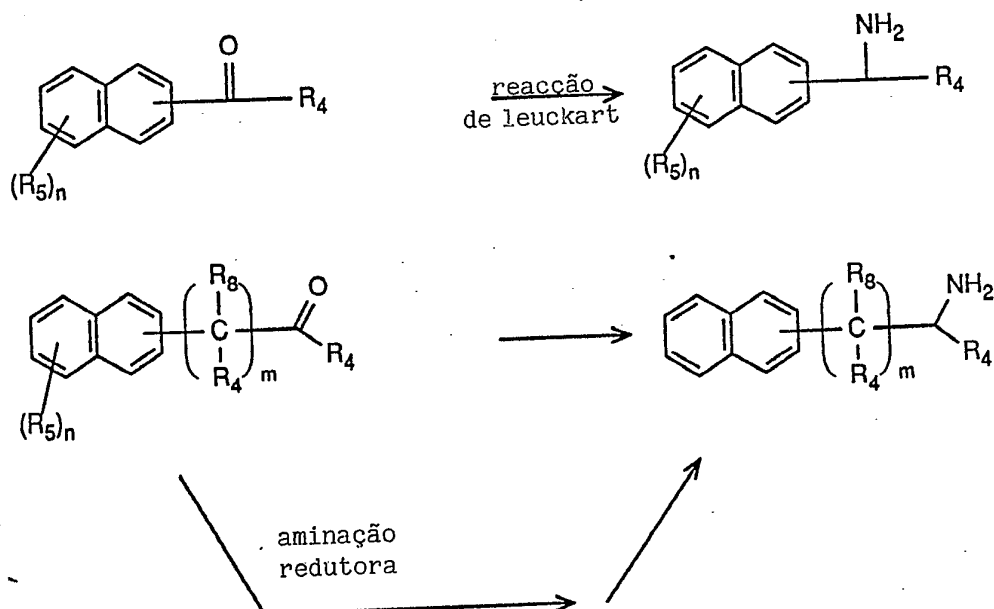
Compostos da fórmula (I) em que R_2 é halogénio ou NO_2 podem também ser preparados por halogenação ou azotação de compostos (I) ($R_2=\text{H}$) que são não substituídos na posição 5.



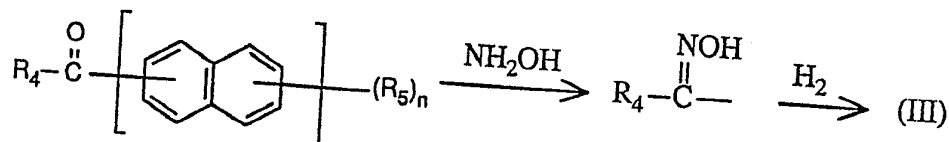
As reacções de halogenação ou de azotação são realizadas nas condições mencionadas anteriormente para a preparação de 4-hidroxipirimidinas.

Os derivados do naftaleno das fórmulas III e IV são também conhecidos na bibliografia, ou podem ser preparados por métodos conhecidos, por exemplo como se segue:

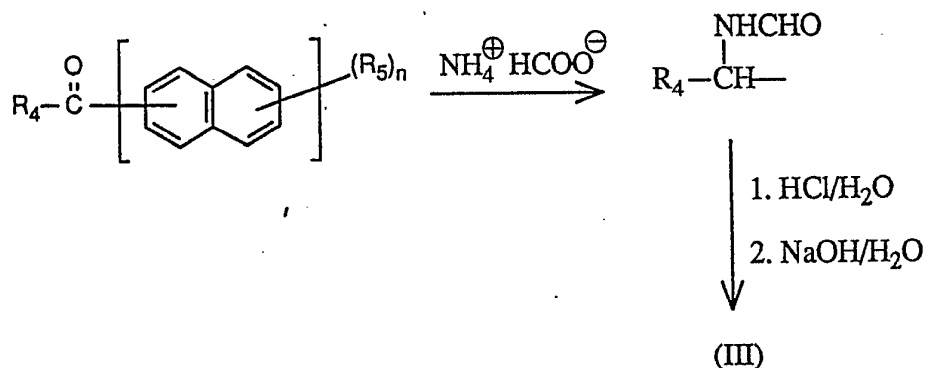
- 1) a partir de aldeídos ou cetonas correspondentes por reacção com aminas e ácido fórmico ou formamida e ácido fórmico de acordo com LEUCKART e WALLACH



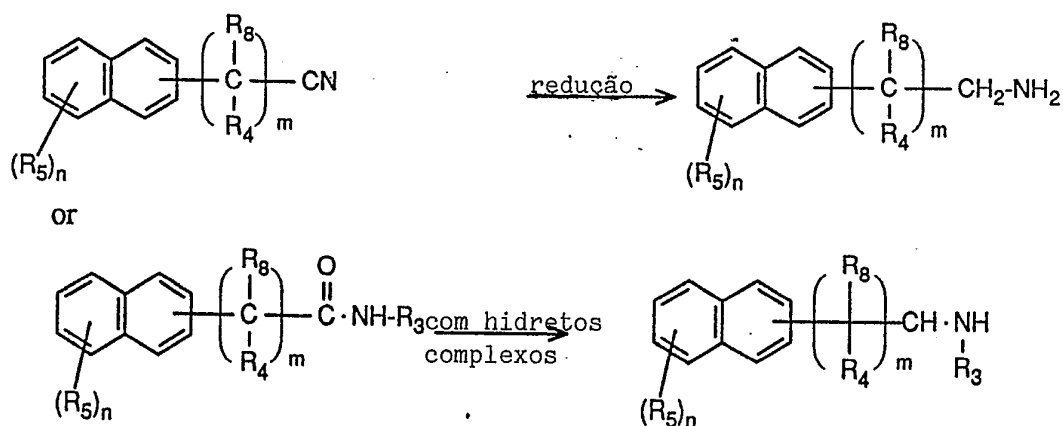
ou por aminação redutora dos aldeídos ou cetonas com $\text{NH}_2\text{-R}_3$ e hidrogénio na presença de catalisadores metálicos; ou por redução das oximas preparadas a partir de aldeídos ou cetonas com hidroxilaminas. A redução das oximas pode ser efectuada por meio de hidrogénio na presença de catalisadores metálicos, ou por meio de hidretos complexos, tais como LiAlH_4 :



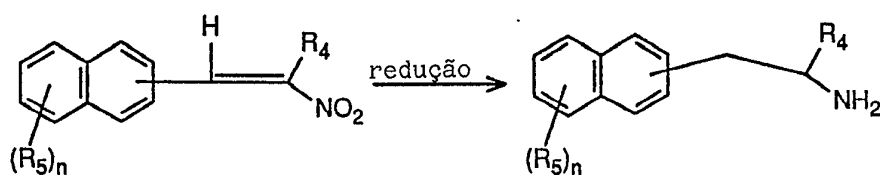
Os derivados naftaleno das fórmulas III e IV podem também ser obtidos a partir de aldeídos e cetonas por reacção com formato de amónio e hidrólise subsequente:



2) por redução de nitrilos ou amidas por meio de hidrogénio na presença de catalisadores metálicos ou por meio de hidretos complexos, tais como LiAlH_4 :



3) por redução de compostos nitro com hidrogénio e catalisadores metálicos:



O presente invento relaciona-se com os processos de preparação descritos, incluindo todos os seus passos subsidiários.

Os compostos enantioméricamente puros da fórmula I podem ser preparados como se segue:

1. separando a forma racémica dos compostos da fórmula I de acordo com os métodos geralmente conhecidos de clivagem racémica. Isto pode ser efectuado por reacção de compostos racémicos da fórmula I com um ácido sulfo ou ácido carboxílico enantioméricamente puro, tal como ácido tartárico, ácido canfórico, ácido canforsulfónico, etc., para formar os sais e subsequente cristalização fraccionada dos sais diastereoisoméricos. Os compostos enantioméricamente puros da fórmula I podem então ser libertados de novo a partir dos sais diastereoisoméricos puros usando bases;

2. separando a forma racémica dos compostos da fórmula I por cromatografia, especialmente cromatografia HPLC num material veículo quiral, tal como acetilcelulose, etc.;
3. fazendo reagir as pirimidinas da fórmula II com aminas enantioméricamente puras da fórmula III ou fórmula IV. Aminas enantioméricamente puras das fórmulas III e IV podem ser preparadas de um modo análogo aos métodos anteriormente descritos ou de acordo com métodos geralmente conhecidos de síntese enantioselectiva.

Compostos da fórmula I em que R_2 é um radical tioalquilo são obtidos substituindo R_2 =halogénio com mercaptans em condições básicas. Podem ser convertidos nas correspondentes sulfonas e sulfóxidos por oxidação.

Surpreendentemente, verificou-se que os compostos da fórmula I apresentam, sob um ponto de vista prático, um espectro biocida muito vantajoso contra insectos, pragas da ordem Ácarina, e microorganismos fitopatogénicos, especialmente fungos. Os compostos da fórmula I apresentam propriedades curativas, preventivas e, em particular sistémicas, muito vantajosas, e podem ser usados para a protecção de numerosas plantas cultivadas. Com os compostos da fórmula I é possível inibir ou destruir as pragas que ocorrem em plantas ou em partes de plantas (frutos, flores, folhas, caules, tuberculos, raizes) em diferentes colheitas de plantas úteis, enquanto que ao mesmo tempo partes da planta que crescem mais tarde são também protegidas, por exemplo, em relação ao ataque por microorganismos fitopatogénicos.

Os compostos da fórmula I são eficazes, por exemplo, contra fungos fitopatogénicos pertencendo às classes que se seguem: Fungi imperfecti (por exemplo Botrytis, Pyricularia,

Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora e Alternaria); Basidiomycetes, (por exemplo Rhizoctonia, Hemileia, Puccinia). São também eficazes contra a classe dos Ascomycetes (por exemplo Venturia e Erysiphe, Podosphaera, Monilinia, Uncinula) e dos Oomycetes (por exemplo Phytophthora, Pythium, Plasmopara). Os compostos da fórmula I podem também ser usados como agentes de revestimento para a protecção de sementes (frutos, tubérculos, grãos) e estacas de plantas contra infecções por fungos assim como contra fungos fitopatogénicos que aparecem no solo.

Verificou-se também que os compostos da fórmula I de acordo com o invento são ingredientes activos importantes para o controlo de insectos e ácaros prejudiciais que ocorrem em plantas úteis e ornamentais na agricultura, especialmente nas colheitas de algodão, legumes e frutas, na siveicultura, na protecção de mercadorias armazenadas e de materiais em estoque, e também no sector da higiene, especialmente em animais domésticos e animais produtivos. São eficazes contra vários estádios de desenvolvimento destas espécies. A sua acção pode manifestar-se pela morte das pragas imediatamente ou só posteriormente, por exemplo na muda, ou originando uma postura de ovos acentuadamente reduzida e/ou um tempo de incubação acentuadamente reduzido. As pragas anteriormente mencionadas incluem:

A ordem Lepidoptera (por exemplo Chilo spp. e Heliothis spp.), a ordem Coleoptera (por exemplo Anthonomus spp., Epilachna dactyloleata), a ordem Homoptera (por exemplo Bemisia tabaci, Nephrotettix spp., Nilaparvata spp.) e a ordem Acarina (por exemplo Boophilus spp. e Tetranychus spp.). Esta lista é não limitativa.

O invento também se relaciona com composições compreendendo compostos da fórmula I como ingrediente activo,

especialmente produtos para protecção das colheitas, e com a sua utilização no sector agrícola ou em campos afins.

O presente invento abrange ainda a preparação dessas composições, que compreende a mistura homogênea do ingrediente activo com um ou mais compostos ou grupos de compostos aqui descritos. O invento relaciona-se ainda com um método de tratamento das plantas, que compreende a aplicação às plantas dos novos compostos da fórmula I ou de novas composições.

As colheitas alvo a ser protegidas no âmbito do presente invento compreendem, por exemplo, as espécies de plantas que se seguem:

cereais (trigo, cevada, centeio, aveia, arroz, sorgo e colheitas afins), beterraba (beterraba do açúcar e beterraba para forragem), peros, drupas e frutos moles (maçãs, peras, ameixas, pessegos, amendoas, cerejas, morangos, framboesas e amoras silvestres) plantas leguminosas (favas, lentilhas, ervilhas, soja), plantas oleaginosas (colza, mustarda, papoilas, azeitonas, girassóis, côcos, plantas do óleo de ricino, cacau, amendoim), plantas dos pepinos (pepino, abóbora-menina, melões, plantas fibrosas (algodão, linho, cânhamo, juta), frutos citrinos (laranjas, limões, toranjas, tangerinas), legumes (espinafres, alface, aspargos, couves, cenouras, cebolas, tomates, batatas, pimentão) lauráceas (avocados, canela, cânfora) ou plantas tais como do tabaco, noqueiras, do café, das beringelas, da cana do açúcar, do chá, da pimenta, vinhas, do lúpulo, das bananas e plantas da borracha natural, assim como plantas ornamentais.

Os compostos da fórmula I são normalmente aplicados sob a forma de composições e podem ser aplicados às zonas das colheitas ou à planta a ser tratada, simultaneamente ou sucessivamente,

com outros compostos. Estes outros compostos podem ser fertilizantes ou dadores de agentes micronutritivos ou outras preparações que influenciem o crescimento da planta. Podem também ser herbicidas, insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, moluscicidas selectivos ou misturas de várias destas preparações, se desejado juntamente com outros veículos, surfactantes ou outros adjuvantes promotores da aplicação habitualmente utilizados na tecnologia de formulação.

Veículos e adjuvantes apropriados podem ser sólidos ou líquidos e correspondem a substâncias habitualmente utilizadas na tecnologia da formulação, por exemplo substâncias minerais naturais ou regeneradas, solventes, dispersantes, agentes de humedificação, agentes de viscosidade, agentes de espessamento, agentes de ligação ou fertilizantes.

Um método preferido para aplicar um composto da fórmula I, ou uma composição agroquímica que compreende pelo menos um dos referidos compostos, é a aplicação à folhagem. O número de aplicações e a taxa de aplicação dependem do risco de infestação pelo agente patogénico correspondente. Contudo, os compostos da fórmula I podem também penetrar na planta através das raízes pelo solo (acção sistémica) se o local da planta for impregnado com uma formulação líquida, ou se os compostos forem aplicados sob a forma sólida ao solo, por exemplo sob a forma granular (aplicação ao solo). Nas colheitas de arroz com casca, esses grânulos podem ser aplicados em quantidades medidas ao campo de arroz inundado. Os compostos da fórmula I podem, contudo, ser também aplicados às sementes (revestimento) quer por impregnação das sementes com uma formulação líquida do ingrediente activo, ou por revestimento das sementes com uma formulação sólida.

Os compostos da fórmula I são usados sob uma forma não modificada ou, de preferência, juntamente com os adjuvantes convencionalmente utilizados na tecnologia de formulação, e são para esta finalidade formulados vantajosamente de um modo conhecido, por exemplo, em concentrados emulsificáveis, pastas para revestimento, soluções directamente pulverizáveis ou diluíveis, emulsões diluídas, pós humidificáveis, pós, poeiras, grânulos solúveis, e também encapsulações em por exemplo substâncias poliméricas. Quanto à natureza das composições, os métodos de aplicação, tais como pulverização, atomização, polvilhamento, disseminação, revestimento ou derramamento, são escolhidos de acordo com os objectivos pretendidos e com as circunstâncias predominantes. Taxas vantajosas de aplicação variam normalmente entre 5g e 2 kg de ingrediente activo (a.i.) por hectare, de preferência de 10 g a 1 kg a.i./ha, com a maior preferência de 20 g a 600 g a.i./ha.

