



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

(11) PI 0117376-6 B1

(22) Data do Depósito: 21/03/2001

(45) Data de Concessão: 27/06/2017



(54) Título: CETOENÓIS CÍCLICOS SUBSTITUÍDOS COM C2-FENILA, SEUS INTERMERDIÁRIOS, SEU USO E SEU MÉTODO DE PRODUÇÃO, PESTICIDAS E HERBICIDAS E SEU MÉTODO DE PRODUÇÃO, BEM COMO MÉTODO PARA COMBATE DE PRAGAS ANIMAIS E CRESCIMENTO DE PLANTAS INDESEJÁVEIS

(51) Int.Cl.: C07D 207/38; C07D 209/54; C07D 491/10; A01N 43/36; A01N 43/38; A01N 43/90; C07C 233/51; C07D 309/14; C07C 233/52; A01N 43/12; C07D 307/94; C07C 69/757; C07D 309/38; A01N 43/16; C07C 49/733; A01N 35/06

(30) Prioridade Unionista: 03/04/2000 DE 100 16 544.3

(73) Titular(es): BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH

(72) Inventor(es): THOMAS BRETSCHNEIDER; CHRISTOPH ERDELEN; MARK WILHELM DREWES; DIETER FEUCHT; MICHAEL RUTHER; HERMANN HAGEMANN; UDO SCHNEIDER; MARKUS DOLLINGER; PETER DAHMEN; ULRIKE WACHENDORFF-NEUMANN; REINER FISCHER; ALAN GRAFF; FOLKER LIEB

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"CETOENÓIS CÍCLICOS SUBSTITUÍDOS COM C₂-FENILA, SEUS INTERMERDIÁRIOS, SEU USO E SEU MÉTODO DE PRODUÇÃO, PESTICIDAS E HERBICIDAS E SEU MÉTODO DE PRODUÇÃO, BEM COMO MÉTODO PARA COMBATE DE PRAGAS ANIMAIS E CRESCIMENTO DE PLANTAS INDESEJÁVEIS"**.

Dividido do PI0109750-4, depositado em 21.03.2001.

A presente invenção se refere a novos cetoenóis cíclicos, substituídos com C₂-fenila, a vários processos para produção dos mesmos e ao seu uso como pesticidas e como herbicidas.

De 3-acil-pirrolidina-2,4-dionas já foram descritas propriedades farmacêuticas (S. Suzuki et al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Além disso, foram sintetizadas N-fenilpirrolidina-2,4-dionas por R. Schmierer e H. Moldenberger (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). Uma eficácia biológica desses compostos não foi descrita.

Nos documentos EP-A-0 262 399 e GB-A-2 266 888 são descritos compostos de estrutura semelhante (3-aril-pirrolidina-2,4-dionas), dos quais, porém, não se tornou conhecido nenhum efeito herbicida, inseticida ou acaricida. São conhecidos com efeito herbicida, inseticida ou acaricida derivados de 3-aril-pirrolidina-2,4-diona bicíclicos, não-substituídos (EP-A-355 599 e EP-A-415 211), bem como derivados de 3-aril-pirrolidina-2,4-diona monocíclicos, substituídos (EP-A-377 893 e EP-A-442 077).

Além disso, são conhecidos derivados de 3-arilpirrolidina-2,4-diona policíclicos (EP-A-442 073), bem como derivados de 1H-arilpirrolidina-2,4-diona (EP-A-456 063, EP-A-521 334, EP-A-596 298, EP-A-613 884, EP-A-613 885, WO 94/01 997, WO 95/26 954, WO 95/20 572, EP-A-0 668 267, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 97/43 275, WO 98/05 638, WO 98/06 721, WO 98/25 928, WO 99/16 748, WO 99/24 437, WO 99/43 649, WO 99/48 869 e WO 99/55 673).

É conhecido que determinados derivados de Δ^3 -dihidrofuran-2-ona substituídos possuem propriedades herbicidas (comp. DE-A-4 014 420).

A síntese dos derivados de ácido tetrônico, usados como materiais básicos (tal como, por exemplo, 3-(2-metil-fenil)-4-hidróxi-5-(4-fluorfenil)- Δ^3 -dihidrofuranona-(2)) está igualmente descrita no documento DE-A-4 014 420. Compostos estruturados de modo semelhante, sem indicação de uma

5 eficácia inseticida e/ou acaricida, são conhecidos da publicação de Campbell et al., J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 1985 (8) 1567-76. Além disso são conhecidos derivados de 3-*aril*- Δ^3 -dihidrofuranona, com propriedades herbicidas, acaricidas e inseticidas, dos documentos EP-A-528 156, EP-A-0 647 637, WO 95/26 345, WO 96/20 196, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO

10 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05 638, WO 98/25 928, WO 99/16 748, WO 99/43 649, WO 99/48 869 e WO 99/55 673. Também são conhecidos derivados de 3-*aril*- Δ^3 -dihidrotifen-ona (WO 95/26 345, 96/25 395, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05 638, WO 98/25 928, WO 99/16 748, WO 99/43 649, WO 99/48 869, WO 99/55 673).

15 Determinados derivados de fenil-pirona, não-substituídos no anel fenila, já se tornaram conhecidos (comp. A.M. Chirazi, T. Kappe e E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 (1976) e K.-H. Boltze e K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849), sendo que para esses compostos não é indicada uma utilização possível como pesticidas. Derivados de fenil-pirona, substituídos no anel

20 fenila, com propriedades herbicidas, acaricidas e inseticidas estão descrito nos documentos EP-A-558 137, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/16 436, WO 97/19 941, WO 97/36 868, WO 98/05 638, WO 99/43 649, WO 99/48 869 e WO 99/55 673.

Determinados derivados de 5-fenil-1,3-tiazina, não-substituídas

25 no anel fenila, já se tornaram conhecidos (comp. E. Ziegler e E. Steiner, Monatsh. 95, 147 (1964), R. Ketcham, T. Kappe e E. Ziegler, J. Heterocycl. Chem. 10, 223 (1973)), sendo que para esses compostos não é indicada uma possível aplicação como pesticida. Derivados de 5-fenil-1,3-tiazina, substituídos no anel fenila, com efeito herbicida, acaricida e inseticida, são

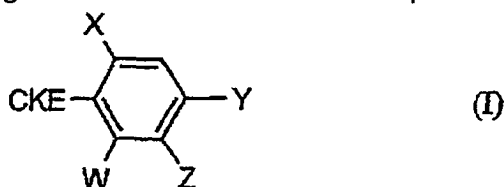
30 descritos nos documentos WO 94/14 785, WO 96/02 539, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 99/05 638, WO 99/43 649, WO 99/48 869 e WO 99/55 673.

É conhecido que determinadas 2-arilciclopentandionas substituídas possuem propriedades herbicidas e acaricidas (compare, por exemplo, US-4 283 348; 4 338 122; 4 436 666; 4 526 723; 4 551 547; 4 632 698; WO 96/01 798; WO 96/03 366, WO 97/14 667, bem como WO 98/39 281, WO 99/43 649, WO 99/48 869, WO 99/55 673). Além disso, são conhecidos compostos substituídos de modo semelhante: 3-hidróxi-5,5-dimetil-2-fenilciclopent-2-en-1-ona, da publicação de Micklefield et al., Tetrahedron (1992), 7519-26, bem como a substância natural Involutin (-)-cis-5-(3,4-dihidroxifenil)-3,4-dihidróxi-2-(4-hidroxifenil)-ciclopent-2-en-ona, da publicação de Edwards et al., J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9. Um efeito inseticida ou acaricida não é descrito. Além disso, 2-(2,4,6-trimetifenil)-1,3-indandiona é conhecida da publicação J. Economic Entomology 66 (1973) e do documento de patente DE-A 2 361 084, com indicação de efeitos herbicidas e acaricidas.

É conhecido que determinadas 2-arilciclohexandionas substituídas possuem propriedades herbicidas e acaricidas (US-4 175 135, 4 209 432, 4 256 657, 4 256 658, 4 256 659, 4 257 858, 4 283 348, 4 303 669, 4 351 666, 4 409 153, 4 436 666, 4 526 723, 4 613 617, 4 659 372, DE-A 2 813 341, bem como Wheeler, T.N., J. Org. Chem. 44, 4906 (1979), WO 99/43 649, WO 99/48 869, WO 99/55 673).

A eficácia e a amplitude de ação desses compostos, no entanto, nem sempre são plenamente satisfatórias, particularmente a quantidades de aplicação e concentrações pequenas. Além disso, a compatibilidade com as plantas desses compostos nem sempre é suficiente.

Foram agora descobertos novos compostos da fórmula (I)



na qual

W representa hidrogênio, alquila, alquenila ou alquinila,

X representa alquila, alquenila ou alquinila,

Y representa hidrogênio, metila, etila, i-propila, alquenila ou al-

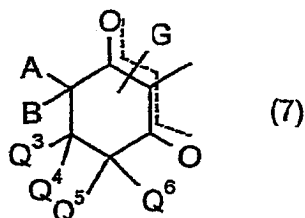
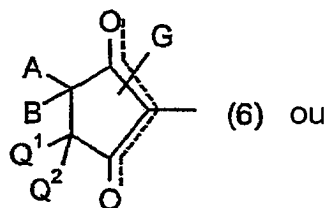
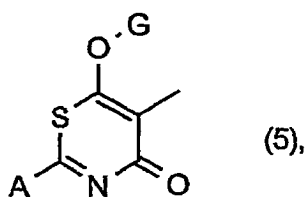
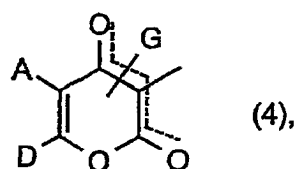
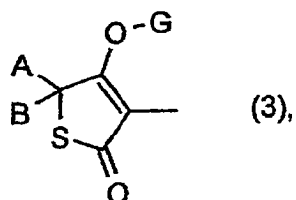
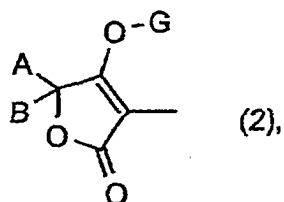
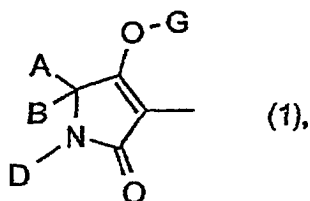
quinila,

Z representa hidrogênio, alquila, alquenila ou alquinila,

com a condição de que pelo menos um dos radicais W, X, Y ou

Z represente uma cadeia com pelo menos dois átomos de carbono,

5 CKE representa um dos grupos



em que

A representa hidrogênio, representa alquila, alquenila, alcoxial-
 quila, alquiltioalquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halo-
 10 gênio, cicloalquila, saturada ou insaturada, opcionalmente substituída, na
 qual, opcionalmente, pelo menos um átomo anelar está substituído com um
 heteroátomo, ou representa arila, arilalquila ou hetarila, respectivamente,
 opcionalmente substituída com halogênio, alquila, halogenoalquila, alcóxi,
 halogenoalcóxi, ciano ou nitro,

15 B representa hidrogênio, alquila ou alcoxialquila, ou

A e B, juntamente com o átomo de carbono ao qual estão liga-

dos, representam um ciclo saturado ou insaturado, substituído ou não-substituído, que opcionalmente contém um heteroátomo,

D representa hidrogênio ou representa um radical da série alquila, alquenila, alquinila, alcoxialquila, opcionalmente substituída, ou cicloalquila não-saturada, na qual, opcionalmente, um ou mais elementos anelares estão substituídos com heteroátomos, representa arilalquila, arila, hetarilalquila ou hetarila ou

A e D, juntamente com os átomos aos quais estão ligados, representam um ciclo saturado ou insaturado e que contém, opcionalmente, pelo menos um heteroátomo, não-substituído ou substituído na parte A,D, ou

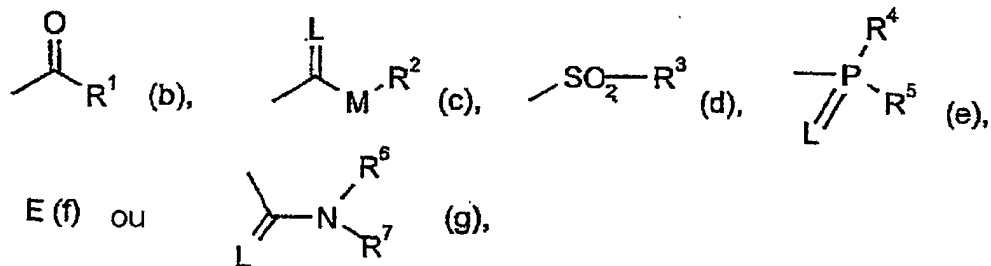
A e Q¹, em conjunto, representam alcanodiila ou alquenodiila, opcionalmente substituída com hidróxi, respectivamente, por alquila, alcóxi alquiltio, cicloalquila, benzilóxi ou arila, opcionalmente substituída ou

Q¹ representa hidrogênio ou alquila,
Q², Q⁴, Q⁵ e Q⁶, independentemente um do outro, representam hidrogênio ou alquila,

Q³ representa hidrogênio, alquila, alcoxialquila, alquiltioalquila, cicloalquila, opcionalmente substituída (no qual, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com oxigênio ou enxofre) ou fenila, opcionalmente substituída, ou

Q³ e Q⁴, juntamente com o átomo de carbono, ao qual estão ligados, representam um ciclo saturado ou insaturado, que opcionalmente contém um heteroátomo, não-substituído ou substituído,

G representa hidrogênio (a) ou representa um dos grupos



25

onde

E representa um equivalente de íon metálico ou um íon de amônio,

L representa oxigênio ou enxofre,

M representa oxigênio ou enxofre,

R^1 representa alquila, alquenila, alcoxialquila, alquiltioalquila, polialcoxialquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, ou representa cicloalquila, que pode estar interrompida por pelo menos um heteroátomo, opcionalmente substituída com halogênio, alquila ou alcóxi, representa fenila, fenilalquila, hetarila, fenoxialquila ou hetarilóxi-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída,

R^2 representa alquila, alquenila, alcoxialquila, polialcoxialquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, ou representa cicloalquila, fenila ou benzila, respectivamente, opcionalmente substituída,

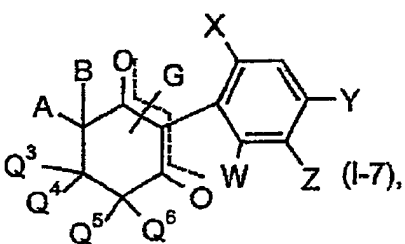
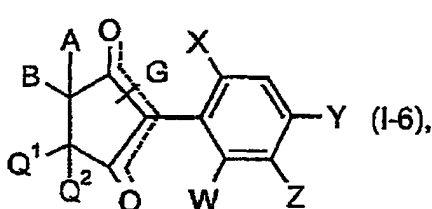
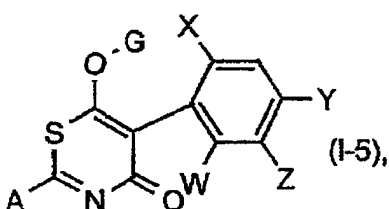
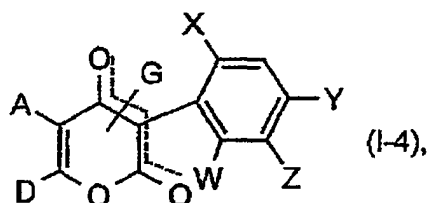
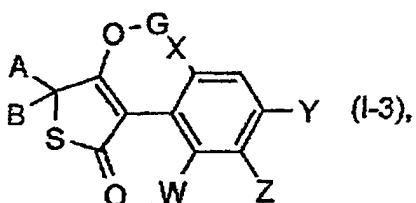
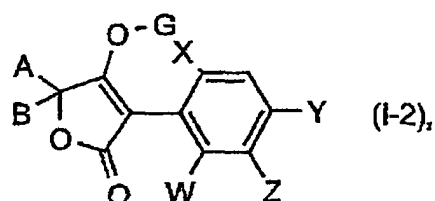
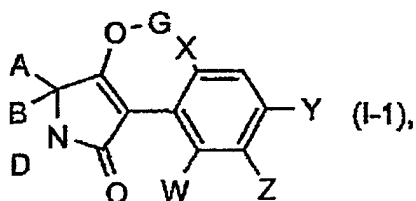
R^3 , R^4 e R^5 , independentemente um do outro, representam alquila, alcóxi, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, alqueniltio, cicloalquiltio, respectivamente, opcionalmente substituído com halogênio e representam fenila, benzila, fenóxi ou feniltio, respectivamente, opcionalmente substituído,

R^6 e R^7 , independentemente um do outro, representam hidrogênio, representam alquila, cicloalquila, alquenila, alcóxi, alcoxialquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, representam fenila, opcionalmente substituída, representam benzila, opcionalmente substituída, ou, juntamente com o átomo de N, ao qual estão ligados, representam um ciclo, opcionalmente interrompido por oxigênio ou enxofre.

Os compostos da fórmula (I), na dependência da espécie dos substituintes, podem apresentar-se como isômeros geométricos e/ou ópticos ou misturas de isômeros, em composição diferente, que, opcionalmente, podem ser separados de maneira usual. Tanto os isômeros puros como também as misturas de isômeros, a preparação e uso dos mesmos, bem como os agentes que contêm os mesmos, são objetos da presente invenção. A seguir, por razões de simplificação, no entanto, fala-se sempre de compostos da fórmula (I), ainda que se queira designar tanto compostos puros como, opcionalmente, também misturas com diferentes frações de compostos isoméricos.

Sob inclusão dos significados (1) a (7) do grupo CKE, resultam

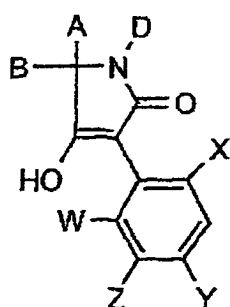
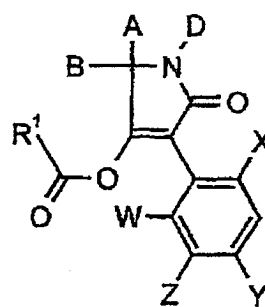
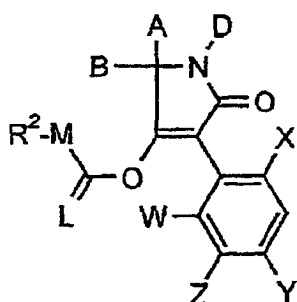
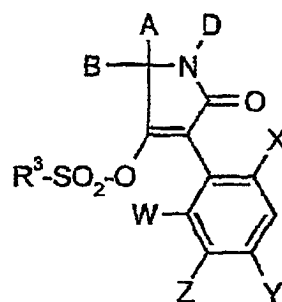
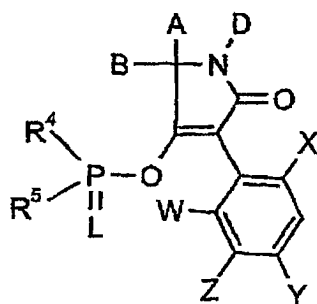
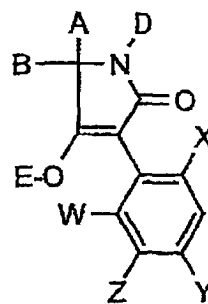
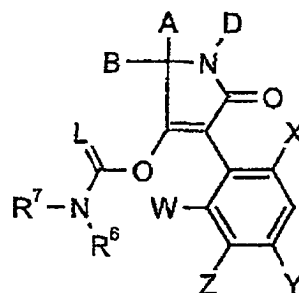
as seguintes estruturas principais (I-1) a (I-7):



em que

5 A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm o significado indicado acima.

Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e (g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-1-a) a (I-1-g), se CKE representar o grupo (1):

(I-1-a):**(I-1-b):****(I-1-c):****(I-1-d):****(I-1-e):****(I-1-f):****(I-1-g):**

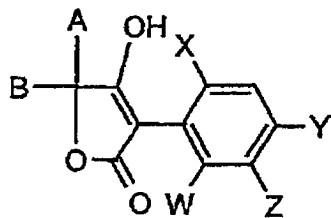
em que

A, B, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ têm os
5 significados indicados acima.