As formulações, isto é as composições, preparações ou misturas compreendendo o composto (ingrediente activo) da fórmula I e, quando apropriado, um adjuvante sólido ou líquido, são preparados de um modo conhecido, por exemplo por mistura homogénea e/ou moagem dos ingredientes activos com agentes de extensão, por exemplo solventes, veículos sólidos e, quando apropriado, compostos tensio-activos (surfactantes).

Solventes apropriados são: hidrocarbonetos aromáticos, de preferência as fracções contendo 8 a 12 átomos de carbono, por exemplo misturas de xilenos ou naftalenos substituídos, ftalatos tais como ftalato de dibutilo ou ftalato de dioctilo, hidrocarbonetos alifáticos tais como ciclohexano ou parafinas, alcoóis e glicóis e seus éteres e ésteres, tais como etanol, etileno glicol, éter monometílico ou monoetilico de etileno glicol, cetonas tais como ciclohexanona, solventes fortemente polares

tais como N-metil-2-pirrolidona, dimetil sulfoxido ou dimetilformamida, assim como óleos vegetais ou óleos vegetais epoxidizados, tais como óleo de côco epoxidizado ou óleo de soja; ou água.

Os veículos sólidos usados, por exemplo poeiras e pó dispersíveis, são normalmente agentes de enchimento minerais normalmente naturais tais como calcite, talco, caolino, montmorillonite ou atapulgite. A fim de melhorar as propriedades físicas é também possível adicionar ácido silícico altamente disperso ou polímeros absorventes altamente dispersos. Veículos adsorventes granulados apropriados são do tipo poroso, por exemplo pómic, teijolo partido, sepiolite ou bentonite; e veículos não absorventes apropriados são, por exemplo, calcite ou areia. Além disso, pode ser usado um grande número de materiais prégranulados de natureza inorgânica, por exemplo especialmente dolomite ou resíduos industriais.

Dependendo da natureza do composto da fórmula I a ser formulado, os compostos tensio-ativos apropriados são surfactantes não iônicos, catiónicos e/ou aniônicos apresentando boas propriedades de emulsificação, dispersão e de humidificação. A expressão "surfactantes" será também considerada como compreendendo misturas de surfactantes.

Tanto os sabões chamados solúveis na água como os compostos tensio ativos sintéticos solúveis na água são surfactantes aniônicos apropriados.

Exemplos representativos de surfactantes não iônicos são nonilfenolpolietoxietanois, éteres poliglicólicos de óleo de castor, aductos óxido de polipropileno/polietileno, tributilfenoxipolietileneetanol, polietileno glicol e octilfenoxipolietoxietanol.

ésteres de ácido gordo de polioxietileno de sorbitan, por exemplo trioleato de polioxietileno sorbitan, são também surfactantes não iônicos apropriados.

Surfactantes catiónicos são de preferência sais de amônio quaternário que contêm, como substituintes em N, pelo menos um radical C_8-C_{22} alquilo e, como outros substituintes, alquilo inferior não substituído ou halogenado, radicais benzilo ou hidroxi-alquilo inferior. Outros surfactantes habitualmente utilizados na tecnologia de formulação são conhecidos pelos especialistas nesta técnica ou podem ser retirados da bibliografia importante desta especialidade. As composições agroquímicas compreendem usualmente 0,1 a 99%, de preferência 0,1 a 95%, de um composto da fórmula I, 99,9 a 1%, de preferência 99,8 a 5%, de um adjuvante sólido ou líquido, e 0 a 25%, de preferência 0,1 a 25%, de um surfactante.

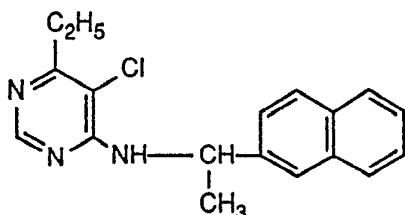
Enquanto que os produtos comerciais serão de preferência formulados como concentrados, o utilizador final utilizará normalmente formulações diluídas.

As composições podem também compreender outros agentes auxiliares tais como estabilizadores, agentes anti formação de espuma, reguladores da viscosidade, agentes de ligação, agentes de viscosidade assim como fertilizantes ou outros ingredientes activos para a obtenção de efeitos especiais.

Os Exemplos que se seguem servem para ilustrar o invento com maior detalhe, mas não limitam o invento.

Exemplos de Preparações

EXEMPLO 1: Preparação de d,l-4-[1'-(β-naftil)-etilaminol-5-cloro-6-etilpirimidina da fórmula

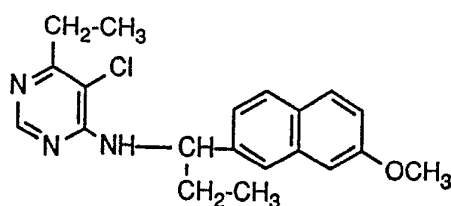


(comp. no. 1.2)

11,98 g de 1-(β-naftil)-1-aminoetano e 20 ml de trietilamina são adicionados a uma solução de 12,39 g de 4,5-dicloro-6-etilpirimidina em 150 ml de n-butanol. A mistura é levada a ebulição sob refluxo durante 12 horas. Após concentração da solução da reação por evaporação, o produto cru é dissolvido em 20 ml de clorofórmio, são adicionados 6 ml de ácido clorídrico concentrado, e o produto é extraído por agitação com água. A fase orgânica é separada e seca com sulfato de sódio e o solvente é separado por destilação, proporcionando um óleo castanho claro. O óleo é triturado com hexano, e em seguida o produto final desejado cristaliza. A filtração origina 11,6 g de substância; p.f.: 80-81°C.

O racemato resultante pode ser separado num enantiômero-(+) e o seu enantiômero-(-) biologicamente mais activo por cristalização fraccionada com, por exemplo, ácido tartárico ópticamente activo, ou pode ser separado por separação numa coluna quiral por meio de HPLC.

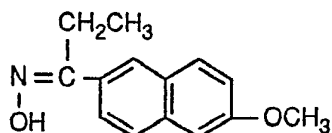
Exemplo 2: Preparação de (d,l)-4-[1'-(2-(6-metoxinaftil))
propilaminol-5-cloro-6-etilpirimidina



(comp. No. 1.45)

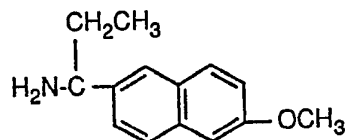
2,1 g de 1-(2-(6-metoxinaftil))-1-aminopropano, 2,1 g de 4,5-dicloro-6-etilpirimidina e 1,3 g de trietilamina são introduzidos em 50 ml de n-butanol. A solução é aquecida sob refluxo durante 12 horas. O solvente é então amplamente separado por evaporação, adiciona-se água ao resíduo, e o produto é extraído com acetato de etilo. A solução é seca sobre Na_2SO_4 e concentrada. O resíduo é cromatografado através de uma coluna baixa sobre gel de sílica com acetato de etilo/hexano (1:1). Rendimento: 2,4 g (resina).

Exemplo 2a: Preparação de 2-(6-metoxinaftil)etilcetoxima



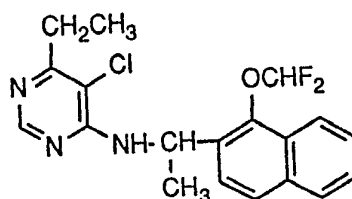
21,4 g de 6-metoxi-2-propionilnaftaleno são dissolvidos em 100 ml de etanol. 7,7 g de cloreto de hidroxiamônio e 9,5 g de piridina são adicionados a essa solução, e a mistura é então levada a ebulição sob refluxo durante aproximadamente 12 horas. Após arrefecimento, o solvente é separado por destilação usando um evaporador rotativo, e o resíduo é misturado com água e extraído com acetato de etilo. Depois do extracto de acetato de etilo ter sido lavado com água e solução salina, ele é seco sobre Na_2SO_4 , filtrado e concentrado usando um evaporador rotativo. O resíduo é recristalizado a partir de ciclohexano. Rendimento: 18,4 g, p.f. 161-162°C.

Exemplo 2b: Preparação de 1'-[2-(6-metoxinaftil)]-propilamina



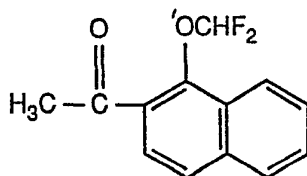
7,4 g de 2-(6-metoxinaftil)-etilcetoxime são hidrogenados com hidrogénio em 100 ml de metanol e 6 g de aménia (líquida), com a adição de 0,7 g de níquel de Raney, a 60-70°C sob uma pressão de 10^7 Pa, até a reacção cessar. O catalisador é separado por filtração sobre Hyflo sendo então lavado com metanol. O metanol é separado por evaporação sob pressão reduzida usando um evaporador rotativo, e o resíduo é misturado com cloreto de metileno e lavado com água. A solução é seca sobre Na_2SO_4 e em seguida filtrada, e o solvente é então separado por evaporação. O resíduo é recristalizado a partir de éter dietílico/hexano. Rendimento: 5,6 g; p.f. 61-62°C.

Exemplo 3: Preparação de (d,l)-4-[1'-(2-(1-difluorometoxi)-
naftil)-etilamino]-5-cloro-6-etilpirimidina



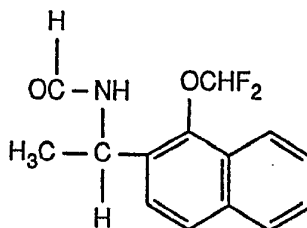
2,1 g de metil-2-(1-difluorometoxinaftil)-metilamina, 1,6 g de 4,5-dicloro-6-etilpirimidina e 1,2 g de trietilamina são adicionados a 20 ml de n-butanol. A solução é mantida a 100°C durante aproximadamente 12 horas. O solvente é então amplamente separado por evaporação in vacuo usando um evaporador rotativo, adiciona-se água ao resíduo, e a mistura é extraída várias vezes com acetato de etilo. A solução de acetato de etilo é seca sobre Na₂SO₄ e concentrada por evaporação. O óleo que permanece é cromatografado sobre gel de sílica com acetato de etilo/hexano (3:1) como eluente. Rendimento: 1,4 g de óleo.

Exemplo 3a: Preparação de 1-difluorometoxi-2-acetilnaftaleno



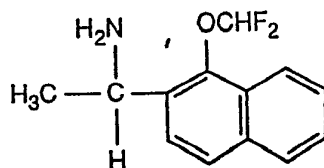
10 g de 1-hidroxi-2-acetilnaftaleno são dissolvidos em 60 ml de dioxano, e são adicionados 30 ml de 30% de solução de Hidróxido de sódio. A uma temperatura de 70°C a 80°C, introduz-se difluoroclorometano (Freon 22) até não se observar mais absorção. A fase dioxano é então decantada, a fase NaOH é lavada com dioxano, a fase dioxano é decantada, as soluções de dioxano combinadas são amplamente concentradas in vacuo usando um evaporador rotativo. Adiciona-se água ao resíduo, a mistura é extraída várias vezes com éter dietílico, e a solução de éter dietílico é seca sobre Na_2SO_4 , filtrada e concentrada por evaporação. O resíduo é recristalizado a partir de éter dietílico/hexano. Rendimento: 4 g, p.f. 80-81°C.

Exemplo 3b: Preparação de N-formil-1'-[2-(1-difluorometoxi natil)]-etilamina



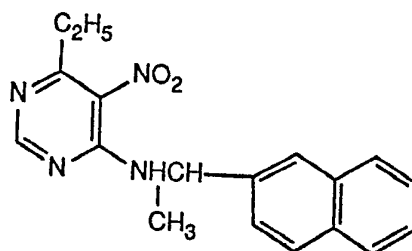
10,3 g de 1-difluorometoxi-2-acetilnaftaleno são adicionados em porções a 20 g de formamida, que tinha sido aquecida até 150°C, com a adição simultânea gota a gota de 5 g de ácido fórmico. A mistura é então agitada durante a noite (aproximadamente 12 horas) a essa temperatura. Após arrefecimento, adiciona-se água e o produto é extraído com acetato de etilo. Depois da fase de acetato de etilo ter sido lavada várias vezes com água, ela é seca sobre Na_2SO_4 e concentrada in vacuo usando um evaporador rotativo. O resíduo oleoso é cromatografado sobre gel de sílica com acetato de etilo/hexano (3:1) como eluente. Rendimento: 5,4 g de óleo.

Exemplo 3c: Preparação de 1'-(2-(1-difluorometoxinaftil)etil
amina



40 ml de etanol/água (1:1) são adicionados a 5,4 g de N-formil-1-(2-(1-difluorometoxinaftil)-etilamina, 1,8 g de pilulas de hidróxido de potássio são adicionados, e a mistura é então submetida a ebulição sob refluxo durante 6 horas. O etanol é então amplamente separado por evaporação usando um evaporador rotativo, e o resíduo aquoso é extraído várias vezes com éter dietílico. A solução de éter dietílico é seca sobre Na_2SO_4 e concentrada usando um evaporador rotativo. O resíduo oleoso resultante é usado directamente sem purificação. Rendimento: 4,1 g.

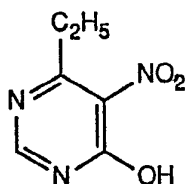
Exemplo 4: Preparação de 4-[1'-(β -naftil)etilamino]-5-nitro-6-etil-pirimidina



[comp. no. 1.80]

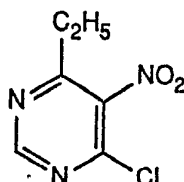
1,97 g (0,01 mol) de 4-cloro-5-nitro-6-etilpirimidina são dissolvidos com 1,52 g (0,015 mol) de trietilamina em 15 ml de tetrahydrofurano, e 1,97 g (0,0115 mol) de 1-(β -naftil)-1-aminoetano são adicionados gota a gota com arrefecimento a um máximo de 50°C. Após um hora, a mistura é extraída com água e acetato de etilo. A concentração do extracto proporciona 3,65 g de produto cru, o qual é purificado por meio de cromatografia de coluna sobre gel de sílica (eluente: 10 partes de acetato de etilo e 90 partes de hexano). O rendimento é de 2,75 g (85% do rendimento teórico) de óleo incolor.

Exemplo 4a: Preparação de 4-hidroxi-5-nitro-6-etilpirimidina



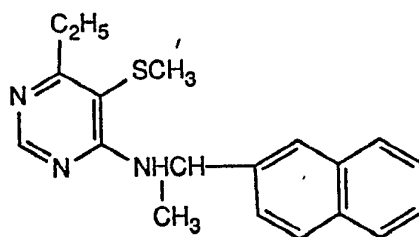
8 ml de 25% de óleo são adicionados gota a gota com arrefecimento a um máximo de 10°C a 8 ml de 100% de ácido azótico. 12,4 g (0,10 mol) de 4-hidroxi-6-etilpirimidina são então introduzidos em porções a um máximo de 35°C. A temperatura é mantida a 40°C durante a noite. Tendo como finalidade de fazer reagir ainda qualquer material de partida que permaneça, mais 13 ml de 25% de óleo e 11 ml de 100% de ácido azótico são adicionados gota a gota a um máximo de 40°C. A mistura é deixada durante 12 horas a 40°C a fim de completar a reacção sendo então vertida cuidadosamente para gelo e extraída completamente com acetato de etilo, e os extractos são lavados com solução de carbonato de sódio e hidrogénio. O extracto é concentrado usando um evaporador rotativo, e em seguida 11,8 g (69,7% do rendimento teórico) da substancia pura cristaliza; p.f. 181-183°C.