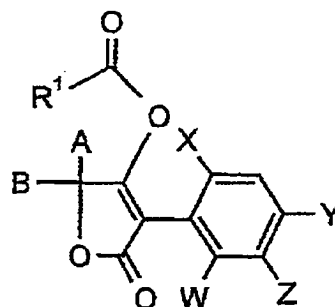
Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e
(g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-2-a) a (I-2-g),

se CKE representar o grupo (2):

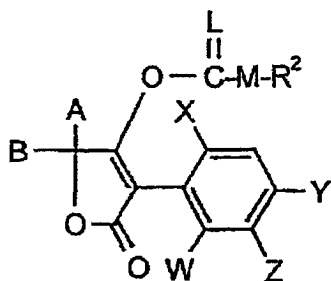
(I-2-a):



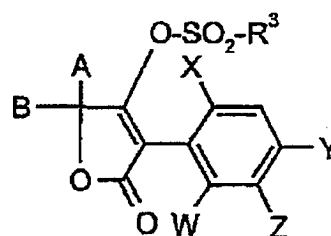
(I-2-b):



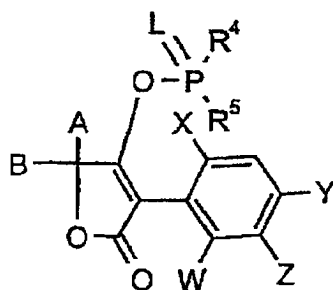
(I-2-c):



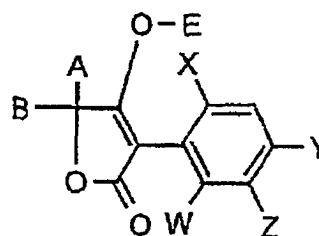
(I-2-d):



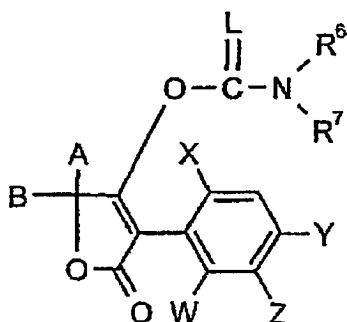
(I-2-e):



(I-2-f):



(I-2-g):



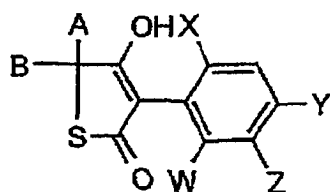
em que

- 5 A, B, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ têm os significados indicados acima.

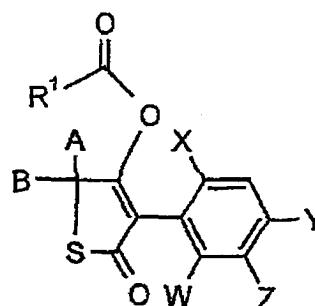
Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e

(g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-3-a) a (I-3-g), se CKE representar o grupo (3):

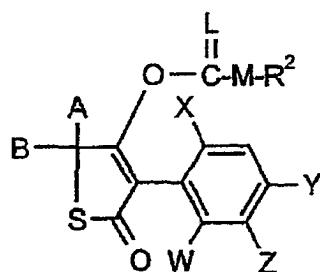
(I-3-a):



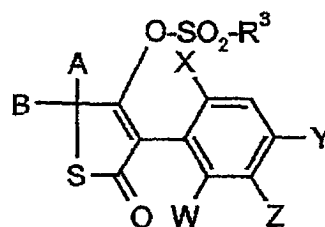
(I-3-b):



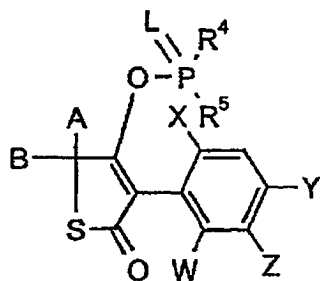
(I-3-c):



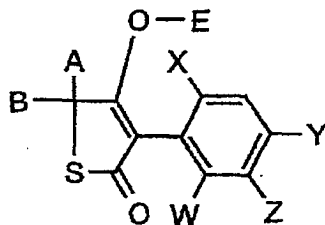
(I-3-d):



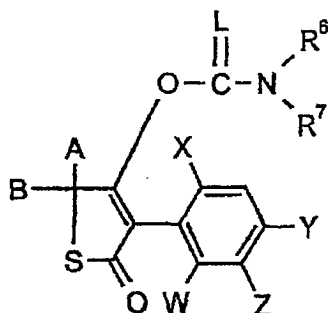
(I-3-e):



(I-3-f):



(I-3-g):

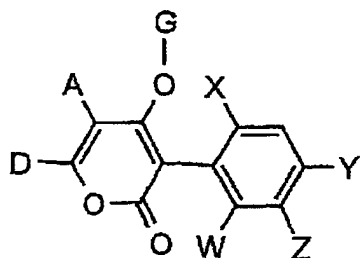


5 em que

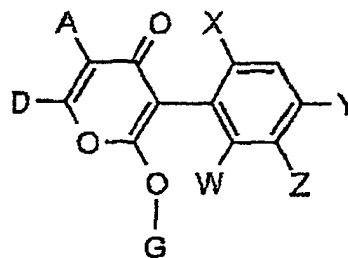
A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ têm os significados indicados acima.

Os compostos da fórmula (I-4), na dependência da posição do

substituinte G, podem estar presentes nas duas formas isoméricas das fórmulas (I-5-A) e (I-5-B)



(I-4-A)



(I-4-B)

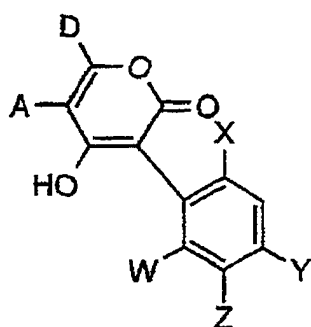
o que deve ser expresso pela linha tracejada na fórmula (I-4).

5 Os compostos das fórmulas (I-4-A) e (I-4-B) podem estar presentes tanto como misturas como também na forma de seus isômeros puros. As misturas dos compostos das fórmulas (I-4-A) e (I-4-B) podem ser opcionalmente separadas por métodos físicos, por exemplo, por métodos cromatográficos.

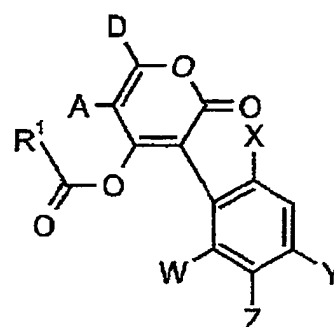
10 Por razões de melhor visibilidade, doravante é citado apenas um dos isômeros possíveis. Isto não exclui o fato de que os compostos podem estar opcionalmente presentes na forma das misturas isoméricas ou na outra forma isomérica correspondente.

15 Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e (g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-4-a) a (I-4-g), se CKE representar o grupo (4),

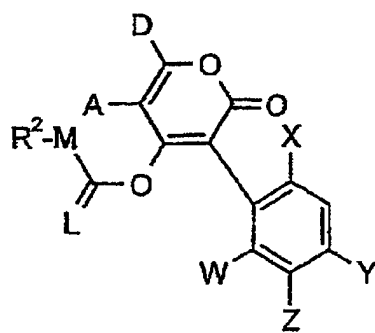
(I-4-a):



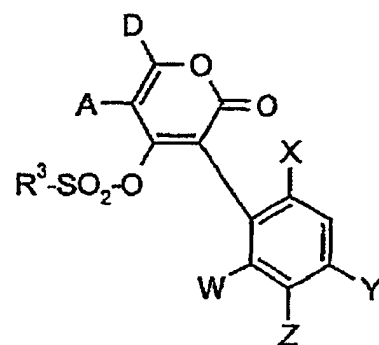
(I-4-b):



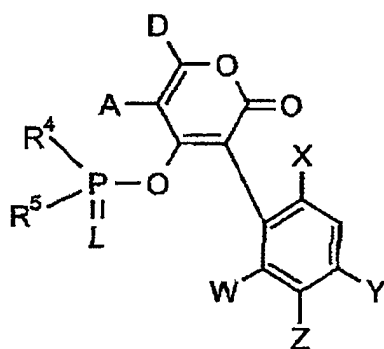
(I-4-c):



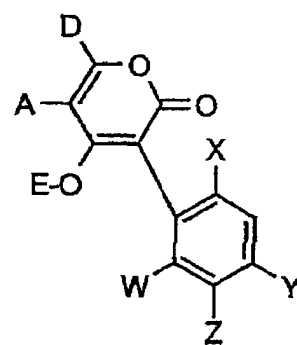
(I-4-d):



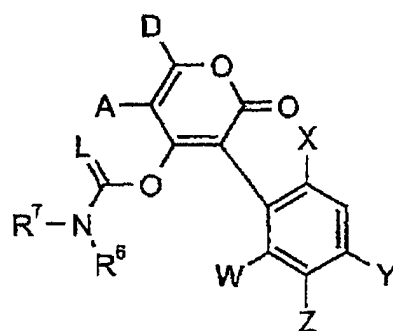
(I-4-e):



(I-4-f):



(I-4-g):



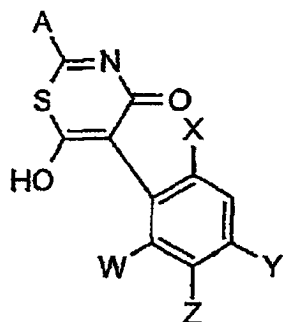
em que

A, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 e R^7 têm os significados indicados acima.

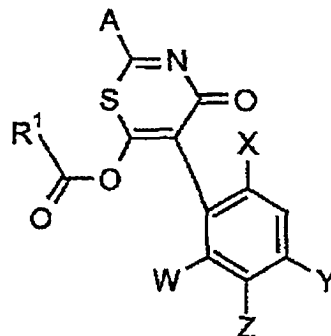
Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e (g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-5-a) a (I-5-g),

5 se CKE representar o grupo (5):

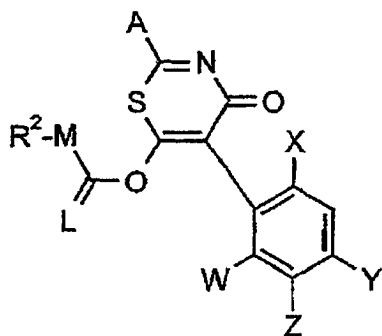
(I-5-a):



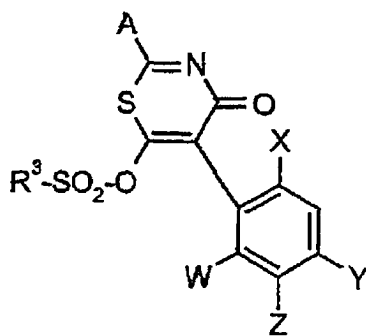
(I-5-b):



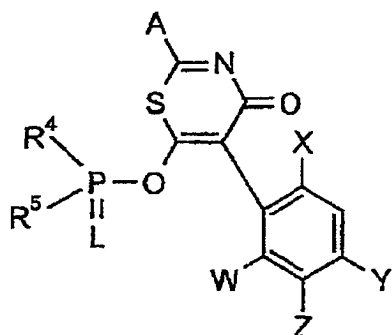
(I-5-c):



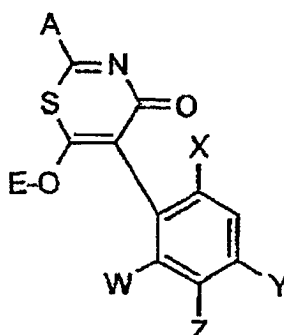
(I-5-d):

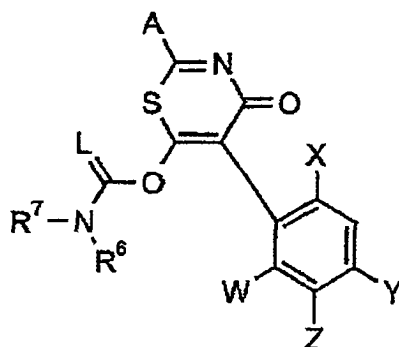


(I-5-e):



(I-5-f):

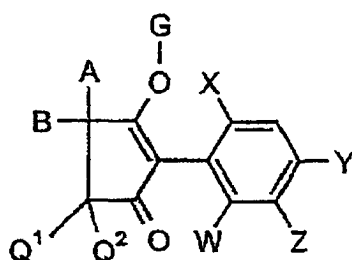
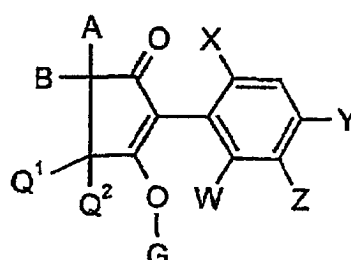


(I-5-g):

em que

A, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ têm os significados indicados acima.

- 5 Os compostos da fórmula (I-6), na dependência da posição do substituinte G, podem estar presentes nas duas formas isoméricas das fórmulas (I-6-A) e (I-6-B).

**(I-6-A)****(I-6-B)**

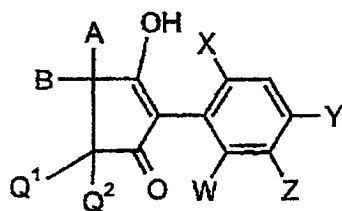
o que deve ser expresso pela linha tracejada na fórmula (I).

- 10 Os compostos das fórmulas (I-6-A) e (I-6-B) podem estar presentes tanto como misturas como também na forma de seus isômeros puros. As misturas dos compostos das fórmulas (I-7-A) e (I-7-B) podem ser opcionalmente separadas por métodos físicos, por exemplo, por métodos cromatográficos.

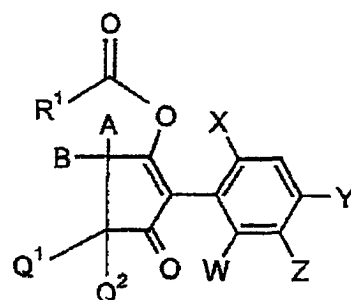
- 15 Por razões de melhor visibilidade, doravante é citado apenas um dos isômeros possíveis. Isto não exclui o fato de que os compostos podem estar opcionalmente presentes na forma das misturas isoméricas ou na outra forma isomérica correspondente.

- 20 Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e (g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-6-a) a (I-6-g):

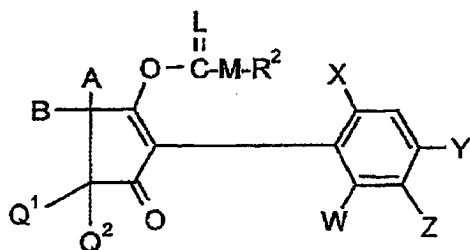
(I-6-a):



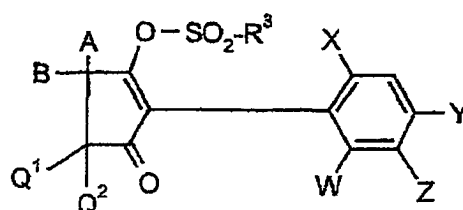
(I-6-b):



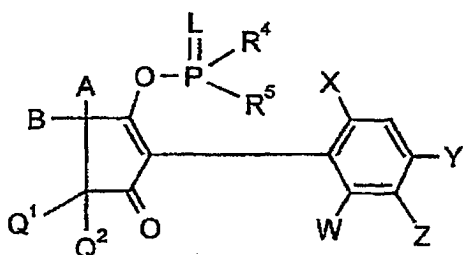
(I-6-c):



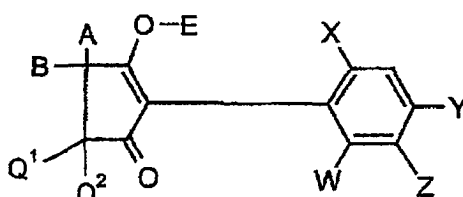
(I-6-d):



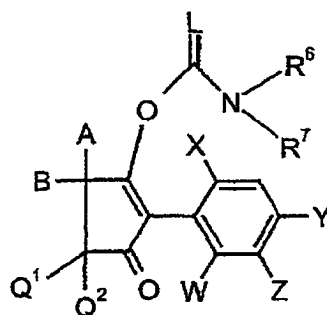
(I-6-e):



(I-6-f):



(I-6-g):

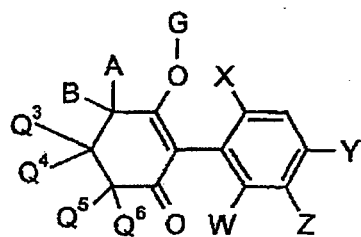


em que

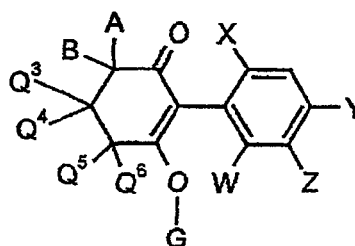
5 A, B, Q¹, Q², E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e R⁷ têm os significados indicados acima.

Os compostos da fórmula (I-7), na dependência da posição do substituinte G, podem estar presentes nas duas formas isoméricas das fórmula (I-7-A) e (I-7-B), o que deve ser expresso pela linha tracejada na fórmu-

la (I-7).



(I-7-A)



(I-7-B)

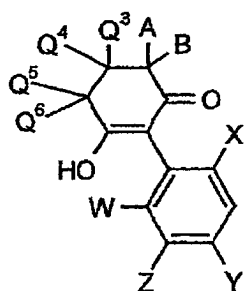
Os compostos das fórmulas (I-7-A) e (I-7-B) podem estar presentes tanto como misturas como também na forma de seus isômeros puros.

- 5 As misturas dos compostos das fórmulas (I-6-A) e (I-6-B) podem ser opcionalmente separadas por métodos físicos, por exemplo, por métodos cromatográficos.

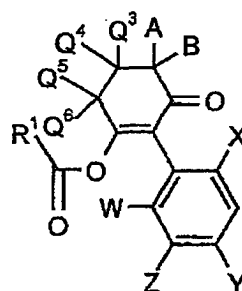
Por razões de melhor visibilidade, doravante é citado apenas um dos isômeros possíveis. Isto inclui o fato de que os compostos podem estar
10 opcionalmente presentes como mistura isomérica ou na outra forma isomérica correspondente.

Sob inclusão dos diversos significados (a), (b), (c), (d), (e), (f) e (g) do grupo G, resultam as seguintes estruturas principais (I-7-a) a (I-7-g):

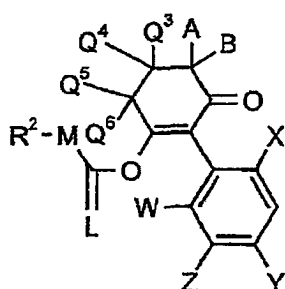
(I-7-a):



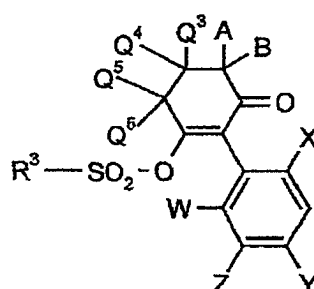
(I-7-b):



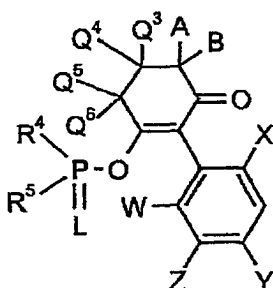
(I-7-c):



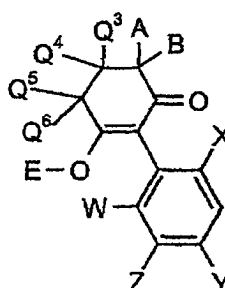
(I-7-d):



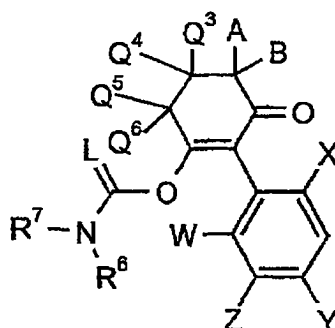
(I-7-e):



(I-7-f):



(I-7-g):



em que

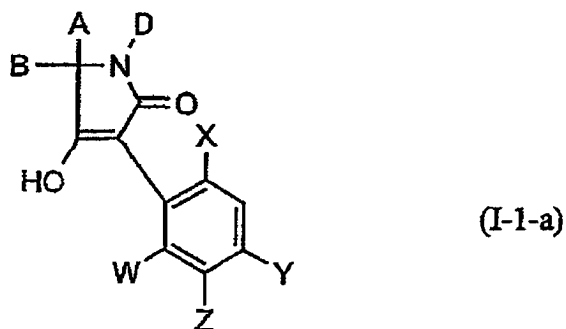
A, B, E, L, M, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ e

5 R⁷ têm os significados indicados acima.

Além disso, foi descoberto que os novos compostos da fórmula

(I) são obtidos de acordo com um dos processos descritos a seguir:

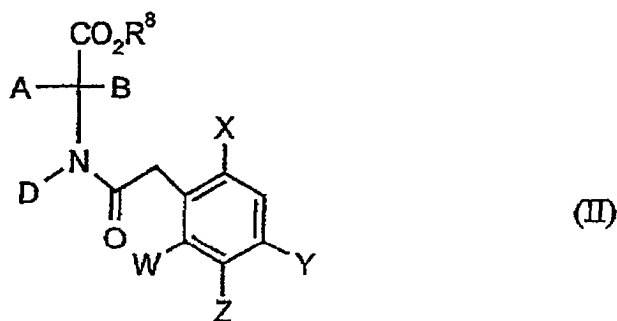
(A) São obtidas 3-fenilpirrolidina-2,4-dionas ou os enóis das mesmas da fórmula (I-1-a)



5 na qual

A, B, D, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se condensa intramolecularmente

ésteres de ácido de N-acilamino da fórmula (II)



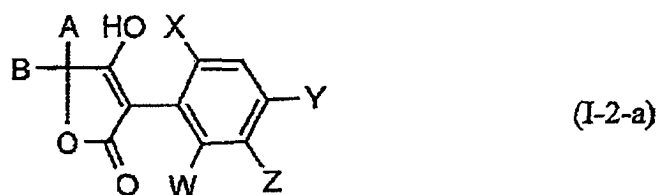
10 na qual

A, B, D, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,

e

R^8 representa alquila (preferivelmente, C_1 - C_6 -alquila), na presença de um diluente e na presença de uma base.