Exemplo 4b: Preparação de 4-cloro-5-nitro-6-etilpirimidina



18,7 g (0,126 mol) de dietilanilina são dissolvidos em 18 ml de cloreto de fósforo, e em seguida 8,46 g (0,05 mol) de 4-hidroxi-5-nitro-6-etilpirimidina são neles agitados. Durante a adição, a temperatura sobe de 22° para 47°C. Forma-se uma solução que é aquecida a 60°C durante 2 horas. é então agitada com gelo-água e acetato de etilo durante 30 minutos tendo como finalidade a hidrólise. A fase orgânica é separada e combinada com os extractos obtidos por extracção, e a mistura é lavada com solução de NaHCO_3 . A remoção do solvente proporciona 9,1 g do produto cru, o qual é purificado por cromatografia de coluna sobre gel de sílica (eluente: acetato de etilo/hexano 20:80 partes). 6,76 g (72,1% do rendimento teórico) do produto puro são obtidos sob a forma de um óleo.

Exemplo 5: Preparação de 4-[1'-(β-naftil)-etilaminol-5-metil
tio-6-etil-pirimidina

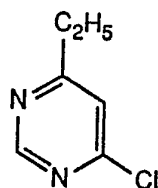


(comp. no. 1.61)

4,99 g (0,014 mol) de 4-[1'-(β-naftil)-etilaminol-5-bromo-6-etilpirimidina são dissolvidos em 18 ml de N-metilpirrolidona, e a solução é aquecida a 60°C com 3,2 g de metanetio-lato de sódio (CH_3SNa) durante 5 horas. A mistura é então extrai-da com água e acetato de etilo, o extracto é lavado e o solvente é removido usando um evaporador rotativo. Purificação por cromatografia sobre gel de sílica (eluente: 3 partes de acetato de etilo e 7 partes de hexano) dá origem, para além do produto de partida, a 1,42 g de substancia pura sob a forma de um óleo incolor. Análise: $\text{C}_{19}\text{H}_{21}\text{N}_3\text{S}$ ($M = 323,46$).

	<u>calculados</u>	<u>encontrados</u>
%N	12,99	12,96
SS	9,91	10,34

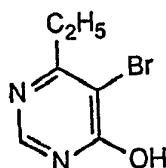
Exemplo 6a: Preparação de 4-cloro-6-etilpirimidina



12,4 g (0,10 mol) de 4-hidroxi-6-etilpirimidina, preparada de acordo com EP 326 389, são introduzidos em 25 ml de oxicloreto de fósforo, subindo a temperatura espontaneamente até 70°C. Forma-se uma solução transparente, a qual é mantida a 70°C durante mais 2 horas e, em seguida, após arrefecimento, é agitada em gelo-água. A extração com éter proporciona 12,0 g de produto líquido cru o qual é destilado num tubo de empola a 105°C sob uma pressão de 26 mbar para dar origem a 11,0 g de substância pura. Análise: $C_6H_7ClN_2$ (M=142,59).

	<u>calculados</u>	<u>encontrados</u>
% C	50,54	50,43
% H	4,95	4,87
% N	19,65	19,86
% Cl	24,86	24,79

Exemplo 6b: Preparação de 4-hidroxi-5-bromo-6-etilpirimidina

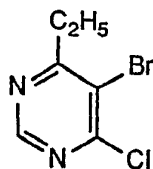


24,8 (0,20 mol) de 4-hidroxi-6-etilpirimidina são dissolvidos com 16,8 g (0,20 mol) de carbonato de sódio e hidrogénio em 50 ml de água, e 32 g (0,20 mol) de bromo são adicionados lentamente gota a gota a de 8 a 10°C, com arrefecimento. No decurso da adição, liberta-se dióxido de carbono, e o produto precipita sob a forma de cristais. O produto é separado por extracção com acetato de etilo e cristaliza quando o extracto é concentrado usando um evaporador rotativo. São obtidos 22,7 g (55,9% do rendimento teórico) de uma primeira fracção tendo um ponto de fusão de 177-179°C. A concentração do líquido mãe proporciona mais 3,5 g (8,6%); p.f. 175-177°C.

Exemplo 6c: Preparação de 4-cloro-5-bromo-6-etilpirimidina

29,7 g (0,146 mol) de 4-hidroxi-5-bromo-6-etilpirimidina são introduzidos lentamente em 27,3 g (0,178 mol) de oxicloreto de fósforo. A suspensão dissolve-se por aquecimento até 70°C; a reacção é ligeiramente exotérmica. A temperatura é mantida a 70°C durante 1 1/2 horas e, após arrefecimento, a solução é vertida para gelo-água e neutralizada cuidadosamente até pH 6-7, a 0°C, com 3% de solução de hidróxido de sódio. A extracção com acetato de etilo proporciona, após remoção do solvente, 30,4 g do produto cru. A destilação proporciona 23,9 g (73,9% do rendimento teórico) de substancia pura tendo um ponto de ebulição de 112-114°C/24 mbar.

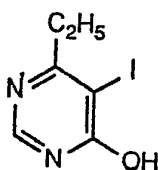
Exemplo 6d: Preparação de 4-hidroxi-5-iodo-6-etilpirimidina



50,8 g de iodo (0,20 mol) são introduzidos em 850 ml de ácido acético, e 14,8 g (0,21 mol) de cloro são introduzidos a 30-33°C, dissolvendo-se em seguida o iodo. 49,7 g (0,4 mol) de 4-hidroxi-6-etilpirimidina em solução em 150 ml de ácido acético são então adicionados gota a gota a 20°C, separando-se o produto final cristalino. A filtração com sucção e recristalização a

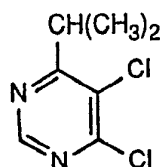
partir de acetato de etilo proporcionau 24,4 g de substancia pura, p.f. 191-192°C.

Exemplo 6e: Preparação de 4-cloro-5-iodo-6-etilpirimidina



21,7 g (0,087 mol) de 4-hidroxi-5-iodo-6-etilpirimidina são agitados em 50 ml de oxicloreto de fósforo que tinha sido aquecido até 60°C, tendo lugar uma reacção ligeiramente exotermica. A temperatura é mantida constante a 60°C e a mistura é deixada durante uma hora a fim de se completar a reacção. A mistura é então vertida para gelo-água e agitada durante 30 minutos a fim de hidrolisar completamente o excesso de oxicloreto de fósforo. A extracção com acetato de etilo dá origem a 23,5 g de produto cru cristalino. A recristalização a partir de uma mistura de 1 parte de acetato de etilo e 10 partes de hexano proporciona 18,8 g (80,7% do rendimento teórico) de substancia pura; p.f. 56-57°C.

Exemplo 6f: Preparação de 4,5-dicloro-6-isopropilpirimidina

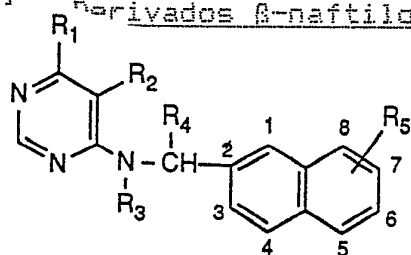


N-butil lítio (1,6 mol de solução em hexano, 19,4 ml) é adicionado gota a gota a 0°C, sob uma atmosfera de azoto, a uma solução de diisopropilamina (4,4 ml) em tetrahydrofurano (100 ml), e a mistura é agitada durante 20 minutos. A solução é arrefecida até -78°C e são então adicionados 5 g de 4,5-dicloro-6-etilpirimidina em solução em 10 ml de tetrahydrofurano. A mistura é agitada a -78°C durante uma hora sendo então levada até à temperatura ambiente durante um período de 2 horas. Após a adição de água (200 ml), a mistura é extraída com acetato de etilo e a fase orgânica é seca sobre sulfato de sódio e concentrada. Cromatografia sobre gel de sílica (eluente: acetato de etilo/hexano 1:10) proporciona 3,8 g (71% do rendimento teórico) de 4,5-dicloro-6-isopropilpirimidina sob a forma de um óleo amarelo.

¹H-RMN: 8,79 (1H, s), 3,58 (1H, septet), 1,3 (6H, d)

Os compostos que se seguem podem ser preparados deste modo de acordo com um dos métodos descritos anteriormente.

Quadro 1 Derivados A-naftilo



Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.1	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	p.f. 127-128°C
1.2	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	p.f. 80-81°C
1.3	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	H	n _D ²⁰ 1.6119
1.4	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopropil	H	H	
1.5	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	n _D ²⁰ 1.6245
1.6	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	H	
1.7	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-COCH ₃	H	
1.8	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-S-C ₆ H ₄ Cl(4)	H	
1.9	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	6-Br	n _D ²⁰ 1.6238
1.10	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	6-O-C ₆ H ₅	
1.11	CH=CH ₂	Cl	CH ₃	H	H	
1.12	CH=CH ₂	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.13	CF ₃	Cl	CH ₃	H	H	p.f. 101-102°C
1.14	CF ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.15	Ciclopropil	Cl	H	H	H	
1.16	Ciclopropil	Cl	CH ₃	H	H	resina
1.17	Ciclopropil	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.18	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	resina
1.19	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	p.f. 102-103°C
1.20	C ₂ H ₅	NO ₂	C ₂ H ₅	H	H	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.21	C ₂ H ₅	CN	C ₂ H ₅	H	H	p.f. 99-101°C
1.22	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-CO-2-furilo	H	
1.23	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{-S-C-CN} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	
1.24	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-COCH ₃	6-Br	
1.25	-CH ₂ Cl	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.26	-CH ₂ OCH ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.27	C ₂ H ₅	Br	C ₂ H ₅	H	H	
1.28	C ₂ H ₅	F	C ₂ H ₅	H	H	
1.29	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
1.30	Cl	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
1.31	Br	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
1.32	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-S-C ₆ H ₄ -NO ₂ (4)	H	
1.33	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-S-C ₆ H ₄ -NO ₂ (2)	H	
1.34	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-Br	
1.35	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.36	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-O-C ₆ H ₄ Cl (4)	
1.37	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-CH ₃	
1.38	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	8-Cl	
1.39	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1,4-di-Br	
1.40	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-SCH ₃	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	
1.41	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-Br	
1.42	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-OH	
1.43	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-OCH ₃	resina
1.44	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-CH ₃	P.f. 94-95°C
1.45	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	6-OCH ₃	resina
1.46	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-S-CCl ₃	H	
1.47	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-S-CCl ₂ F	H	Oleo
1.48	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-OCHF ₂	
1.49	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-OCHF ₂	
1.50	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	6-OCHF ₂	
1.51	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-OCH ₃ , 7-Br	
1.52	CH ₃	Cl	CH ₃	H	6-OCHF ₂	
1.53	CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	Oleo
1.54	CH ₃	Cl	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.55	CH ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	6-OCH ₃	Oleo
1.56	CH ₃	Cl	CH ₃	H	6-CH ₃	Oleo
1.57	CH ₃	Cl	CH ₃	H	6-Br	p.f. 124-125°C
1.58	CH ₃	Cl	CH ₃	H	1-OCH ₃	Oleo
1.59	CH ₃	Cl	CH ₃	H	1-Br	
1.60	CH ₃	Cl	CH ₃	H	6'-OCHF ₂	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.21	C ₂ H ₅	CN	C ₂ H ₅	H	H	p.f. 99-101°C
1.22	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-CO-2-furilo	H	
1.23	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \\ \text{-S-C-CN} \\ \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	
1.24	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	-COCH ₃	6-Br	
1.25	-CH ₂ Cl	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.26	-CH ₂ OCH ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.27	C ₂ H ₅	Br	C ₂ H ₅	H	H	
1.28	C ₂ H ₅	F	C ₂ H ₅	H	H	
1.29	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
1.30	Cl	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
1.31	Br	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	
1.32	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-S-C ₆ H ₄ -NO ₂ (4)	H	
1.33	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-S-C ₆ H ₄ -NO ₂ (2)	H	
1.34	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-Br	
1.35	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.36	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-O-C ₆ H ₄ Cl (4)	
1.37	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-CH ₃	
1.38	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	8-Cl	
1.39	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1,4-di-Br	
1.40	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-SCH ₃	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.61	C ₂ H ₅	SCH ₃	CH ₃	H	H	Óleo
1.62	C ₂ H ₅	SOCH ₃	CH ₃	H	H	
1.63	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	H	
1.64	C ₂ H ₅	SCH ₃	CH ₃	H	6-CH ₃	
1.65	C ₂ H ₅	SOCH ₃	CH ₃	H	6-CH ₃	
1.66	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	6-CH ₃	
1.67	C ₂ H ₅	SCH ₃	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.68	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.69	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopentilo	H	6-CH ₃	
1.70	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopentilo	H	6-OCH ₃	resina
1.71	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopentilo	H	6-Br	
1.72	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	forma(+), óleo [α] _D ²⁰ = +6.13°
1.73	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	forma(-), óleo [α] _D ²⁰ = -6.01°
1.74	C ₂ H ₅	Cl	n-propilo	H	H	
1.75	C ₂ H ₅	Cl	n-Butilo	H	H	
1.76	C ₂ H ₅	Cl	i-Propilo	H	H	p.f. 81-82°C
1.77	Cl	NH ₂	CH ₃	H	H	p.f. 124-126°C
1.78	Cl	H	CH ₃	H	H	p.f. 113-114°C
1.79	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	H	p.f. 83-84°C
1.80	C ₂ H ₅	NO ₂	CH ₃	H	H	Óleo

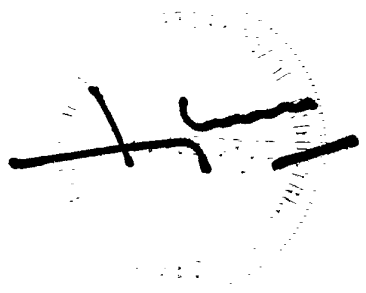
Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.81	Cl	NO ₂	CH ₃	H	H	p.f. 82-83°C
1.82	C ₂ H ₅	NH ₂	CH ₃	H	H	p.f. 146-147°C
1.83	C ₂ H ₅	NHCH ₃	CH ₃	H	H	
1.84	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	H	p.f. 62-63°C
1.85	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	H	H	
1.86	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	H	H	
1.87	n-C ₃ H ₇	NO ₂	CH ₃	H	H	
1.88	n-C ₃ H ₇	NH ₂	CH ₃	H	H	
1.89	n-C ₃ H ₇	Br	CH ₃	H	H	Óleo
1.90	CH ₃	Br	CH ₃	H	H	p.f. 90-91°C
1.91	CH ₃	NO ₂	CH ₃	H	H	
1.92	CH ₃	NH ₂	CH ₃	H	H	
1.93	H	Cl	CH ₃	H	H	
1.94	H	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
1.95	H	Cl	CH ₃	H	6-CH ₃	
1.96	H	Cl	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.97	H	Br	CH ₃	H	H	
1.98	H	NH ₂	CH ₃	H	H	
1.99	H	NO ₂	CH ₃	H	H	
1.100	C ₂ H ₅	I	CH ₃	H	H	Óleo
1.101	CH ₃	I	CH ₃	H	H	Óleo
1.102	n-C ₃ H ₇	I	CH ₃	H	H	
1.103	C ₂ H ₅	F	CH ₃	H	H	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.104	CH ₃	F	CH ₃	H	H	
1.105	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	H	H	
1.106	CH ₃	H	CH ₃	H	H	p.f. 118-119°C
1.107	n-C ₃ H ₇	H	CH ₃	H	H	p.f. 133-134°C
1.108	C ₂ H ₅	SC ₂ H ₅	CH ₃	H	H	Óleo
1.109	CH ₃	SC ₃ H ₇ (n)	CH ₃	H	H	
1.110	n-C ₃ H ₇	SCH ₃	CH ₃	H	H	
1.111	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	p.f. 81-82°C
1.112	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	H	
1.113	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	H	
1.114	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
1.115	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H	
1.116	n-C ₄ H ₉	NO ₂	CH ₃	H	H	
1.117	-C≡CCH ₃	H	CH ₃	H	H	
1.118	-C≡CCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.119	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.120	CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	
1.121	CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.122	CH ₂ SC ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	
1.123	CH ₂ SOCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.124	CH ₂ SO ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.125	C ₂ H ₅	NHCOCH ₃	CH ₃	H	H	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.126	C ₂ H ₅	N=CHC(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
1.127	C ₂ H ₅	NHCH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
1.128	C ₂ H ₅	NHC ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
1.129	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	p.f. 117-118°C
1.130	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-Cl	p.f. 86-87°C
1.131	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	6-Cl	
1.132	CH ₃	Cl	i-Propilo	H	H	p.f. 106-107°C
1.133	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-OCH ₃ , 4-Cl	p.f. 101-102°C
1.134	CH ₃	Cl	CH ₃	H	1-OCH ₃ , 4-Cl	
1.135	CF ₃	Cl	CH ₃	H	1-OCH ₃ , 4-Cl	
1.136	CF ₃	Cl	CH ₃	H	6-Cl	
1.137	CF ₃	Br	CH ₃	H	6-Cl	
1.138	CF ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	6-Cl	
1.139	CF ₃	Cl	CH ₃	H	6-Br	
1.140	CF ₃	Cl	CH ₃	H	6-OCH ₃	
1.141	CF ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	6-OCH ₃	
1.142	CF ₃	Cl	CH ₃	H	6-CH ₃	
1.143	CF ₃	Cl	CH ₃	H	1-OCH ₃	
1.144	CF ₃	Cl	CH ₃	H	1-OCHF ₂	
1.145	CF ₃	Cl	n-Propyl	H	H	
1.146	CF ₃	Cl	i-Propyl	H	H	
1.147	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	1-Br	

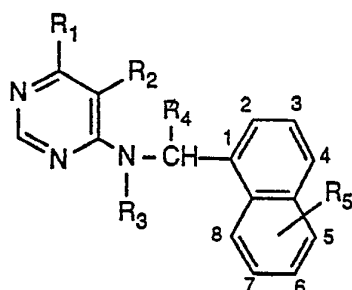
Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.148	CH ₃	Cl	CH ₃	H	1-OCHF ₂	
1.149	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-Br	p.f. 61-63°C
1.150	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	6-Br	Resina
1.151	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	6-CH ₃	Resina
1.152	CH ₃	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃ , 7-Br	p.f. 119-120°C
1.153	H	CH ₃	CH ₃	H	H	p.f. 110-111°C
1.154	C ₂ H ₅	Br	C ₂ H ₅	H	6-OCH ₃	resina
1.155	C ₂ H ₅	I	CH ₃	H	6-CH ₃	óleo
1.156	CF ₃	H	CH ₃	H	H	
1.157	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
1.158	Cl	Br	CH ₃	H	H	
1.159	Cl	I	CH ₃	H	H	
1.160	Cl	F	CH ₃	H	H	
1.161	CH ₂ OCH ₃	Br	CH ₃	H	H	óleo
1.162	CH ₂ OCH ₃	I	CH ₃	H	H	
1.163	Cl	Cl	CH ₃	H	6-Br	
1.164	Cl	Br	CH ₃	H	6-Br	
1.165	Cl	I	CH ₃	H	6-Br	
1.166	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	H	6-Br,	
1.167	CH ₂ OCH ₃	Br	CH ₃	H	6-Br	
1.168	CH ₂ OCH ₃	I	CH ₃	H	6-Br	
1.169	CH ₂ SCH ₃	Br	CH ₃	H	H	
1.170	CH ₂ SCH ₃	I	CH ₃	H	H	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.171	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	COCH ₃	H	
1.172	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	COCH ₃	H	
1.173	C ₂ H ₅	I	CH ₃	COCH ₃	H	
1.174	CH ₃	Cl	CH ₃	COC ₂ H ₅	H	
1.175	CH ₃	Br	CH ₃	COCH ₃	H	
1.176	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	COCH ₃	H	
1.177	CH(CH ₃) ₂	Cl	CH ₃	H	H	
1.178	CH(CH ₃) ₂	Br	CH ₃	H	H	
1.179	CH(CH ₃) ₂	I	CH ₃	H	H	
1.180	n-C ₅ H ₁₁	Cl	CH ₃	H	H	
1.181	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-F	
1.182	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	6-F	
1.183	CH ₃	Cl	CH ₃	H	6-F	
1.184	CH ₃	Br	CH ₃	H	6-F	
1.185	CH ₃	I	CH ₃	H	6-F	
1.186	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	6-F	
1.187	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	6-Cl	
1.188	CH ₃	Cl	n-C ₃ H ₇	H	H	Oleo
1.189	CH ₃	Cl	H	H	H	p.f. 102°C
1.190	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	H	6-Br	p.f. 75-76°C
1.191	-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	92-93°C
1.192	-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	H	
1.193	C(CH ₃)=CH-CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.194	-C(CH ₃)=CH-CH ₃	Br	CH ₃	H	H	
1.195	-CH(CH ₃)CH ₂ CH=CH ₂	Cl	CH ₃	H	H	Oleo



Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
1.196	-CH(CH ₃)CH ₂ C≡CH	Cl	CH ₃	H	H	p.f.115-116°C
1.197	-CHCl-CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.198	-CHBr-CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.199	-CHF-CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.200	-CH(CH ₃)-SCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.201	-CH(CH ₃)-SOCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	Óleo
1.202	-CH(CH ₃)-SO ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	Óleo
1.203	-C≡CH	Cl	CH ₃	H	H	
1.204	-C≡CH	Br	CH ₃	H	H	
1.205	-C≡CH	Cl	-C ₂ H ₅	H	H	
1.206	-CF ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.207	-C(CH ₃) ₃	Cl	CH ₃	H	H	
1.208	C ₂ H ₅	Br	n-propilo	H	H	Óleo
1.209	C ₂ H ₅	I	CH ₃	H	6-Br	Óleo

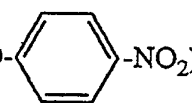
Quadro 2: Derivados α -naftilo

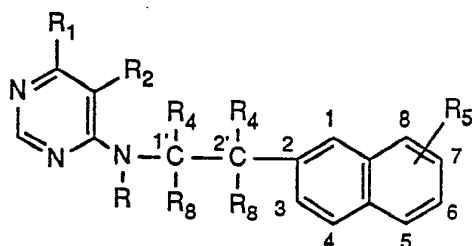


Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
2.1	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	P. f. 96-98°C
2.2	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	p. f. 97-99°C
2.3	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	H	
2.4	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	
2.5	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	6-Br	
2.6	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-COCH ₃	H	
2.7	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-S-C ₆ H ₅	H	
2.8	CF ₃	Cl	CH ₃	H	H	p. f. 137-138°C
2.9	CH=CH ₂	Cl	CH ₃	H	H	
2.10	Ciclopropilo	Cl	CH ₃	H	H	
2.11	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	4-Br	
2.12	C ₂ H ₅	NO ₂	CH ₃	H	H	
2.13	C ₂ H ₅	CN	CH ₃	H	H'	
2.14	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopropilb	H	H	²⁰ n _D = 1.6058
2.15	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
2.16	F	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
2.17	Br	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
2.18	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	H	
2.19	C ₂ H ₅	F	CH ₃	H	H	
2.20	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-Br	
2.21	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-CH ₃	
2.22	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	2-CH ₃	
2.23	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-OCH ₃	
2.24	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-SCH ₃	
2.25	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	8-Cl	
2.26	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-O-C ₆ H ₅	
2.27	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	3-OCH ₃	
2.28	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	3-Cl	
2.29	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	2,3-di-CH ₃	
2.30	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	2-OH	
2.31	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	4-Cl	p.f. 77-78°C
2.32	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-SCCl ₃	H	
2.33	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	-SCCl ₂ F	H	
2.34	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	2-OCH ₃	p.e. 86-88°C
2.35	Cl	NH ₂	CH ₃	H	H	p.f. 175-177°C
2.36	C ₂ H ₅	H	CH ₃	H	H	p.f. 114-115°C
2.37	Cl	H	CH ₃	H	H	
2.38	C ₂ H ₅	SCH ₃	CH ₃	H	H	

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
2.39	C ₂ H ₅	SOCH ₃	CH ₃	H	H	p. f. 74-76°C
2.40	C ₂ H ₅	SOCH ₃	CH ₃	H	H	
2.41	Cl	NO ₂	CH ₃	H	H	
2.42	C ₂ H ₅	NH ₂	CH ₃	H	H	
2.43	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	H	
2.44	C ₂ H ₅	OCH ₃	CH ₃	H	H	92-93°C
2.45	C ₂ H ₅	NHCH ₃	CH ₃	H	H	Óleo
2.46	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	H	H	
2.47	n-C ₃ H ₇	NO ₂	CH ₃	H	H	
2.48	n-C ₃ H ₇	NH ₂	CH ₃	H	H	
2.49	n-C ₃ H ₇	Br	CH ₃	H	H	
2.50	CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	p. f. 115-116°C
2.51	CH ₃	Br	CH ₃	H	H	p. f. 115-116°C
2.52	CH ₃	NO ₂	CH ₃	H	H	p. f. 108-109°C
2.53	CH ₃	NH ₂	CH ₃	H	H	
2.54	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	4-Cl	
2.55	C ₂ H ₅	I	CH ₃	H	H	
2.56	CH ₃	I	CH ₃	H	H	
2.57	n-C ₃ H ₇	I	CH ₃	H	H	p. f. 82-83°C
2.58	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	H	H	
2.59	CH ₃	H	CH ₃	H	H	
2.60	n-C ₃ H ₇	H	CH ₃	H	H	p. f. 144-145°C
						p. f. 100-101°C

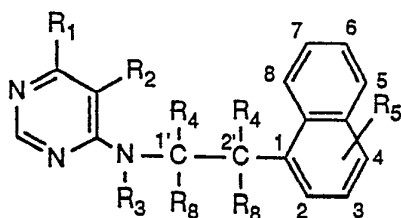
Comp No.	R ₁	R ₂	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
2.61	CH ₃	CH ₃ ,	CH ₃	H	H	P.f. 151-152°C
2.62	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H	H	
2.63	n-C ₃ H ₇	CH ₃	CH ₃	H	H	
2.64	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
2.65	CH ₂ OCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
2.66	CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	H	
2.67	CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
2.68	CH ₂ SO ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	
2.69	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	3,7-(CH ₃) ₂	P.f. 116-118°C
2.70	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	7-( -NO ₂)	
2.71	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	7-Cl	P.f. 127-128°C
2.72	CH ₃	Cl	CH ₃	H	7-Cl	P.f. 130-131°C
2.73	CH ₃	Cl	C ₂ H ₅	H	7-Cl	P.f. 91-92°C
2.74	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	H	7-Cl	resina
2.75	CF ₃	H	CH ₃	H	H	resina
2.76	CH ₃	Cl	CH ₃	H	7-Br	140-141°C
2.77	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	H	7-Br	125-127°C



Comp No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄ C-1'	R ₈ C-1'	R ₄ C-2'	R ₈ C-2'	R ₅	Dados Físicos
3.1	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	H	H	H	P.f. 84-86°C
3.2	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	H	p.f. 76-78°C
3.3	C ₂ H ₅	Cl	H	C ₂ H ₅	H	H	H	H	Óleo
3.4	C ₂ H ₅	Cl	H	npropib	H	H	H	H	
3.5	C ₂ H ₅	Cl	H	i-propib	H	H	H	H	
3.6	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	CH ₃	H	H	
3.7	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	H	
3.8	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	p.f. 92-94°C
3.9	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	
3.10	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	CH ₃	H	H	
3.11	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	i-propib	H	H	
3.12	CH ₃	Cl	H	H	H	H	H	H	
3.13	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	H	H	H	
3.14	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	
3.15	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	6-CH ₃	
3.16	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	6-CH ₃	
3.17	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	6-OCH ₃	
3.18	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	6-OCH ₃	
3.19	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	6-OCHF ₂	
3.20	C ₂ H ₅	NO ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	
3.21	C ₂ H ₅	SCH ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	
3.22	C ₂ H ₅	SOCH ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	
3.23	C ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	

Comp No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄ C-1'	R ₈ C-1'	R ₄ C-2'	R ₈ C-2'	R ₅	Dados Físicos
3.24	CH ₃	Cl	H	H	H	H	H	H	p.f. 90-91°C
3.25	CF ₃	Cl	H	H	H	H	H	H	
3.26	CF ₃	Cl	H	-CH ₃	H	H	H	H	
3.27	CH ₃	Cl	H	-CH ₃	H	H	H	H	
3.28	CH ₃	Br	H	-CH ₃	H	H	H	H	
3.29	CH ₃	NO ₂	H	-CH ₃	H	H	H	H	
3.30	C ₂ H ₅	Br	H	-CH ₃	H	H	H	H	
3.31	C ₂ H ₅	NO ₂	H	-CH ₃	H	H	H	H	
3.32	C ₂ H ₅	SCH ₃	H	-CH ₃	H	H	H	H	p.f. 130-131°C
3.33	CH ₃	Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	

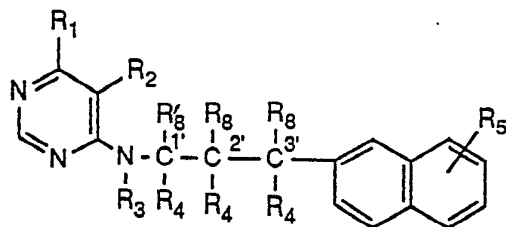
Quadro 4:



Comp No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄ C-1'	R ₈ C-1'	R ₄ C-2'	R ₈ C-2'	R ₅	Dados Físicos
4.1	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	H	H	H	P.f. 94-96°C
4.2	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	H	
4.3	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	
4.4	C ₂ H ₅	Cl	H	C ₂ H ₅	H	H	H	H	
4.5	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	
4.6	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	CH ₃	H	H	
4.7	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	
4.8	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H		H	H	
4.9	CH ₃	Cl	H	H	H	H	H	H	
4.10	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	H	H	H	p.f. 81-82°C
4.11	CH ₃	Cl	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	

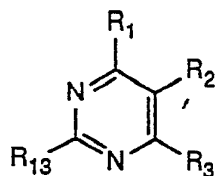
[Handwritten signature]

Quadro 5:



Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄ C-1'	R ₈ C-1'	R ₄ C-2'	R ₈ C-2'	R ₄ C-3'	R ₈ C-3'	R ₅	Dados Físicos
5.1	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	Óleo
5.2	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	
5.3	C ₂ H ₅	Cl	H	C ₂ H ₅	H	H	H	H	H	H	
5.4	C ₂ H ₅	Cl	H	CH ₃	H	H	H	CH ₃	H	H	
5.5	CH ₃	Cl	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	
5.6	C ₂ H ₅	Cl	H	H	H	H	H	H	H	1-OCH ₃	P. f. 91-92°C

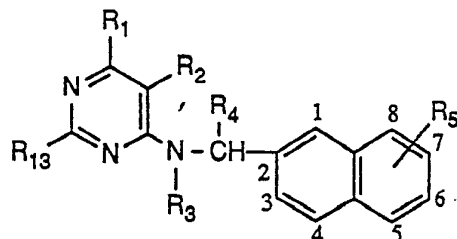
Quadro 6:



Comp No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₁₃	Dados Físicos
6.1	n-C ₃ H ₇	Br	OH	H	p.f.175-176°C
6.2	n-C ₃ H ₇	Br	Cl	H	Óleo
6.3	(CH ₃) ₂ CH	Br	OH	H	
6.4	(CH ₃) ₂ CH	Br	Cl	H	
6.5	n-C ₃ H ₇	H	Cl	H	Óleo
6.6	n-C ₄ H ₉	Cl	Cl	H	
6.7	(CH ₃) ₂ CH	Cl	Cl	H	
6.8	(CH ₃) ₂ CH	Cl	OH	H	
6.9	(CH ₃) ₂ CH	I	Cl	H	
6.10	C ₂ H ₅	Br	OH	H	p.f.175-176°C
6.11	C ₂ H ₅	Br	Cl	H	p.f.112-114°C/2400 Pa
6.12	C ₂ H ₅	F	Cl	H	
6.13	n-C ₃ H ₇	I	Cl	H	Óleo
6.14	n-C ₃ H ₇	F	Cl	H	
6.15	n-C ₃ H ₇	Cl	Cl	H	p.e.92-95°C/1100 Pa

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₁₃	Dados Físicos
6.16	C ₂ H ₅	I	OH	H	P.F. 191-192°C
6.17	C ₂ H ₅	I	Cl	H	P.f. 56-57°C
6.18	n-C ₄ H ₉	NO ₂	OH	H	
6.19	n-C ₃ H ₇	NO ₂	OH	H	
6.20	C ₂ H ₅	NO ₂	OH	H	P.f. 181-183°C
6.21	(CH ₃) ₂ CH	NO ₂	OH	H	
6.22	(CH ₃) ₂ CH	NO ₂	Cl	H	
6.23	C ₂ H ₅	NO ₂	Cl	H	Óleo
6.24	C ₂ H ₅	NH ₂	Cl	H	
6.25	n-C ₃ H ₇	NH ₂	Cl	H	
6.26	n-C ₄ H ₉	NO ₂	Cl	H	
6.27	CF ₃	Cl	Cl	H	p.e. 50°C/1600 Pa
6.28	CF ₃	Br	Cl	H	
6.29	n-C ₃ H ₇	NO ₂	Cl	H	
6.30	n-C ₃ H ₇	NH ₂	Cl	H	
6.31	(CH ₃) ₂ CH	H	Cl	H	
6.32	n-C ₄ H ₉	H	Cl	H	
6.33	n-C ₄ H ₉	Cl	Cl	H	
6.34	-C ₄ H ₉	Br	Cl	H	
6.35	C ₂ H ₅	Br	OH	CH ₃	p.f. 179-180°C,
6.36	C ₂ H ₅	Br	Cl	CH ₃	Óleo
6.37	C ₂ H ₅	Cl	Cl	CH ₃	Óleo

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₃	R ₁₃	Dados Físicos
6.38	n-C ₃ H ₇	Cl	OH	CH ₃	
6.39	n-C ₃ H ₇	Cl	Cl	CH ₃	
6.40	n-C ₃ H ₇	Cl	OH	CH ₃	
6.41	n-C ₃ H ₇	Cl	Cl	CH ₃	
6.42	n-C ₃ H ₇	Br	OH	CH ₃	
6.43	n-C ₃ H ₇	Br	Cl	CH ₃	
6.44	n-C ₃ H ₇	I	OH	CH ₃	
6.45	n-C ₃ H ₇	I	Cl	CH ₃	
6.46	n-C ₃ H ₇	I	OH	H	P. f. 181-183°C
6.47	-CH(CH ₃)C ₂ H ₅	Cl	Cl	H	Óleo
6.48	-CH(CH ₃)CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	Cl	H	Óleo
6.49	-CH(CH ₃)CH ₂ -C≡CH	Cl	Cl	H	
6.50	-CHCl-CH ₃	Cl	Cl	H	Óleo
6.51	-CH(CH ₃)-SCH ₃	Cl	Cl	H	Óleo
6.52	-CH(CH ₃)-SOCH ₃	Cl	Cl	H	Óleo
6.53	-CH(CH ₃)-SO ₂ CH ₃	Cl	Cl	H	P. f. 94-95°C

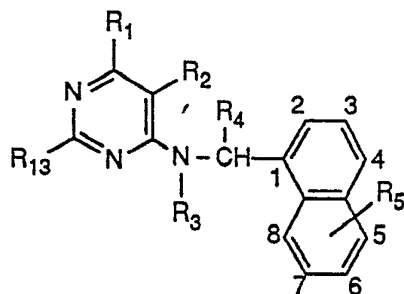
Quadro 7: Derivados β -naftilo

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
7.1	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	P.f. 83-84°C
7.2	F	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
7.3	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.4	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.5	Cl	NH ₂	(CH ₃) ₂ CH	CH ₃	H	H	P.f. 128-129°C
7.6	CH ₃	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.7	n-C ₃ H ₇	H	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.8	Cl	NH ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	resina
7.9	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	H	6-Br	
7.10	CH ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅	H	6-OCH ₃	
7.11	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.12	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	óleo
7.13	Ciclopropilo	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.14	CH ₃	H	(CH ₃) ₂ CH	CH ₃	H	H	óleo
7.15	CH ₃	Cl	(CH ₃) ₂ CH	CH ₃	H	H	óleo
7.16	CH(CH ₃) ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.17	Cl	Cl	Cl	CH ₃	H	H	

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
7.18	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	Óleo
7.19	H	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
7.20	n-C ₃ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.21	Cl	Br	Cl	CH ₃	H	H	
7.22	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H	H	Óleo
7.23	H	F	SCH ₃	CH ₃	H	H	
7.24	C ₂ H ₅	Cl	n-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H	
7.25	H	CH ₃	Cl	CH ₃	H	H	P.f. 143-144°C
7.26	C ₂ H ₅	Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
7.27	n-C ₃ H ₇	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.28	CH(CH ₃) ₂	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.29	Cl	Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
7.30	C ₂ H ₅	Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
7.31	H	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	H	p.f. 127-128°C
7.32	H	CH ₃	SCH ₃	CH ₃	H	H	Resina
7.33	n-C ₃ H ₇	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
7.34	n-C ₃ H ₇	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	H	
7.35	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	H	resina
7.36	CH(CH ₃) ₂	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
7.37	CH(CH ₃) ₂	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	H	
7.38	H	I	Cl	CH ₃	H	H	
7.39	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	6-Br	Óleo
7.40	Cl	Br	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
7.41	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₃	H	6-CH ₃	

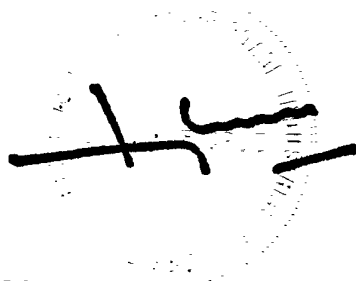
Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
7.42	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	H	6-Br	P.f. 103-104°C
7.43	H	F	OC ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
7.44	C ₂ H ₅	Br	Cl	CH ₃	H	H	
7.45	C ₂ H ₅	F	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.46	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	H	6-CH ₃	
7.47	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	6-CH ₃	Óleo
7.48	CH(CH ₃) ₂	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	Óleo
7.49	Cl	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.50	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	H	
7.51	C ₂ H ₅	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
7.52	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
7.53	CH(CH ₃)C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.54	C ₂ H ₅	Cl	SCH ₃	CH ₃	H	H	
7.55	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.56	n-C ₄ H ₉	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.57	H	Cl	SCH ₃	CH ₃	H	H	
7.58	H	F	Cl	CH ₃	H	H	
7.59	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.60	C ₂ H ₅	I	Cl	CH ₃	H	H	
7.61	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopropilo	CH ₃	H	H	
7.62	C ₂ H ₅	Br	OC ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
7.63	C ₂ H ₅	Cl	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
7.64	C ₂ H ₅	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	H	

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
7.65	C ₂ H ₅	Br	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
7.66	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	H	6-Br	
7.67	C ₂ H ₅	Cl	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H	
7.68	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	Ciclo-propilo	H	H	
7.69	C ₂ H ₅	Br	SC ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
7.70	C ₂ H ₅	Cl	Ciclopripilo	C ₂ H ₅	H	H	
7.71	C ₂ H ₅	Br	n-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H	
7.72	C ₂ H ₅	Br	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
7.73	Ciclopripilo	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
7.74	Ciclopripilo	Cl	CH ₃	CH ₃	H	6-Br	
7.75	C ₂ H ₅	Br	Ciclopripilo	CH ₃	H	H	
7.76	C ₂ H ₅	Cl	CF ₃	CH ₃	H	H	
7.77	C ₂ H ₅	Cl	CCl ₃	CH ₃	H	H	
7.78	Cl	H	CCl ₃	CH ₃	H	H	
7.79	Cl	Cl	CCl ₃	CH ₃	H	H	
7.80	Cl	Br	CCl ₃	CH ₃	H	H	
7.81	C ₂ H ₅	Cl	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H	
7.82	C ₂ H ₅	Br	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H	
7.83	Cl	Cl	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	H	H	

Quadro 8: Derivados α -naftilo

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
8.1	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	Óleo
8.2	H	Cl	Cl	CH ₃	H	H	P. f. 104-105°C
8.3	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.4	n-C ₃ H ₇	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.5	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.6	H	F	Cl	CH ₃	H	H	
8.7	C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	Óleo
8.8	CH ₃	Cl	(CH ₃) ₂ CH	CH ₃	H	H	
8.9	n-C ₃ H ₇	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.10	H	Cl	OCH ₃	CH ₃	H	H	
8.11	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.12	CH ₃	Cl	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	Óleo
8.13	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.14	H	I	Cl	CH ₃	H	H	
8.15	Cl	I	Cl	CH ₃	H	H	
8.16	n-C ₃ H ₇	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.17	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.18	C ₂ H ₅	Cl	Cl	CH ₃	H	H	

Comp. No.	R ₁	R ₂	R ₁₃	R ₄	R ₃	R ₅	Dados Físicos
8.19	Cl	Br	Cl	CH ₃	H	H	
8.20	Cl	Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
8.21	C ₂ H ₅	Cl	N(CH ₃) ₂	CH ₃	H	H	
8.22	n-C ₃ H ₇	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
8.23	C ₂ H ₅	Br	Cl	CH ₃	H	H	
8.24	H	F	OCH ₃	CH ₃	H	H	
8.25	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.26	C ₂ H ₅	I	Cl	CH ₃	H	H	
8.27	C ₂ H ₅	Cl	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H	
8.28	CH ₃	I	CH ₃	CH ₃	H	H	
8.29	Cl	Cl	Cl	CH ₃	H	H	
8.30	H	Cl	SCH ₃	CH ₃	H	H	
8.31	n-C ₄ H ₉	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	

Dados RMN de compostos que não cristalizamComp. No. RMN; valores ppm

1.18	8,2 S (pirim.); 7,5-7,9 (arom. H); 5,6 M (CHN); 5,1 D (NH); 2,5 Q (CH ₂); 1,7 D (CH ₃); 1,1 T (CH ₃).
1.43	8,3 S (pirim.); 7,2-8,2 M (arom. H); 5,8 M (CH-N, NH); 4,1 S (OCH ₃); 2,7 Q (-CH ₂ -); 1,6 D (-CH ₃); 1,2 T (-CH ₃).
1.45	8,4 S (pirim.); 7,0-7,8 M (arom. H); 5,7 D (NH); 5,3 m (CH-N); 4,1 s (OCH ₃); 2,7 Q (-CH ₂ -); 1,7 M (-CH ₂); 1,1 M (-CH ₃ , n CH ₃).
1.48	8,3 S (pirim.); 7,3-8,3 (arom. H); 7,2 D (J = 70 Hz), (F-CH); 6,9 D (J = 70 Hz), (F-CH); 5,8 D (-N-H); 5,7 M (CH-N); 2,8 M (-CH ₂ -); 1,6 D (CH ₃); 1,2 T (-CH ₃).
1.53	8,2 S (pirim.); 7,2-7,9 M (arom. H); 5,2-5,8 M (CH e NH); 2,4 S (CH ₃); 1,2 D (CH ₃).
1.55	8,3 S (pirim.); 7,0-7,7 M (arom. H); 5,68 D (NH); 5,24 Q (C-H); 3,86 S (-OCH ₃), 2,42 S (-CH ₃), 2,0 M (-CH ₂ -),
	3,86 S (-OCH ₃), 2,42 S (-CH ₃), 2,0 M (-CH ₂ -), 0,96 T (-CH ₃).
1.56	8,34 S (pirim.); 7,2-7,4 M (arom. H); 5,66 D (N-H), 5,46 M (CHN); 2,46 S (-CH ₃), 2,42 S (-CH ₃), 1,64 D (-CH ₃).
1.58	8,3 S (pirim.); 7,3-8,1 M (arom. H); 6,0 D (-NH), 5,8 M (-C-H); 4,1 (OCH ₃), 2,44 S (-CH ₃), 1,6 D (-CH ₃).
1.61	8,5 S (pirim.); 7,2-7,9 M (arom. H); 6,6 D (NH); 5,5 M (CHN); 2,8 Q (CH ₂); 2,2 S (SCH ₃); 1,7 D (CH ₃); 1,2 T (CH ₃).
1.80	8,4 S (pirim.); 8,0 D (NH); 7,2-7,8 M (arom. H); 5,6 M

- (CHN); 2,7 Q (CH₂); 1,7 D (CH₃); 1,3 T (CH₃).
- 1.84 8,4 S (pirim.); 7,2-7,8 M (arom. H); 5,2-5,8 (CH e NH); 2,5-2,9 Q (CH₂); 1,6 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).
- 1.86 8,4 S (pirim.); 7,2-7,8 M (arom. H); 5,2-5,7 M (CHN, NH); 2,75 (CH₂); 1,3-1,9 D+M (CH₃CH, CH₂); 1,0 T (CH₃).
- 1.89 8,4 S (pirim.); 7,3-8,0 M (arom. H); 5,3 M (NH e CH); 2,6-2,9 T (CH₂); 1,4-2,1 M (CH₂ e CH₃); 1,0 T (CH₃).
- 1.100 8,3 S (pirim.); 7,2-7,9 M (arom. H); 5,7 (NH); 5,4 Q (CH); 2,7 Q (CH₂); 1,6 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).
- 1.108 8,4 S (pirim.); 7,3-7,9 M (arom. H); 8,3-8,8 amplo (NH); 5,5 M (CH); 2,3-3,1 Q (CH₂) + Q (CH₂S); 1,7 D (CH₃); 1,2 (2 x CH₃).
- 1.148 8,2 S (pirim.); 7,3-8,2 M (arom. H); 7,22 D (CHF); 6,92 D (CHF); 5,78 Δ (N-H); 5,66 M (-CH); 2,44 S (CH₃); 1,6 D (-CH₃).
- 1.150 8,4 S (pirim.); 7,4-8,0 M (arom. H); 5,3-5,9 M (NH, CH); 2,8 Q (CH₂); 1,7 D (CH₃); 1,3 T (CH₃).
- 1.151 8,3 S (pirim.); 7,2-7,8 M (arom. H); 5,3-5,9 M (NH, CH); 2,8 Q (CH₂); 2,5 S (CH₃); 1,6 D (CH₃); 1,3 T (CH₃).
- 2.46 8,4 S (pirim.); 7,1-8,1 M (arom. H); 6,1 P (CH); 5,6 D (NH); 2,7 T (CH₂); 1,4-1,9 M (CH₂); 1,7 D (CH₃); 1,0 T (CH₃).
- 2.74 8,38 S (pirim.); 7,34-8,26 M (arom. H); 5,9 Q (-CH); 5,66 D (N-H); 2,78 Q (-CH₂); 2,06 M (CH₂); 1,24 T (-CH₃); 1,02 T (-CH₃).
- 3.3 8,3 S (pirim.); 7,1-7,8 M (arom. H); 5,2 D (N-H); 4,6 M (CH); 2,4-3,0 M (CH₂); 0,8-1,7 M (CH₂, CH₃).
- 6.2 8,8 S (pirim.); 3,0 T (CH₂); 1,8 M (CH₂); 1,05 T (CH₃).
- 6.5 8,9 S (pirim.); 2,7 (CH₂); 1,4-2,1 M (CH₂); 1,0 T (CH₃).
- 6.23 9,0 S (pirim.); 2,8 Q (CH₂); 1,35 T (CH₃).
- 7.47 7,2-7,8 M (arom. H); 5,3-5,7 (CH, NH); 2,5-2,9 Q (CH₂);

2,55 (CH₃); 2,6-2,7 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).