15 (B) Além disso, foi constatado que são obtidos derivados de 3-fenil-4-hidróxi- Δ^3 -dihidrofuranona da fórmula (I-2-a)

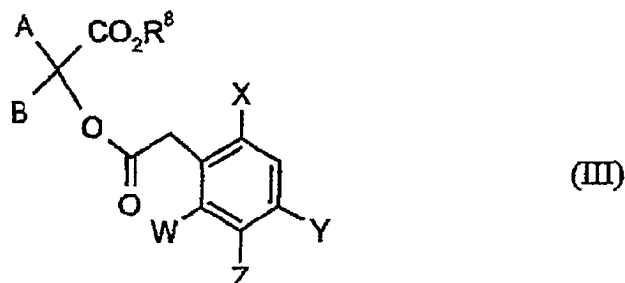


na qual

A, B, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,

quando se condensa intramolecularmente

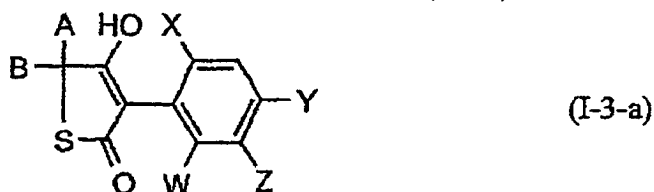
ésteres de ácido carboxílico da fórmula (III)



na qual

- 5 A, B, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,
na presença de um diluente e na presença de uma base.

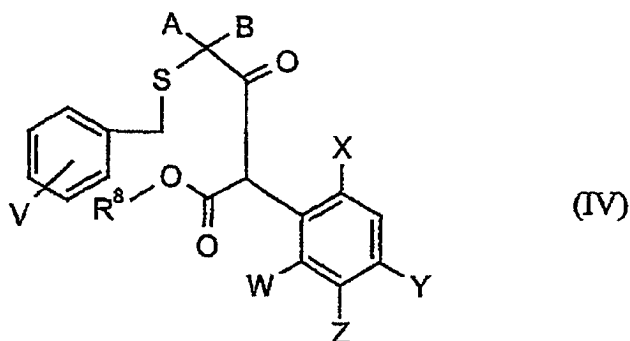
(C) Além disso, foi constatado de são obtidos derivados de 3-fenil-4-hidróxi- Δ^3 -dihidrotiofenona da fórmula (I-3-a)



- 10 na qual

A, B, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se cicliza intramolecularmente

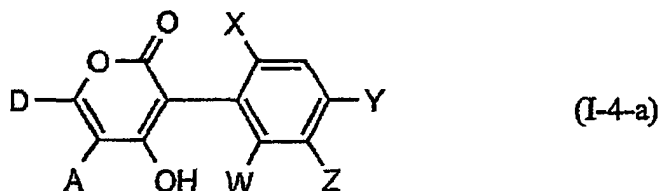
ésteres de ácido β -cetocarboxílico da fórmula (IV)



- 15 na qual

A, B, W, X, Y, Z e R^8 têm os significados indicados acima e
V representa hidrogênio, alquila (preferivelmente, C_1 - C_6 -alquila)
ou alcóxi (preferivelmente, C_1 - C_8 -alcóxi),
opcionalmente, na presença de um diluente e na presença de um ácido.

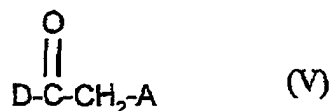
(D) Além disso, foi constatado que são obtidos os novos derivados de 3-fenilpirona da fórmula (1-4-a)



na qual

5 A, D, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se reage

compostos de carbonila da fórmula (V)



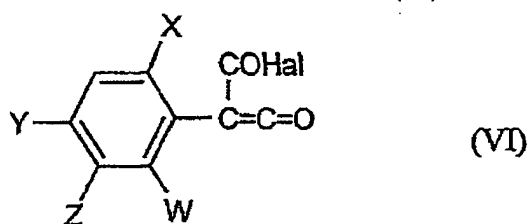
na qual

10 A e D têm os significados indicados acima, ou os éteres de sililenol dos mesmos, da fórmula (Va)



na qual

15 A, D e R⁸ têm o significado indicado acima, com halogenetos de ácido cetênico da fórmula (VI)



na qual

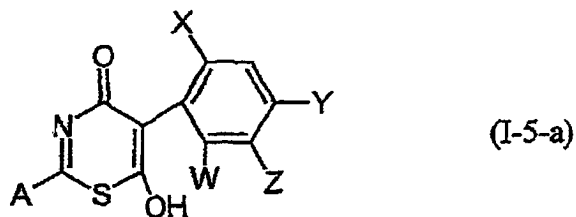
W, X, Y e Z têm o significado indicado acima e

20 Hal representa halogênio (preferivelmente, representa cloro ou bromo),
opcionalmente, na presença de um diluente e opcionalmente, na presença de um aceitante de ácido.

Além disso, foi constatado

(E) que se obtém os novos derivados de fenil-1,3-tiazina da fór-

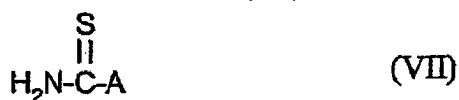
mula (I-5-a)



na qual

A, W, X, Y e Z têm o significado indicado acima,

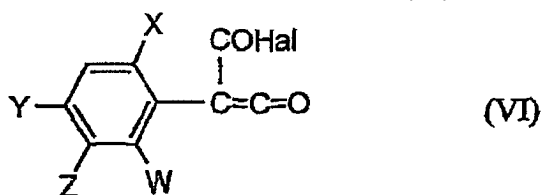
5 quando se reage tioamidas da fórmula (VII)



na qual

A tem o significado indicado acima,

com halogenetos de ácido cetênico da fórmula (VI)



10

na qual

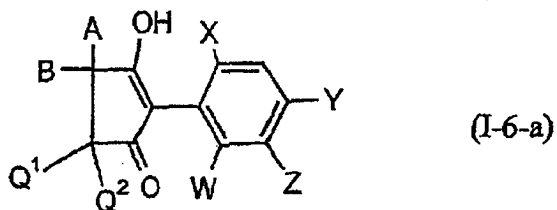
Hal, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,

opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aceitante de ácido.

15

Além disso, foi constatado

(F) que se obtém compostos da fórmula (I-6-a)

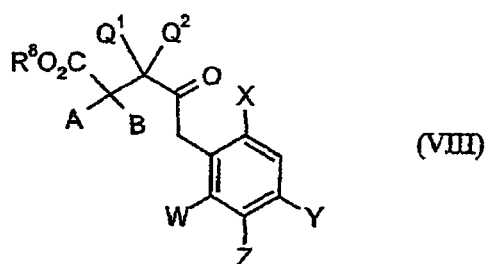


na qual

A, B, Q¹, Q², W, X, Y e Z têm o significado indicado acima,

20 quando se cicliza intramolecularmente

ésteres de ácido cetocarboxílico da fórmula (VIII)



na qual

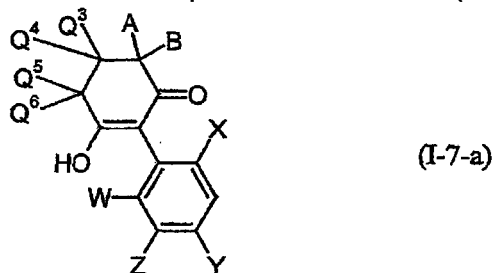
A, B, Q¹, Q², W, X, Y e Z têm o significado indicado acima, e

R⁸ representa alquila (particularmente, C₁-C₈-alquila),

5 opcionalmente, na presença de um diluente e na presença de uma base.