8.1 7,2-8,3 M (arom. H); 6,0-6,4 M; 5,5-5,8 D (NH); 2,6-3,0
Q (CH₂); 2,5 S (CH₃); 2,7 D (CH₃); 2,2 T (CH₃);

8.8 7,2-8,3 M (arom. H); 6,0-6,4 M (CH); 5,3-5,6 D (NH);
2,5-3,1 M (CH); 2,4 S (CH₃); 1,7 D (CH₃); 1,1 T (CH₃).

8.13 7,3-8,3 M (arom. H); 5,9 S (pirim.); 5,3-5,8 M (CH,
NH); 2,55 (CH₃); 2,3-2,6 Q (CH₂); 2,7 D (CH₃); 1,3-2,0
M (CH); 1,1 T (CH₃).

1.101 8,2 S (pirim.); 7,2-7,9 M (arom. H); 5,2-5,9 (NH, CH);
2,6 S (CH₃); 1,6 D (CH₃).

1.161 8,4 S (pirim.); 7,1-7,9 M (arom. H); 5,2-5,9 M (NH,
CH); 4,5 S (OCH₂); 3,55 (OCH₃); 2,7 D (CH₃).

1.70 8,3 S (pirim.); 7,1-7,7 (arom.), 5,9 D (NH); 4,9 M
(CHN); 3,9 S (OCH₃); 2,8 Q (CH₂); 1,3 T (CH₃); 0,5-0,7
(M) (cicl.).

1.74 7,4-8,4 M (arom. H e pirim-H); 5,73 d (-NH); 5,43 Q

|
(-CH-); 2,8 Q (-CH₂); 1,97 M (-CH₂-); 1,43 M (-CH₂-);
1,26 M (CH₃); 1,0 T (CH₃).

1.88 7,4-8,45 M (arom. H e pirim-H); 5,37 Q (-CH-); 2,45 S

|
(CH₃); 2,0 M (-CH₂-); 1,45 M (-CH₂-); 1,0 T (CH₃).

3.30 7,35-8,45 M (arom. H e pirim-H); 5,38 D (NH); 4,6 M
(CH₂); 3,13 M (CH₂); 2,95 M (-CH₂); 2,28 M (CH₂); 1,26
M (CH₃).

1.154 8,3 S (pirim.); 7,0-7,8 M (arom. H); 5,6-5,9 D (NH);

- 5,1-5,4 Q (NCH); 3,95 (OCH₃); 2,6-3,0 Q (CH₂); 1,4-2,3 M (CH₂); 0,8-1,4 M (2 x CH₃).
- 1.155 8,35 S (pirim.); 7,2-7,8 M (arom. H); 5,2-5,9 M (NH; CH); 2,6-3,0 Q (CH₂); 2,5 S (CH₃); 2,4-2,6 D (CH₃); 1,1-1,4 T (CH₃).
- 1.181 8,4 S (pirim.); 7,1-7,9 M (arom. H); 6,4-6,9 D (NH); 5,2-5,6 Q (CHN); 2,6-3,0 Q (CH₂); 0,8-2,3 M (alif. H).
- 1.182 8,3 S (pirim.); 7,2-7,9 M (arom. H); 5,3-5,9 M (NH; CHN); 2,6-3,0 Q (CH₂); 1,6-1,8 D (CH₃); 1,1-1,4 T (CH₃).
- 2,75 8,6 S (pirim.); 7,3-8,2 M (arom. H); 6,5 S (pirim.); 5,8 amplo (NH); 1,7-1,8 D (CH₃).
- 7,2 7,3-8,0 M (arom. H); 5,4-5,8 M (CHN); 4,8-5,2 D (NH); 2,2-2,9 M (2 x CH₂); 2,6-2,8 D (CH₃); 0,9-1,4 M (2 x CH₃).
- 7,8 7,2-7,9 M (arom. H); 5,2-5,6 M (NH, CHN); 3,9-3,6 amplo (NH); 2,4 S (CH₃); 1,5-1,7 D (CH₃).
- 7,12 7,3-8,0 M (arom. H); 5,6-5,9 M (CH, NH); 2,6-3,9 Q (CH₂); 2,4 S (CH₃); 1,6-1,8 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).
- 7,14 7,3-7,9 M (arom. H); 5,9 S (pirim.); 5,3-5,7 amplo (NH); 4,7-5,1 M (CH); 2,5-3,7 M (CH); 2,2 S (CH₃); 1,5-1,7 D (CH₃); 1,2-1,4 D (CH₃).
- 7,15 7,2-7,9 M (arom. H); 5,3-5,7 M (CH, NH); 2,5-3,2 M (CH); 2,4 S (CH₃); 2,6-2,8 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).
- 7,18 7,3-8,9 (arom. H); 5,3-5,7 M (NH, CH); 2,5-2,9 Q (CH₂); 2,45 (CH₃); 2,6 D (CH₃); 1,1 T (CH₃).
- 7,22 7,3-7,9 M (arom. H); 5,8 S (pirim.); 5,3-5,5 D (NH); 5,0 M (CH); 2,3-2,7 Q (CH₂); 2,5 S (CH₃); 1,6 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).
- 7,32 7,3-7,9 M (arom. H); 5,3-5,7 Q (CH); 4,6-5,0 amplo (NH); 2,3 S (SCH₃); 1,9 S (CH₃); 1,6 D (CH₃).

- 7.35 7,2-7,9 M (arom. H); 5,8 S (pirim.); 5,2-5,5 M (NH); 4,6-5,0 M (CH); 2,5 S (CH₃); 2,2 S (CH₃); 1,5 D (CH₃).
- 7.39 7,3-7,9 M (arom. H); 5,2-5,7 M (CH, NH); 2,5-2,9 Q (CH₂); 2,4 S (CH₃); 1,5-1,7 D (CH₃); 1,2 T (CH₃);
- 7.46 7,2-7,9 M (arom. H); 5,3-5,8 M (CH, NH); 2,4-3,0 Q (CH₂); 2,5 S (2 x CH₂); 2,6-2,7 D (CH₃); 1,2 T (CH₃).
- 6.2 8,9 S (pirim.); 3,0 T (CH₂); 1,3-2,1 M (CH₂); 1,0 T (CH₃);
- 6.5 8,9 S (pirim.); 7,2 S (pirim.); 2,6 T (CH₂); 1,4-2,0 M (CH₂); 0,1 T (CH₃).
- 6.13 8,7 S (pirim.); 3,0 T (CH₂); 1,4-2,1 M (CH₂); 1,0 T (CH₃).
- 6.36 2,9 Q (CH₂); 2,7 S (CH₃); 1,3 T (CH₃).
- 6.37 2,9 Q (CH₂); 2,7 S (CH₃); 1,3 T (CH₃).
- 6.47 8,80 (s, 1H, pirimidina); 3,42-3,35 (m, 1H, CH); 1,87-1,79 (m, 1H, CH); 1,67-1,58 (m, 1H, CH); 1,25 (d, 3H, CH₃); 0,87 (t, 3H, CH₃).
- 6.48 8,78 (s, 1H, pirimidina); 5,77-5,65 (m, 1H, =CH); 5,02-4,95 (m, 2H, =CH); 3,59-3,50 (m, 1H, CH); 2,61-2,53 (m, 1H, CH); 2,38-2,32 (m, 1H, CH); 1,27 (d, 3H, CH₃).
- 6.50 8,90 (s, 1H, pirimidina); 5,50 (q, 1H, CH); 1,90 (d, 3H, CH₃).
- 6.51 8,82 (s, 1H); 4,43 (q, 1H, CH); 2,04 (s, 3H, CH₃); 1,67 (d, 3H, CH₃).
- 6.52 8,88 (s, 1H, pirimidina); 8,87 (s, 1H, pirimidina); 4,76 (q, 1H, CH); 4,63 (q, 1H, CH); 2,61 (s, 3H, CH₃); 2,53 (s, 3H, CH₃); 1,73 (d, 3H, CH₃); 1,68 (d, 3H, CH₃).
- 1.195 8,44 (2s, 1H, pirimidina); 7,85-7,78 (m, 4H); 7,51-7,43 (m, 3H); 5,78-5,68 (m, 2H, NH e =CH); 5,56-5,51 (m, 1H,

CH); 5,05-4,94 (m, 2H, =CH); 3,39-3,33 (m, 1H, CH);
2,55-2,46 (m, 1H, CH); 2,33-2,25 (m, 1H, CH); 1,70 (2d,
3H, CH₃); 1,23-1,08 (2d, 3H, CH₃).

1.200 8,48 (2s, 1H); 7,86-7,80 (m, 4H); 7,51-7,43 (m, 3H);
5,73 (d, 1H, NH); 5,58-5,50 (m, 1H, CH); 4,13 (q, 1H,
CH); 2,04 (s, 2H, CH₃); 1,70 (2d, 3H, CH₃); 1,62-1,55
(2d, 3H, CH₃).

1.202 8,43 (2a, 1H, pirimidina); 7,86-7,77 (m, 4H); 7,52-7,44
(m, 3H); 5,84 (d, 1H, NH); 5,57-5,48 (m, 1H, CH); 4,75
(q, 1H, CH); 3,0 (2s, 3H, CH₃); 1,81-1,75 (2d, 3H,
CH₃); 1,70 (2d, 3H, CH₃).

Exemplos de Formulação para ingredientes activos da fórmula I
(ao longo dos exemplos, as percentagens são em peso)

<u>1. Concentrados emulsificáveis</u>	a)	b)	c)
um composto dos			
Quadros 1 a 5, 7, 8	25%	40%	50%
dodecilbenzenessulfonato de cálcio	5%	8%	6%
éter polietileno glicol óleo de			
castor (36 mol de óxido de etileno)	5%	-	-
éter polietileno glicol tributil-			
fenol (30 mol de óxido de etileno)	-	12%	4%
ciclohexanona	-	15%	20%
mistura xilenos	65%	25%	20%

Emulsões com qualquer concentração desejada podem ser produzidas a partir desses concentrados por diluição com água.

<u>2. Soluções</u>	a)	b)	c)	d)
um composto dos				
Quadros 1 a 5, 7, 8	80%	10%	5%	95%
éter propileno glicol				
monometílico	20%	-	-	-
polietileno glicol				
(p.mol. 400)	-	70%	-	-
N-metil-2-pirrolidona	-	20%	-	-
óleo coco epoxidizado	-	-	1%	5%
fracção petróleo (ponto				
ebulição 160-190°C)	-	-	94%	-

Estas soluções são apropriadas para aplicação sob a forma de micro-gotas.

<u>3. Grânulos</u>	a)	b)	c)	d)
um composto dos				
Quadros 1 a 5, 7, 8	5%	10%	8%	21%
caolino	94%	-	79%	54%
ácido silícico				
altamente disperso	1%	-	13%	7%
atapulgite	-	90%	-	18%

O ingrediente activo é dissolvido em cloreto de metileno, a solução é pulverizada para o veículo, e o solvente é separado por evaporação in vacuo.

<u>4. Poeiras</u>	a)	b)
um composto dos		
Quadros 1 a 5,7,8	2%	5%
ácido silícico		
altamente disperso	1%	5%
talco	97%	-
caolino	-	90%

Poeiras prontas para utilização são obtidas misturando intimamente os veículos com o ingrediente activo.

<u>5. Pós humidificáveis</u>	a)	b)	c)
um composto dos			
Quadros 1 a 5,7,8	25%	50%	75%
lignossulfonato de			
sódio	5%	5%	-
laurilsulfato de sódio	3%	-	5%
sulfonato de diiso-			
butilnaftaleno			
de sódio	-	6%	10%
éter polietileno glicol			
octilfenólico (7-8 mol			
de óxido de etileno)	-	2%	-
ácido silícico			
altamente disperso	5%	10%	10%
caolino	62%	27%	-

O ingrediente activo é completamente misturado com os adjuvantes e a mistura é totalmente moída num moinho apropriado, proporcionando pós humidificáveis que podem ser diluídos com água para dar origem a suspensões com a concentração desejada.

6. Concentrado emulsificável

um composto dos	
Quadros 1 a 5,7,8	10%
éter polietileno glicol	
octilfenólico (4-5 mol	
de óxido de etileno)	3%
dodecilbenzenessulfonato	
de cálcio	3%
éter poliglicólico de óleo	
de castor (36 mol de óxido	
de etileno)	4%
ciclohexanona	30%
mistura de xilenos	50%

Emulsões com a concentração requerida podem ser obtidas a partir deste concentrado por diluição com água.

Exemplos Biológicos: A. Acção Microbica

B-1: Phythium ultimum em Beta vulgaris (beterraba do açúcar, "Kleinwanzleben Monogerm") e Phythium ultimum em Zea mays (milho, "Milho Doce")

Método do teste: Micélio de Phythium ultimum é misturado com solo (500 ml de suspensão de micélio para 10 litros de solo) e a mistura fungo/solo é introduzida em tabuleiros de plástico de 250 ml. Após incubação durante 4 dias a 10°C, 10 sementes da planta do teste (milho ou beterraba do açúcar) são colocadas em cada tabuleiro. No dia que se segue, os tabuleiros assim preparados são cada um deles regado com 50 ml de uma solução para pulverização (preparada a partir de uma formulação com 25% de pó humidificável e água) compreendendo 0,002% a.i.. Após um período de incubação de 7 dias a 10°C e um período de incubação subsequente de 4 dias a 22°C, a acção do composto do teste é avaliada tendo como base o número e aspecto das plantas emergidas. Os compostos dos Quadros 1 a 5, 7 e 8 apresentam boa actividade contra os agentes patogénicos Phytium.

B-2: Acção contra Puccinia graminis no trigo

a) Acção protectora residual

Plantas do trigo são pulverizadas 6 dias depois de terem sido semeadas, com uma mistura para pulverização (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. Após 24 horas as plantas tratadas são infectadas com uma suspensão de esporos de uredo do fungo. As plantas infectadas são incubadas durante 48 horas a 95-100% de humidade relativa e a cerca de 20°C permanecendo então numa estufa a cerca de 22°C. A avaliação do desenvolvimento da pústula de ferrugem é feita 12 dias após a infecção.

b) Ação sistémica

Plantas do trigo são regadas 5 dias depois de terem sido semeadas com uma mistura para pulverização (0,006% de ingrediente activo, tendo como base o volume do solo) preparada a partir de uma formulação em pó humidificável do composto do teste. Após 48 horas as plantas tratadas são infectadas com uma suspensão de esporos uredo do fungo. As plantas infectadas são então incubadas durante 48 horas a 95-100% de humidade relativa e a cerca de 20°C permanecendo então numa estufa a cerca de 22°C. A avaliação do desenvolvimento da pústula de ferrugem é feita 12 dias após a infecção.

Os compostos dos Quadros 1 a 5, 7 e 8 apresentam boa actividade contra os fungos Puccinia. Assim, por exemplo, compostos 1.1 e 2.2 inibem a infestação por fungos de 0 a 20%. Por outro lado, a infestação com Puccinia é de 100% nas plantas não tratadas e infectadas de controlo.

B-3: Ação contra Phytophthora infestans em tomateiros

a) Ação protectora residual

Após um período de cultura de 3 semanas, os tomateiros são pulverizados com uma mistura para pulverização (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. Após 24 horas as plantas tratadas são infectadas com uma suspensão de esporangio do fungo. As plantas infectadas são então incubadas durante 5 dias a 90-100% de humidade relativa e a cerca de 20°C sendo então avaliadas quanto à infestação por fungos.

b) Ação sistémica

Após um período de cultura de 3 semanas, uma mistura para pulverização (0,006% de ingrediente activo, tendo como base o volume do solo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste é usada para regar os tomateiros. Deve-se ter cuidado para que a mistura para pulverização não entre em contacto com as partes da planta situadas acima do solo. As plantas tratadas são infectadas 48 horas mais tarde com uma suspensão de esporangio do fungo. As plantas infectadas são então incubadas durante 5 dias a 90-100% de humidade relativa e a 20°C sendo então avaliadas quanto à infestação por fungos.

Os compostos dos Quadros 1 a 5, 7 e 8 apresentam boa actividade protectora contra *Phytophthora*. Assim, por exemplo, compostos 1.1, 1.18 e 1.19 reduzem a infestação por fungos para de 0 a 20%. Por outro lado, a infestação por *Phytophthora* é de 100% nas plantas não tratadas e infectadas de controlo.

B-4: Ação contra *Cercospora arachidicola* sobre plantas de amendoim

Plantas de amendoim com 10-15 cm de altura são pulverizadas com uma mistura para pulverização (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste, e infectadas 48 mais tarde com uma suspensão de conidia dos fungos. As plantas infectadas são incubadas durante 72 horas a cerca de 21°C e com humidade elevada permanecendo então numa estufa até aparecerem as pequenas manchas típicas da folha.

A avaliação da acção fungicida é feita 12 dias após a infecção e tem como base o número e o tamanho das pequenas manchas.

Em comparação com as plantas não tratadas e infectadas de controlo (número e tamanho das pequenas manchas = 100%), a infestação por *Cercospora* nas plantas de amendoim tratadas com compostos dos Quadros 1 a 5, 7 e 8 é reduzida (10-20%); assim, por exemplo, compostos 1.2, 1.3, 1.53, 1.73, 1.84, 1.86, 1.100 e 1.149.

B-5: Accção contra *Plasmopara viticola* em vinhas

a) Accção protectora residual

Plantas pequenas da vinha no estadio de 4-5 folhas são pulverizadas com uma mistura para pulverizar (0,02% a.i.) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. Após 24 horas as plantas tratadas são infectadas com uma suspensão de esporangio dos fungos. A infestação pelos fungos é avaliada após incubação durante 6 dias a 95-100% de humidade relativa e 20°C.

b) Accção curativa

Plantas pequenas da vinha no estadio de 4-5 folhas são infectadas com uma suspensão de esporangio dos fungos. Após incubação durante 24 horas numa câmara de humidade com 95-100% de humidade relativa e 20°C, as plantas infectadas são pulverizadas com uma mistura para pulverização (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. Depois do revestimento pulverizado ter secado, as plantas tratadas são colocadas de novo na câmara de humidade.

A avaliação da infestação pelos fungos é feita 6 dias após a infecção.

Compostos dos Quadros 1 a 5, 7 e 8 apresentam boa actividade protectora contra *Plasmopara viticola* (infestação inferior a 20%); assim, por exemplo, compostos 1.2 e 1.18. Por outro lado, a infestação por *Plasmopara* é de 100% em plantas não tratadas e infectadas de controlo.

B-6: Accção contra *Pyricularia oryzae* sobre plantas do arroz

a) Accção protectora residual

Após um período de cultura de 2 semanas, as plantas do arroz são pulverizadas com uma mistura para pulverização (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. Após 48 horas as plantas tratadas são infectadas com uma suspensão de conidia dos fungos. A avaliação da infestação pelos fungos é feita após incubação durante 5 dias a 95-100% de humidade relativa e a cerca de 22°C.

b) Accção sistémica

Plantas do arroz com 2 semanas de idade são regadas com uma mistura para pulverização (0,006% de ingrediente activo, tendo como base o volume do solo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. Os vasos são então cheios com água de modo a que as partes mais inferiores dos caules das plantas do arroz permaneçam na água. Após 96 horas, as plantas tratadas são infectadas com uma suspensão de conidia dos fungos. As plantas do arroz infectadas são então colocadas numa estufa a cerca de 22°C e a avaliação da infestação pelos fungos é feita após 10 dias. As plantas infectadas são então incubadas

durante 5 dias a 95-100% de humidade relativa e a cerca de 24°C sendo então avaliadas quanto à infestação pelos fungos.

Em comparação com plantas de controlo não tratadas (infestação=100%), as plantas do arroz tratadas com uma mistura para pulverização tendo como base os compostos dos Quadros 1 a 5 apresentam apenas uma infestação ligeira pelos fungos. Assim, por exemplo, compostos nos. 1.2, 1.3, 1.53, 1.73, 1.84, 1.86, 1.100 e 1.149 no teste (a) e compostos nos. 1.46 e 1.47 no teste (b) reduzem a infestação por fungos a de 0 a 10%.

B-7: Acção protectora residual contra Venturia inaequalis sobre rebentos de macieiras

Rebentos recentes de estacas de macieiras com 10-20 cm de comprimento são pulverizados com uma mistura para pulverização (0,02% a.i.) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. As plantas tratadas são infectadas 24 horas mais tarde com uma suspensão de conidia dos fungos. As plantas são então incubadas durante 5 dias a 90-100% de humidade relativa permanecendo numa estufa durante mais 10 dias a 20-24°C. A infestação pela sarna é avaliada 15 dias após a infecção.

Os compostos dos Quadros 1 a 5 apresentam uma boa actividade protectora contra venturia.

B-8: Acção contra Erysiphe graminis na cevada

a) Acção protectora residual

Plantas da cevada com cerca de 8 cm de altura são pulverizadas com uma mistura para pulverização (0,02% de

ingrediente activo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste. As plantas tratadas são polvilhadas com conidia dos fungos após 3 a 4 horas. As plantas da cevada infectadas permanecem numa estufa a cerca de 22°C. A infestação pelos fungos é avaliada após 10 dias.

b) Accção sistémica

Uma mistura para pulverização (0,002% do ingrediente activo, tendo como base o volume do solo) preparada a partir de uma formulação de pó humidificável do composto do teste é usada para regar as plantas da cevada com cerca de 8 cm de altura. Deve-se ter cuidado para que a mistura para pulverização não entre em contacto com as partes da planta situadas acima do solo. As plantas tratadas são polvilhadas 48 horas mais tarde com conidia dos fungos. As plantas da cevada infectadas permanecem então numa estufa a cerca de 22°C e a avaliação da infestação pelos fungos é feita após 10 dias.

Os compostos das fórmulas dos Quadros 1 a 5, 7 e 8 apresentam boa actividade contra Erysiphae fungi. A infestação por Erysiphae é de 100% nas plantas não tratadas e infectadas de controlo. Dos compostos dos Quadros, os compostos nos. 1.2, 1.3, 1.53, 1.73, 1.84, 1.86, 1.100 e 1.149 inibem a infestação por fungos a de 0 a 5%.

Exemplos Biológicos: B. Ação acaricida/insecticida

B-7: Ação contra Tetranychus urticae

Faveiras jovens são povoadas com uma população mixta de Tetranychus urticae e pulverizadas um dia mais tarde com uma emulsão aquosa compreendendo 400 ppm do composto do teste. As plantas são então incubadas durante 6 dias a 25°C sendo então avaliadas. A redução percentual na população (% da actividade) é determinada comparando o número de ovos, larvas e adultos mortos nas plantas tratadas com o número encontrado nas plantas não tratadas.

Os compostos do Quadro 1 apresentam boa actividade contra Tetranychus urticae neste teste. Em particular, compostos 1.2, 1.3, 1.9, 1.43, 1.53, 1.55, 1.58, 1.84, 1.149, 3.1 e 3.3 apresentam uma eficácia superior a 80%.

B-10: Ação contra Nilaparvata lugens

Plantas do arroz são pulverizadas com uma emulsão aquosa compreendendo 400 ppm do composto do teste. Depois do revestimento pulverizado estar seco, as plantas do arroz são povoadas com larvas cicada nos 2º e 3º estádios. A avaliação é feita 21 dias mais tarde. A redução percentual da população (% da actividade) é determinada por comparação entre o número de cicadas sobreviventes nas plantas tratadas e o número nas plantas não tratadas.

Os compostos do Quadro 1 apresentam boa actividade contra Nilaparvata lugens neste teste. Em particular, os compostos 1.2, 1.3 e 1.9 apresentam uma eficácia superior a 80%.

B-11: Accção contra Nephrotettix cincticeps

Plantas do arroz são pulverizadas com uma emulsão aquosa compreendendo 400 ppm do composto do teste. Depois do revestimento pulverizado estar seco, as plantas do arroz são povoadas com larvas cicada nos 2º e 3º estádios. A avaliação é feita 21 dias mais tarde. A redução percentual da população (% da actividade) é determinada por comparação entre o número de cicadas sobreviventes nas plantas tratadas e o número nas plantas não tratadas.

Os compostos do Quadro 1 apresentam boa actividade contra Nilaparvata lugens neste teste. Em particular, o composto 1.2 apresenta uma eficácia superior a 80%.

B-12: Accção contra Bemisia tabaci

Faveiras anãs são colocadas em gaiolas de tela metálica e povoadas com Bemisia tabaci adultos (mosca branca). Quando tem lugar a postura dos ovos, todos os adultos são removidos e 10 dias mais tarde as plantas e as crisálidas nelas localizadas são pulverizadas com uma emulsão aquosa dos compostos do teste (concentração 400 ppm). A avaliação é feita 14 dias após a aplicação do composto do teste determinando a percentagem da taxa de incubação em comparação com a dos controlos não tratados.

Neste teste, os compostos do Quadro 1 apresentam uma boa actividade contra Bemisia tabaci. Em particular, o composto no. 1.2 apresenta uma eficácia superior a 80%.

B-13: Ação ovicida/larvicida contra *Heliothis virescens*

Os depósitos de ovos de *Heliothis virescens* sobre as plantas do algodão são pulverizados com uma emulsão aquosa compreendendo 400 ppm do composto do teste. 8 dias mais tarde, a percentagem de ovos que foram incubados e a taxa de sobrevivência das lagartas são avaliadas em comparação com controles não tratados (% de redução na população).

Neste teste, os compostos do Quadro 1 apresentam uma boa actividade contra *Heliothis virescens*. Em particular, compostos 1.2, 1.3 e 1.9 apresentam uma eficácia superior a 80%.

B-14: Ação contra uma população mista de *Tetranychus cinnabarinus*

Séries de diluições

FAVEIRAS ANAS no estadio de 2 folhas são povoadas com uma população mista (ovos, larvas/crisálidas, adultos) de uma estirpe tolerante em relação a OP de TETRANYCHUS CINNABARINUS. Os compostos do teste são aplicados às plantas 24 horas após a infecção em quantidades medidas de 200, 100, 50 mg a.i./l numa câmara de pulverização automática. Os compostos do teste são formulados e são diluídos até às quantidades correspondentes com água. O teste é avaliado 2 e 7 dias após a aplicação quanto à percentagem de mortalidade contra

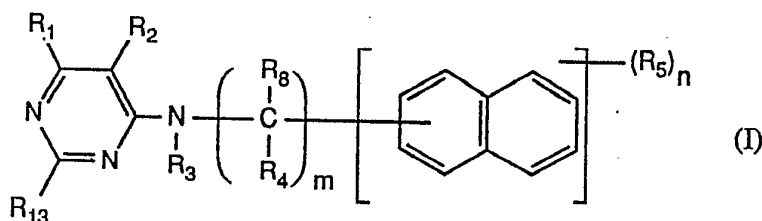
- ovos,
- larvas/crisálidas, - adultos.

Os compostos dos Quadros 1 a 5 apresentam uma mortalidade superior a 80% em diluições inferiores a 50 mg a.i./litro.

Os respectivos (-)-enantiômeros são também eficazes em quantida-
des ainda mais pequenas.

REIVINDICAÇÕES

12. - Processo para a preparação de um composto da fórmula I:



em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi ou por $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; C_2-7 alquenilo que é não substituído ou substituído por halogénio; C_3-C_7 cicloalquilo; halogénio ou C_2-C_4 alquinilo;

R_2 é hidrogénio; hidroxil; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; C_1-C_4 alcoxi; $S(O)_p-C_1-C_4$ alquil; halogénio, nitro, ciano; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; ou $N=C(R_9)R_{10}$;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por C_1-C_7 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_2-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxi; C_1-C_3 haloalquiltio; CN ; NO_2 ; ou um grupo $-X$ -fenil que ocorre uma vez no anel naftilo e que é não substituído ou é mono a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou

C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

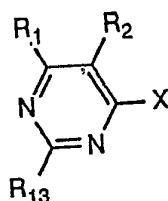
R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

R_{13} é hidrogénio; C_1-C_4 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; ciclopropilo; halogénio; C_1-C_3 alquiltio; ou $-N(C_1-C_3 \text{ alquilo})_2$; X é oxigénio ou enxofre; m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

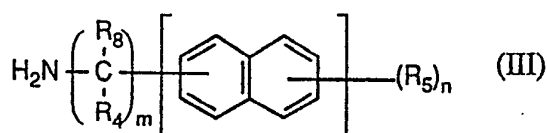
p é 0, 1 ou 2;

caracterizado por compreender a reacção de um composto da fórmula II



(II),

em que R₁, R₂ e R₁₃ são tal como foram definidos para a fórmula I e X é um radical facilmente removível, com um composto da fórmula III



em que R₄, R₅, R₈, m e n são tal como foram definidos para a fórmula I, de preferência na presença de uma base, e, se desejado, a introdução em seguida do substituinte R₃ (alquilo, benzilo, acilo ou -S-R₇) por meio de correspondente alquilação em N, benzilação em N, acilação em N ou tioalquilação em N ou tioarilação em N, respectivamente.

28. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I em que:
 R₁ é hidrogênio; C₁-C₅ alquilo; C₁-C₅ alquilo substituído por S(O)_p-C₁-C₃ alquilo; C₁-C₅ haloalquilo tendo de 1 a 5 átomos de halogênio; C₂-C₆ alcoxialquilo; C₂-C₇ alquenilo; C₂-C₇ haloalquenilo tendo 1 ou 2 átomos de halogênio; C₃-C₆ cicloalquilo; halogênio; ou C₂-C₄ alquinilo;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 5 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_3$ alquil; amina; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CD-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_2-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 haloalquiltio; CN ; NO_2 ; ou um grupo $-X$ -fenil que ocorre uma vez no anel naftilo e que é não substituído ou é mono- a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcóxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou

C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

3a. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I em que :

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo substituído por $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_2-C_5 haloalquênilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 cicloalquilo; halogénio; ou C_2-C_4 alquinilo;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano;

$S(O)_p-C_1-C_3$ alquil; amino; NHR_3 ; $N(R_3)_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio.