Além disso, foi constatado

(G) que se obtém compostos da fórmula (I-7-a)

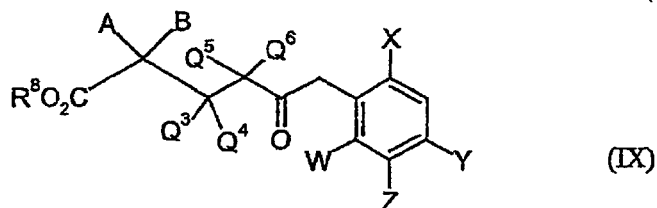


na qual

10 A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm o significado indicado acima,

quando se condensa intramolecularmente

6-aryl-5-ceto-éster de ácido hexânico da fórmula (IX)



15 na qual

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm o significado indicado acima, e

na, e

R⁸ representa alquila (preferivelmente, C₁-C₆-alquila),

na presença de um diluente e na presença de uma base;

20 (H) que se obtém compostos das fórmulas (I-1(a-g)) a (I-7(a-g)) mostradas acima, nas quais A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z

têm o significado indicado acima,

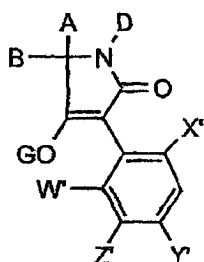
sendo que um, no máximo dois, radicais W, X, Y ou Z represen-

tam $R^{22}-C\equiv C-$ ou $\begin{array}{c} R^{22} \\ | \\ HC=CH \end{array}$ R^{22} representa hidrogênio ou C_1-C_4 -alquila, preferivelmente, hidrogênio ou C_1-C_2 -alquila e, de modo particularmente preferido,

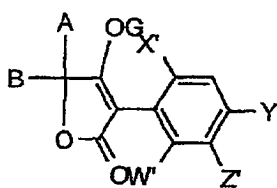
5 hidrogênio,

quando se reagem compostos da fórmula (I-1'(a-g)) a (I-7'(a-g)),

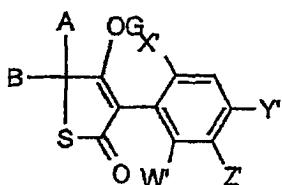
(I-1'):



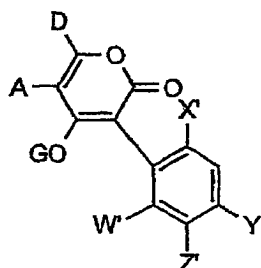
(I-2'):



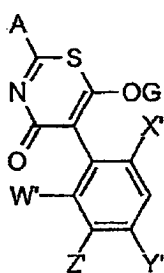
(I-3'):



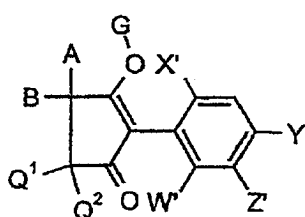
(I-4'):



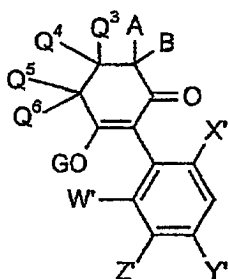
(I-5'):



(I-6'):



(I-7'):



nas quais

A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W', X', Y' e Z' têm o significado indicado acima, e sendo que o sinal ' significa que, nesse processo, um, no máximo dois, radicais W, X, Y e Z representam cloro, bromo, iodo, preferivelmente, representam bromo, com a condição de que os outros radicais W, X, Y ou Z não representem alquenila ou alquinila, com sililacetilenos da fórmula (X-a) ou vinilestananos da fórmula (X-b)



nas quais Alk representa, preferivelmente, C₁-C₄-alquila e

R²¹ representa, preferivelmente, C₁-C₄-alquila ou fenila,

R²² representa, preferivelmente, hidrogênio ou C₁-C₄-alquila, de modo particularmente preferido, representa hidrogênio ou C₁-C₂-alquila e, de modo especialmente preferido, representa hidrogênio, na presença de um solvente, opcionalmente, na presença de um catalisador, sendo que como catalisador são de interesse, particularmente, complexos de paládio.

Além disso, foi constatado

(I) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-b) a (I-7-b) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R₁, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, respectivamente,

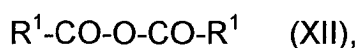
(α) com halogenetos de ácido da fórmula (XI)



na qual

R¹ tem o significado indicado acima e Hal representa halogênio (particularmente, representa cloro ou bromo) ou

(β) com anidridos de ácido carboxílico da fórmula (XII)



na qual

R^1 tem o significado indicado acima,
opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença
de um aglutinante de ácido;

- 5 (J) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-c) a (I-7-c)
mostradas acima, nas quais A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M, W, X, Y e
Z têm os significados indicados acima e L representa oxigênio, quando se
reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais
A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y e Z têm os significados indicados
10 acima, respectivamente,

com ésteres de ácido cloro-fórmico ou tioésteres de ácido cloro-
fórmico da fórmula (XIII)



na qual

- 15 R^2 e M têm os significados indicados acima,
opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença
de um aglutinante de ácido;

- (K) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-c) a (I-7-c)
mostradas acima, nas quais A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M, W, X, Y e
20 Z têm os significados indicados acima e L representa enxofre, quando se
reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais
A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y e Z têm os significados indicados
acima, respectivamente,

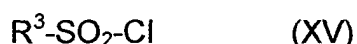
- com ésteres de ácido cloromonotio-fórmico ou ésteres de ácido
25 cloroditio-fórmico da fórmula (XIV)



na qual

- M e R^2 têm os significados indicados acima,
opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença
30 de um aglutinante de ácido
e

(L) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-d) a (I-7-d) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R³, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, respectivamente,
 5 com cloretos de ácido sulfônico da fórmula (XV)



na qual

R³ tem o significado indicado acima,
 10 opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, a presença de um aglutinante de ácido;

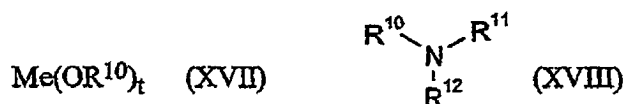
(M) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-e) a (I-7-e) mostradas acima, nas quais A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁴, R⁵, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, respectivamente,
 15 te,
 com compostos de fósforo da fórmula (XVI)



20 na qual

L, R⁴ e R⁵ têm os significados indicados acima e
 Hal representa halogênio (particularmente, cloro ou bromo),
 opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido;

(N) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-f) a (I-7-f) mostradas acima, nas quais A, B, D, E, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, respectivamente,
 25 com compostos metálicos ou aminas das fórmulas (XVII) ou XVIII)
 30



nas quais

Me representa um metal monovalente ou divalente (preferivelmente, um metal alcalino ou alcalino-terroso, tal como lítio, sódio, potássio, magnésio ou cálcio),

t representa o número 1 ou 2 e

R^{10} , R^{11} , R^{12} , independentemente um do outro, representam hidrogênio ou alquila (preferivelmente, C_1 - C_8 -alquila), opcionalmente, na presença de um diluente;

(O) que se obtém os compostos das fórmulas (I-1-g) a (I-7-g) mostradas acima, nas quais A, B, D, L, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^6 , R^7 , W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, quando se reagem compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) mostradas acima, nas quais A, B, D, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y e Z têm os significados indicados acima, respectivamente,

(α) com isocianatos ou isotiocianatos da fórmula (XIX)



na qual

R^6 e L têm os significados indicados acima,

opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um catalisador, ou

(β) com cloretos de ácido carbamídico ou cloretos de ácido tio-carbamídico da fórmula (XX)



na qual

L, R^6 e R^7 têm os significados indicados acima,

opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

Além disso, foi constatado que os novos compostos da fórmula

(I) apresentam uma eficácia muito boa como pesticidas, preferivelmente,

como inseticidas, acaricidas e herbicidas.

Os compostos de acordo com a invenção estão definidos, em geral, pela fórmula (I). Substituintes e faixas dos radicais citados nas fórmulas mencionadas acima e abaixo são explicados a seguir:

5 W representa, preferivelmente, hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila ou etinila.

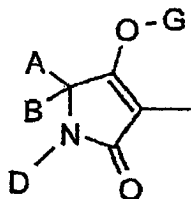
X representa, preferivelmente, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila ou etinila,

Y representa, preferivelmente, hidrogênio, metila, etila, i-propila,
10 C₂-C₆-alquenila ou etinila.

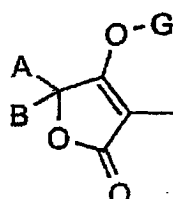
Z representa, preferivelmente, hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila ou etinila,

com a condição de que pelo menos um dos radicais W, X, Y ou Z representa uma cadeia com pelo menos dois átomos de carbono.

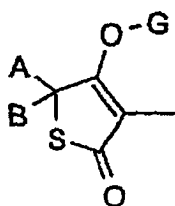
15 CKE representa, preferivelmente, um dos grupos



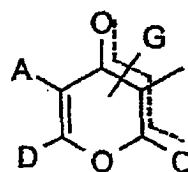
(1),



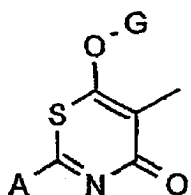
(2),



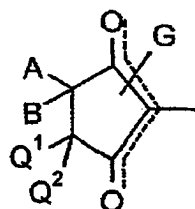
(3),



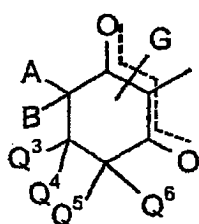
(4),



(5),



(6),



(7).

A representa, preferivelmente, hidrogênio ou C₁-C₁₂-alquila, C₃-C₈-alquenila, C₁-C₁₀-alcóxi-C₁-C₈-alquila, C₁-C₁₀-alquiltio-C₁-C₆-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, representa C₃-C₈-cicloalquila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-alcóxi, no qual, opcionalmente, um ou dois elementos anelares, não diretamente adjacentes, estão substituídos com oxigênio e/ou enxofre, ou representa fenila ou naftila, hetarila, com 5 a 6 átomos anelares (por exemplo, furanila, piridila, imidazolila, triazolila, pirazolila, pirimidila, tiazolila ou tienila), fenil-C₁-C₆-alquila ou naftil-C₁-C₆-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-halogenoalquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-halogenoalcóxi, ciano ou nitro,

B representa, preferivelmente, hidrogênio, C₁-C₁₂-alquila ou C₁-C₈-alcóxi-C₁-C₆-alquila ou

A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados, representam, preferivelmente, C₃-C₁₀-cicloalquila saturada ou C₅-C₁₀-cicloalquila, onde, opcionalmente, um elemento anelar está substituído com oxigênio ou enxofre e que, opcionalmente, estão mono- e dissustituídos com C₁-C₈-alquila, C₃-C₁₀-cicloalquila, C₁-C₈-halogenoalquila, C₁-C₈-alcóxi, C₁-C₈-alquiltio, halogênio ou fenila ou

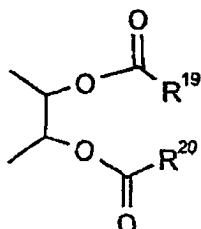
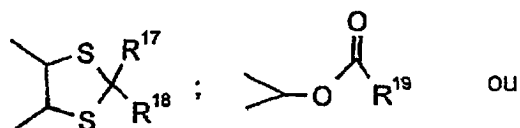
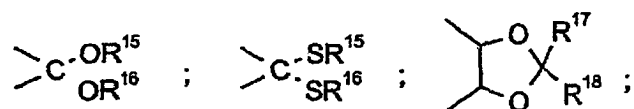
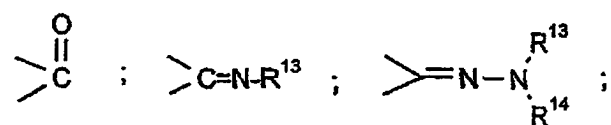
A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados representam, preferivelmente, C₃-C₆-cicloalquila, que está substituída com um grupo alquilenodiila, que opcionalmente contém um ou dois átomos de oxigênio e/ou enxofre, não diretamente adjacentes, opcionalmente substituída com C₁-C₄-alquila, ou por um grupo alquilenodioxila ou por um grupo alquilenoditioíla, que com o átomo de carbono ao qual está ligado forma um outro anel de cinco a oito elementos ou