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;

R_4 e R_9 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_1-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 haloalquiltio; CN ; NO_2 ; ou um grupo $-X$ -fenil que ocorre uma vez no anel naftilo e que é não substituído ou é mono-

tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

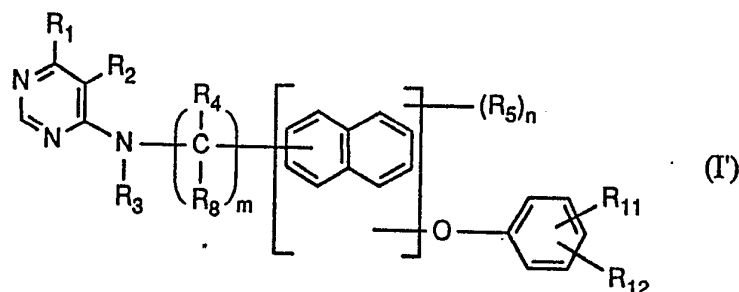
R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

48. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I'



em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 alquilo substituído por $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_2-C_5 haloalquênilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_6 cicloalquilo; halogénio; ou C_2-C_4 alquínilo;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano;

$S(O)_p-C_1-C_3$ alquil; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_6$; ou $-S-R_7$;
 R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_1-C_3 haloalquilo; ou C_1-C_3 haloalcóxi;

R_2 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1, ou 2; e

p é 0, 1 ou 2.

58. - Processo de acordo com a reivindicação 4, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I' em que:

R_1 a R_4 e R_8 são tal como foram definidos para a fórmula I;

R_5 é halogénio, C_1-C_3 alquilo, CF_3 , C_2-C_5 alcóxialquilo ou C_1-C_3 alcóxi;

R_{11} e R_{12} são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio, halogénio ou C_1-C_3 alquilo;

m é 1, 2 ou 3; e

n é 0, 1 ou 2.

68. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I em que:
 R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_2-C_5 haloalquênilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_4$ alquil; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-CO-R_4$; ou $-S-R_7$;
 R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;
 R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_1-C_3 haloalquilo; ou C_1-C_3 haloalcóxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por halogénio, nitro ou ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por halogénio, nitro ou por ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_{13} é hidrogénio ou C_1-C_4 alquilo;

m é 1, 2 ou 3;

n é 0, 1 ou 2; e

p é 0, 1 ou 2.

72. - Processo de acordo com a reivindicação 6, caracterizado por se preparar um composto em que:

R_1 é C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_4 alquênilo;

C_2-C_4 monohaloalquênilo; ou halogênio;

R_2 é C_1-C_5 alquilo ou halogênio;

R_3 é hidrogênio ou C_1-C_3 alquilo;

R_4 é hidrogênio; C_1-C_3 alquilo; ou ciclopropilo;

R_5 é halogênio; C_1-C_2 alquilo; ou C_1-C_3 alcóxi;

R_6 é hidrogênio;

n é 0, 1 ou 2; e

m é 1.

82. - Processo de acordo com a reivindicação 6, caracterizado por se preparar um composto em que:

R_1 é C_1-C_4 alquilo; CF_3 ; C_2-C_4 alcóxialquilo; C_2-C_4 alquênilo; ou halogênio;

R_2 é C_1-C_4 alquilo ou halogênio;

R_3 é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_4 é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

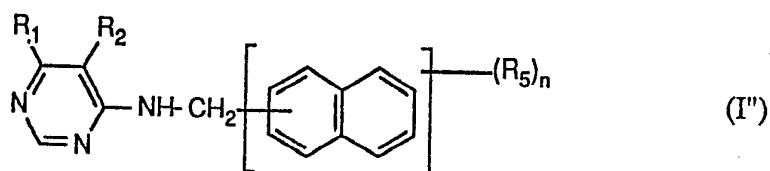
R_5 é halogénio; metilo; etilo; ou metoxi;

R_6 é hidrogénio;

n é 1, 2 ou 3; e

m é 1.

9a. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I''



em que:

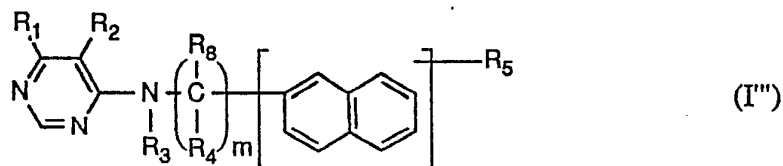
R_1 é C_1-C_4 alquilo, CF_3 , C_2-C_4 alcóxialquilo ou halogénio;

R_2 é C_1-C_4 alquilo ou halogénio;

R_5 é cloro, bromo, metilo, etilo ou metoxi; e

n é 0, 1 ou 2.

10a. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto de fórmula I''



em que:

R_1 é hidrogénio, C_1-C_3 alquilo, CF_3 ou halogénio;

R_2 é hidrogénio, C_1-C_3 alquilo, halogénio, NO_2 ou $S(O)_p-C_1-C_3$ alquilo;

R_3 é hidrogénio;

R_4 é metilo, etilo, isopropilo, n-propilo ou ciclopropilo;

R_8 é hidrogénio, metilo ou etilo;

R_5 é hidrogénio, halogénio, C_1-C_3 alquilo, $OCHF_3$, CF_3 , NO_2 ou C_1-C_3 alcoxi;

m é 1 ou 2; e

p é 0, 1 ou 2.

11a. - Processo de acordo com a reivindicação 3, caracterizado por se preparar um composto em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênilo; C_2-C_5 haloalquênilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcóxialquilo; nitro; ciano;

$S(O)_p-C_1-C_4$ alquil; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; CDR_6 ; ou SR_7 ;

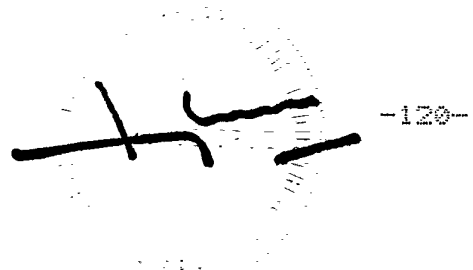
R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_5 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_6 alcóxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcóxi; C_1-C_6 alcóxialquilo;

C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcóxi; C_1-C_3 haloalquiltio; ciano; nitro; ou um grupo X-fenil que ocorre no anel naftilo e que é não substituído ou mono- ou tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcóxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e por ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;



R_7 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

12A. - Processo de acordo com a reivindicação 11, caracterizado por se preparar um composto em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_2-C_5 alcoxialquilo; C_2-C_5 alquenilo; C_3-C_6 cicloalquilo ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_1-C_3 haloalquilo tendo de 1 a 3 átomos de halogénio; C_3-C_5 alcoxialquilo; nitro; ciano;

$S(O)_p-C_1-C_3$ alquil; amino; NHR_3 ; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_2-C_6 alcoxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_2-C_6 alcóxialquilo; C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxi; C_1-C_3 haloalquiltio; ciano ou nitro; R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_5 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 2 ou 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

13a. - Processo de acordo com a reivindicação 11, caracterizado por se preparar um composto em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; CF_3 ; C_2-C_5 alcóxialquilo; C_2-C_5 alquênio; C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_3-C_5 alcoxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_4$ alquil; amino; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_2-C_6 alcoxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo; R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxí; C_2-C_6 alcoxialquilo; haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxí; C_1-C_3 haloalquiltio; nitro; ou ciano;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_3 alquilo;

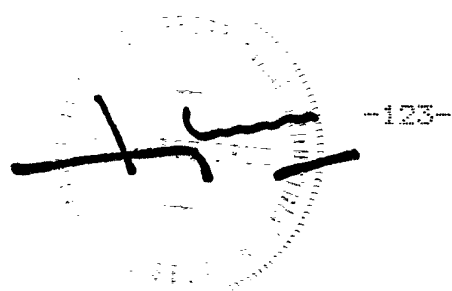
R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

X é oxigénio ou enxofre;

m é 2;

n é 0, 1, 2 ou 3; e



p é 0, 1 ou 2.

143. - Processo de acordo com a reivindicação 13, caracterizado por se preparar um composto em que:

R_1 é hidrogénio; C_1-C_3 alquilo; CF_3 ; C_2-C_5 alcoxialquilo; C_2-C_5 alquenilo; C_3-C_6 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; CF_3 ; C_3-C_5 alcoxialquilo; nitro; ciano; $S(O)_p-C_1-C_4$ alquil; amino; $N(R_3)R_9$; $N=C(R_9)R_{10}$; ou halogénio;

R_3 é hidrogénio;

R_4 e R_8 são cada um deles independentemente um do outro hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; C_2-C_6 alcoxialquilo; ou C_3-C_6 cicloalquilo; R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_2-C_6 alcoxialquilo; C_1-C_3 haloalquilo; C_1-C_3 alquiltio; C_1-C_3 haloalcoxi; C_1-C_3 haloalquiltio; nitro; ou ciano;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; fenilo; ou fenilo substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo; fenilo mono- ou di-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; benzilo; benzilo mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; C_1-C_5 alquilo; ou C_1-C_5 alquilo substituído por halogénio ou por ciano;

R_9 é C_1-C_5 alquilo;

R_{10} é hidrogénio ou C_1-C_3 alquilo;

R_{13} é hidrogénio;

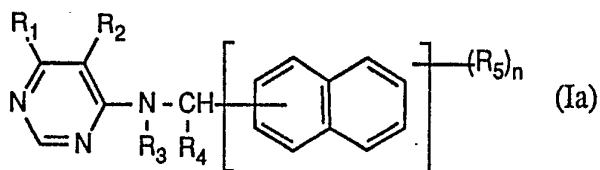
X é oxigénio ou enxofre;

m é 3;

n é 0, 1, 2 ou 3; e

p é 0, 1 ou 2.

15a. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula Ia



em que:

R_1 é C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; C_2-C_7 alquenilo que é não substituído ou substituído por halogénio; C_3-C_7 cicloalquilo; ou halogénio;

R_2 é C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; halogénio; nitro ou ciano;

R_3 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo; benzilo; $-\text{CO}-R_6$ ou $-\text{S}-R_7$;

R_4 é hidrogénio; C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por C_1-C_3 alcoxi; ou C_3-C_7 cicloalquilo;

R_5 é halogénio; C_1-C_3 alquilo; C_1-C_3 alcoxi; C_1-C_3 alquiltio; ou um grupo -X-fenil que ocorre uma vez no anel fenilo e que é não substituído ou mono- a tri-substituído por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, C_1-C_3 alquilo e C_1-C_3 alcoxi;

R_6 é C_1-C_5 alquilo; ou fenilo que é não substituído ou substituído por halogénio e/ou por C_1-C_3 alquilo;

R_7 é fenilo ou benzilo cada um dos quais é não substituído ou mono- ou di-substituído no anel por substituintes idênticos ou diferentes seleccionados de entre halogénio, nitro e ciano; ou

C_1-C_5 alquilo que é não substituído ou substituído por halogénio ou por ciano;

X é oxigénio ou enxofre; e

n é 0, 1, 2 ou 3.

162. - Processo de acordo com a reivindicação 1, caracterizado por se preparar um composto da fórmula I seleccionado a partir do grupo:

(d,l)-4-[1'-(β -naftil)-etilaminol-5-cloro-6-etilpirimidina (comp. 1.2);

(-)-4-[1'-(β -naftil)-etilaminol-5-cloro-6-etilpirimidina (comp. 1.73);

(d,l)-4-[1'-(β-naftil)-propilamino]-5-cloro-6-etilpirimidina
(comp. 1.3);

(d,l)-4-[1'-(β-naftil)-etilamino]-5-cloro-6-metilpirimidina
(comp. 1.53);

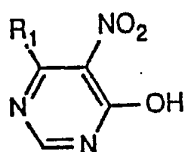
(d,l)-4-[1'-(2-(6-bromonaftil)-etilamino)-5-cloro-6-etilpirimidi-
na (comp. 1.149);

(d,l)-4-[1'-(β-naftil)-etilamino]-5-bromo-6-etilpirimidina (comp.
1.84);

(d,l)-4-[1'-(β-naftil)-etilamino]-5-cloro-6-n-propilpirimidina
(comp. 1.86);

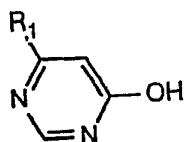
(d,l)-4-[1'-(β-naftil)-etilamino]-5-iodo-6-etilpirimidina (comp.
1.100).

172. - Processo para a preparação de um composto da
fórmula I^b



(I^b),

em que R₁ é tal como foi definido na fórmula I, caracterizado por
compreender a reacção de um composto da fórmula I^a



(I^a)

com ácido azótico contendo de 5 a 70%, de preferência de 10 a 40%, de SO_3 , a temperaturas variando de 10° a 70°C , de preferência de 20° a 40°C .

182. - Processo para a preparação de uma composição para a protecção de plantas contra ataques de pragas, caracterizado por compreender a mistura homogênea de pelo menos um composto de acordo com a reivindicação 1 com veículos sólidos ou líquidos apropriados e adjuvantes.

192. - Processo de acordo com a reivindicação 18, caracterizado por se incluir na referida composição pelo menos um veículo.

202. - Processo de acordo com a reivindicação 18, caracterizado por se incluir na referida composição, como ingrediente activo, pelo menos um composto de acordo com as reivindicações 2 a 15.

212. - Processo de acordo com a reivindicação 18, caracterizado por se incluir na referida composição, como ingrediente activo, um composto da fórmula I de acordo com a reivindicação 16.

222. - Método de protecção de plantas contra o ataque por insectos prejudiciais, caracterizado por compreender a aplicação de um composto de acordo com a reivindicação 1 como

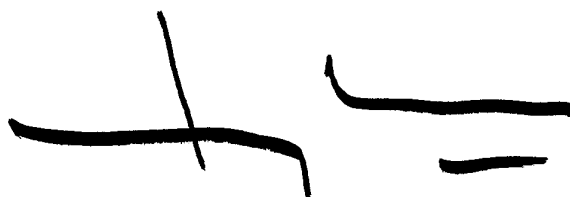
ingrediente activo a plantas ou ao seu local; sendo a taxa de aplicação de ingrediente activo de 5 g a 2 kg por hectare, de preferência de 10 g a 1 kg por hectare.

232. - Método de protecção de plantas contra o ataque por microorganismos fitopatogénicos, caracterizado por compreender a aplicação de um composto de acordo com a reivindicação 1 como ingrediente activo a plantas ou ao seu local; sendo a taxa de aplicação de ingrediente activo de 5 g a 2 kg por hectare, de preferência de 10 g a 1 kg por hectare.

242. - Método de protecção de plantas contra o ataque por insectos prejudiciais, em especial insectos da ordem Acarina, caracterizado por compreender a aplicação de um composto de acordo com qualquer uma das reivindicações 2 a 16 como ingrediente activo às plantas ou ao seu local; sendo a taxa de aplicação de ingrediente activo de 5 g a 2 kg por hectare, de preferência de 10 g a 1 kg por hectare.

252. - Método de protecção de plantas contra o ataque por microorganismos fitopatogénicos, em especial organismos fungos, caracterizado por compreender a aplicação de um composto de acordo com qualquer uma das reivindicações 2 a 16 como ingrediente activo às plantas ou ao seu local; sendo a taxa de aplicação de ingrediente activo de 5 g a 2 kg por hectare, de preferência de 10 g a 1 kg por hectare.

Lisboa, 9 de Agosto de 1991



J. PEREIRA DA CRUZ
Agente Oficial da Propriedade Industrial
RUA VICTOR CORDON, 10 - A 3.º
1200 LISBOA