A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados representam, preferivelmente, C₃-C₈-cicloalquila ou C₅-C₈-cicloalquenila, em que dois substituintes, juntamente com os átomos de carbono aos quais estão ligados, representam C₂-C₆-alcanodiila, C₂-C₆-alquenodiila ou C₄-C₆-alcanodiila, respectivamente, opcionalmente substituída com C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi ou halogênio, sendo que, opcionalmente, um grupo metileno está substituído

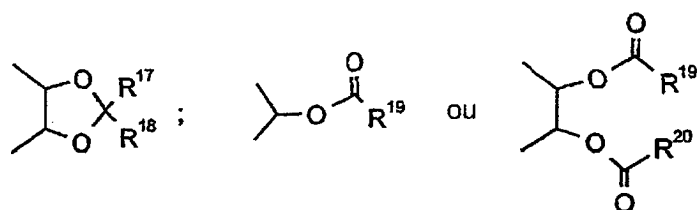
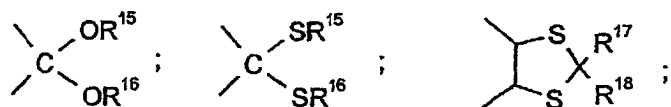
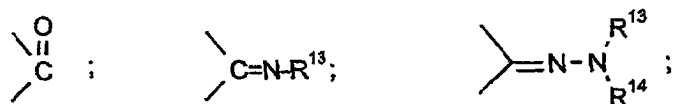
com oxigênio ou enxofre,

D representa, preferivelmente, hidrogênio, C₁-C₁₂-alquila, C₃-C₈-alquenila, C₃-C₈-alquinila, C₁-C₁₀-alcóxi-C₂-C₈-alquila, respectivamente, opcionalmente por halogênio, C₃-C₈-cicloalquila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-halogenoalquila, no qual, opcionalmente, um elemento anelar está substituído com oxigênio ou enxofre, ou fenila, hetarila, com 5 ou 6 átomos anelares (por exemplo, furanila, imidazolila, piridila, tiazolila, pirazolila, pirimidila, pirrolila, tienila ou triazolila), fenil-C₁-C₆-alquila ou hetaril-C₁-C₆-alquila, com 5 ou 6 átomos anelares (por exemplo, furanila, imidazolila, piridila, tiazolila, pirazolila, pirimidila, pirrolila, tienila ou triazolila), respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-halogenoalquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-halogenoalcóxi, ciano ou nitro, ou

A e D, em conjunto, representam, preferivelmente, C₃-C₆-alcanodiila ou C₃-C₆-alquenodiila, respectivamente, opcionalmente substituída, em que, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com um grupo carbonila, oxigênio ou enxofre e sendo que como substituintes são respectivamente de interesse: halogênio, hidróxi, mercapto ou C₁-C₁₀-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquiltio, C₃-C₇-cicloalquila, fenila ou benzilóxi, respectivamente, opcionalmente substituído com halogênio, ou um outro grupo C₃-C₆-alcanodiila, grupo C₃-C₆-alquenodiila ou um grupo butadienoila, que está opcionalmente substituído com C₁-C₆-alquila ou no qual, opcionalmente, dois substituintes adjacentes, com o átomo de carbono ao qual estão ligados, formam um outro ciclo saturado ou insaturado, com 5 ou 6 átomos anelares (no caso do composto da fórmula (I-1), A e D representam, então, juntamente com os átomos aos quais estão ligados, por exemplo, para os grupos AD-1 a AD-10, citados mais abaixo), que pode conter oxigênio ou enxofre, ou nos quais, opcionalmente, está contido um dos seguintes grupos



- A e Q¹ representam, em conjunto, preferivelmente, C₁-C₁₀-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquiltio, C₃-C₇-cicloalquila, respectivamente, opcionalmente mono- ou dissustituído, de modo igual ou diferente, por halogênio, hidróxi, respectivamente, opcionalmente mono- a trissustituído, de modo igual ou diferente, por halogênio, ou representam C₃-C₆-alcanodiila ou C₄-C₆-alquenodiila, respectivamente, opcionalmente substituída, de modo igual ou diferente, por halogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-alcóxi, benzilóxi ou fenila substituída, que além disso, opcionalmente contém um dos grupos
- 5
- 10 abaixo



ou está conjugado por um grupo C₁-C₂-alcanodiila ou por um átomo de oxigênio ou

Q¹ representa, preferivelmente, hidrogênio ou C₁-C₄-alquila,

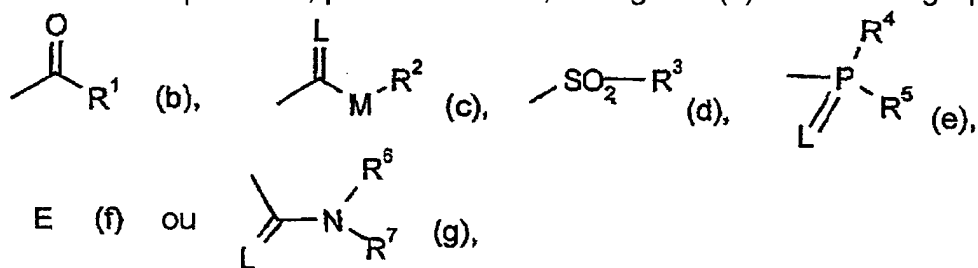
Q², Q⁴, Q⁵ e Q⁶ representam, independentemente um do outro,

5 preferivelmente, hidrogênio ou C₁-C₄-alquila,

Q³ representa, preferivelmente, hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi-C₁-C₂-alquila, C₁-C₆-alquiltio-C₁-C₂-alquila, representa C₃-C₈-cicloalquila, opcionalmente substituída com C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-alcóxi, na qual, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com oxigênio ou enxofre ou representa fenila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₂-halogenoalquila, C₁-C₂-halogenoalcóxi, ciano ou nitro ou

Q³ e Q⁴ representam, preferivelmente, junto com o átomo de carbono ao qual estão ligados, um anel C₃-C₇-, opcionalmente substituído com C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₂-halogenoalquila, no qual, opcionalmente, um elemento anelar está substituído com oxigênio ou enxofre.

G representa, preferivelmente, hidrogênio (a) ou um dos grupos



20 particularmente para (a), (b) ou (g),
nas quais

E representa um equivalente de íon metálico ou um íon de amônio,

L representa oxigênio ou enxofre,

25 M representa oxigênio ou enxofre.

R¹ representa, preferivelmente, C₁-C₂₀-alquila, C₂-C₂₀-alquenila, C₁-C₈-alcóxi-C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alquiltio-C₁-C₈-alquila, poli-C₁-C₈-alcóxi-C₁-C₈-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, ou

representa C₃-C₈-cicloalquila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-alcóxi, na qual, opcionalmente, um ou mais (preferivelmente, não mais do que dois) elementos anelares não-diretamente adjacentes estão substituídos com oxigênio e/ou enxofre,

5 representa fenila, opcionalmente substituída com halogênio, ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-halogenoalquila, C₁-C₆-halogenoalcóxi, C₁-C₆-alquiltio ou C₁-C₆-alquilsulfonila,

 representa fenil-C₁-C₆-alquila, opcionalmente substituída com halogênio, nitro, ciano, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-halogenoalquila ou
10 C₁-C₆-halogenoalcóxi,

 representa hetarila de 5 ou 6 elementos, opcionalmente substituída com halogênio ou C₁-C₆-alquila (por exemplo, pirazolila, tiazolila, piridila, pirimidila, furanila ou tienila),

 representa fenóxi-C₁-C₆-alquila, opcionalmente substituída com
15 halogênio ou C₁-C₆-alquila ou

 representa hetarilóxi-C₁-C₆-alquila de 5 ou 6 elementos, opcionalmente substituído com halogênio, amino ou C₁-C₆-alquila (por exemplo, piridilóxi-C₁-C₆-alquila, pirimidilóxi-C₁-C₆-alquila ou tiazolilóxi-C₁-C₆-alquila).

 R² representa, preferivelmente, C₁-C₂₀-alquila, C₂-C₂₀-alquenila,
20 C₁-C₈-alcóxi-C₂-C₈-alquila, poli-C₁-C₈-alcóxi-C₂-C₈-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio,

 representa C₃-C₈-cicloalquila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₆-alcóxi, ou

 representa fenila ou benzila, respectivamente, opcionalmente
25 substituída com halogênio, ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-halogenoalquila ou C₁-C₆-halogenoalcóxi.

 R³ representa, preferivelmente, C₁-C₈-alquila, opcionalmente substituída com halogênio ou representa fenila ou benzila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₄-halogenoalquila, C₁-C₄-halogenoalcóxi, ciano ou nitro.
30

 R⁴ e R⁵ representam, preferivelmente, independentemente um do outro, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alcóxi, C₁-C₈-alquilamino, di-(C₁-C₈-alquil)-

amino, C₁-C₈-alquiltio, C₂-C₈-alqueniltio, C₃-C₇-cicloalquiltio, respectivamente, opcionalmente substituído com halogênio, ou representam fenila, fenóxi ou feniltio, respectivamente, opcionalmente substituído com halogênio, nitro, ciano, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-halogenoalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-halogenalquiltio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalquila.

R⁶ e R⁷ representam, preferivelmente, independentemente um do outro, hidrogênio, representam C₁-C₈-alquila, C₃-C₈-cicloalquila, C₁-C₈-alcóxi, C₃-C₈-alquenila, C₁-C₈-alcóxi-C₁-C₈-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com halogênio, representam fenila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₈-halogenoalquila, C₁-C₈-alquila ou C₁-C₈-alcóxi, benzila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-halogenoalquila ou C₁-C₈-alcóxi ou, em conjunto, representam um radical C₃-C₆-alquilenos, opcionalmente substituído com C₁-C₄-alquila, no qual, opcionalmente, um átomo de carbono está substituído com oxigênio ou enxofre.

R¹³ representa, preferivelmente, hidrogênio, representa C₁-C₈-alquila ou C₁-C₈-alcóxi, respectivamente, opcionalmente substituído com halogênio, representa C₃-C₈-cicloalquila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-alcóxi, na qual, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com oxigênio ou enxofre, ou representa fenila, fenil-C₁-C₄-alquila ou fenil-C₁-C₄-alcóxi, respectivamente, opcionalmente substituído com halogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₄-halogenoalquila, C₁-C₄-halogenoalcóxi, nitro ou ciano.

R¹⁴ representa, preferivelmente, hidrogênio ou C₁-C₈-alquila ou R¹³ e R¹⁴ representam, em conjunto, preferivelmente, C₄-C₆-alcanodiila.

R¹⁵ e R¹⁶ são iguais ou diferentes e representam, preferivelmente, C₁-C₆-alquila ou

R¹⁵ e R¹⁶ representam, em conjunto, preferivelmente, um radical C₂-C₄-alcanodiila, que está opcionalmente substituído com C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-halogenoalquila ou fenila, opcionalmente substituída com halogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₄-halogenoalcóxi, nitro

ou ciano.

R^{17} e R^{18} representam, independentemente um do outro, preferivelmente, hidrogênio, representa C_1 - C_8 -alquila, opcionalmente substituída com halogênio, ou representam fenila, opcionalmente substituída com halogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_4 -halogenoalquila, C_1 - C_4 -halogenoalcóxi, nitro ou ciano ou

R^{17} e R^{18} representam, juntamente com o átomo de carbono ao qual estão ligados, preferivelmente, um grupo carbonila ou representam C_5 - C_7 -cicloalquila, opcionalmente substituída com halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -alcóxi, na qual, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com oxigênio ou enxofre.

R^{19} e R^{20} representam, independentemente um do outro, preferivelmente, C_1 - C_{10} -alquila, C_2 - C_{10} -alquenila, C_1 - C_{10} -alcóxi, C_1 - C_{10} -alquilamino, C_3 - C_{10} -alquenilamino, di- $(C_1$ - C_{10} -alquil)amino ou di- $(C_3$ - C_{10} -alquenil)amino.

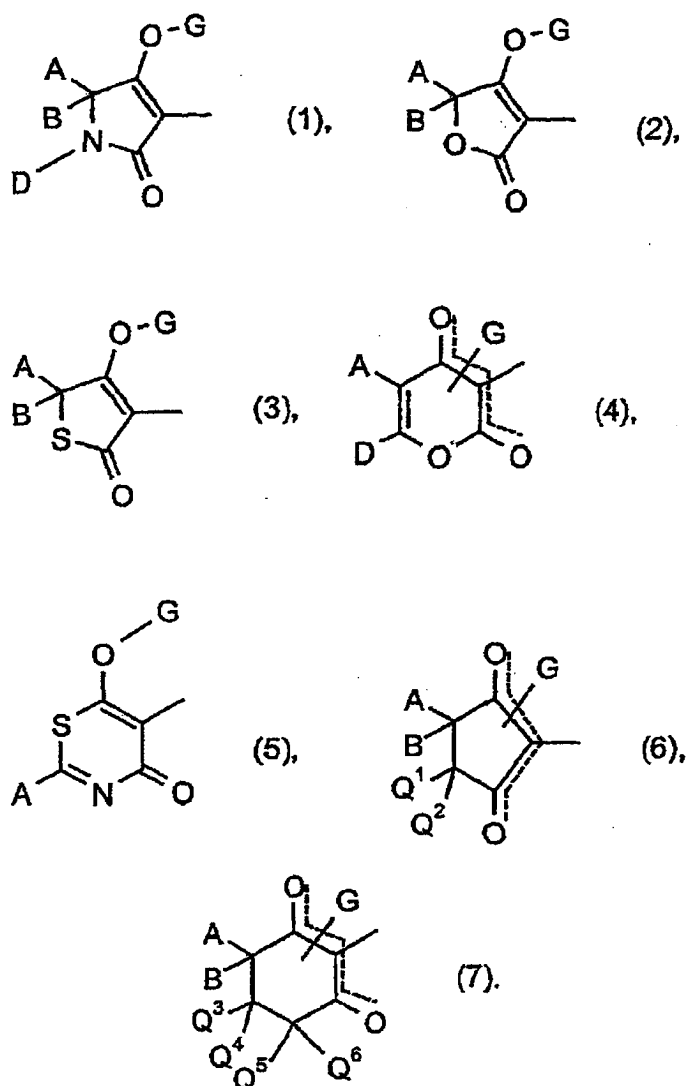
W representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_2 - C_4 -alquenila ou etinila.

X representa, de modo particularmente preferido, C_1 - C_4 -alquila, C_2 - C_4 -alquenila ou etinila.

Y representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio, metila, etila, i-propila, C_2 - C_4 -alquenila ou etinila.

Z representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_2 - C_4 -alquenila ou etinila, com a condição de que pelo menos um dos radicais W, X, Y ou Z representa uma cadeia com pelo menos dois átomos de carbono, sendo que, no máximo, apenas um dos radicais W, X, Y ou Z pode representar C_2 - C_4 -alquenila ou etinila.

CKE representa, de modo particularmente preferido, um dos grupos



A representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₆-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₂-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor ou cloro, C₃-C₆-cicloalquila, opcionalmente substituída com C₁-C₂-alquila ou C₁-C₂-alcóxi ou (porém, não no caso dos compostos das fórmulas (I-4), (I-6) e (I-7)) fenila ou benzila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor, cloro, bromo, C₁-C₄-alquila, C₁-C₂-halogenoalquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₂-halogenoalcóxi, ciano ou nitro.

B representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio ou C₁-C₄-alquila ou

A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados, representam, de modo particularmente preferido, C₅-C₇-cicloalquila, saturada ou insaturada, na qual, opcionalmente, um elemento anelar está substituído com oxigê-

nio ou enxofre e que opcionalmente está monossubstituída com C₁-C₆-alquila, trifluormetila ou C₁-C₆-alcóxi, ou

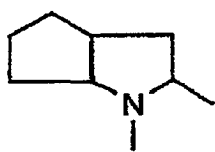
5 A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados, representam, de modo particularmente preferido, C₅-C₆-cicloalquila, que está substituída, por um grupo alquilenodiila, opcionalmente substituída com metila ou etila e que contém, opcionalmente, um ou dois átomos de oxigênio ou átomos de enxofre, não diretamente adjacentes ou por um grupo alquilenodioxila ou por um grupo alquilenoditiol, que, com o átomo de carbono ao qual está ligado, forma um outro anel de cinco ou seis elementos ou

10 A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados representam, de modo particularmente preferido, C₃-C₆-cicloalquila ou C₅-C₆-cicloalquenila, na qual dois substituintes, junto com os átomos de carbono, ao qual estão ligados, representam C₂-C₄-alcanodiila, C₂-C₄-alquenodiila ou butadienodiila, respectivamente, opcionalmente substituída com C₁-C₂-alquila ou C₁-C₂-alcóxi.

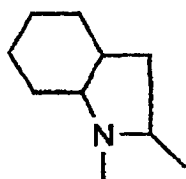
D representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-alquenila, C₁-C₄-alcóxi-C₂-C₃-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor, representa C₃-C₆-cicloalquila, opcionalmente substituída com C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₂-halogenoalquila, na qual, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com oxigênio ou (porém não no caso dos compostos das fórmulas (I-a)) representa fenila ou piridila, respectivamente, opcionalmente mono- a dissustituída com flúor, cloro, bromo, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-halogenoalcóxi ou

25 A e D, em conjunto, representam, de modo particularmente preferido, C₃-C₅-alcanodiila, opcionalmente substituída, na qual um grupo metileno pode estar substituído com um grupo carbonila (porém, não no caso dos compostos da fórmula (I-a)), oxigênio ou enxofre, sendo que como substituintes é de interesse C₁-C₂-alquila ou

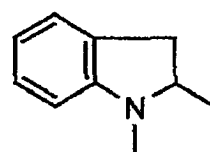
30 A e D representam (no caso dos compostos da fórmula (I-a)), junto com os átomos, aos quais estão ligados, um dos grupos AD-1 a AD-10:



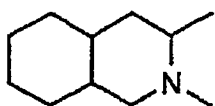
AD-1



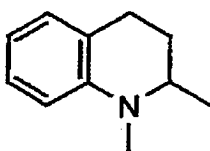
AD-2



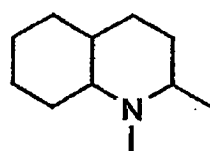
AD-3



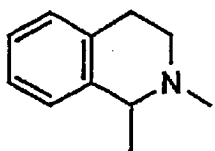
AD-4



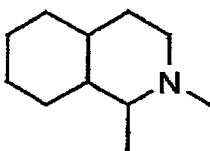
AD-5



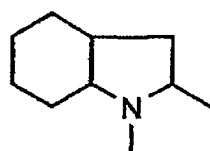
AD-6



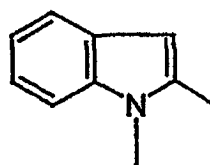
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

ou

A e Q¹, em conjunto, representam, de modo particularmente preferido, C₃-C₄-alcanodiila, respectivamente, opcionalmente mono- ou dissubs-
 tituída, de modo igual ou diferente, por C₁-C₂-alquila ou C₁-C₂-alcóxi ou

Q¹ representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio.

Q² representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio.

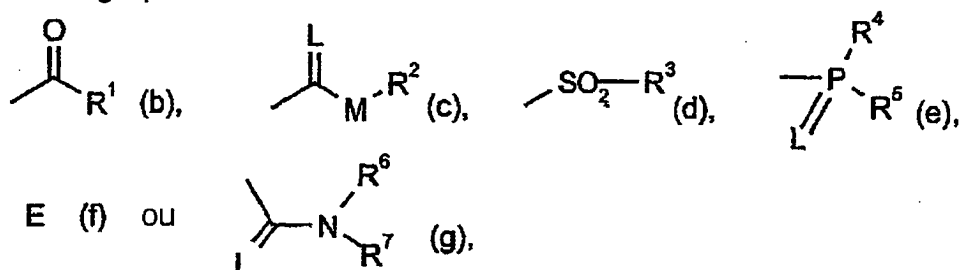
Q⁴, Q⁵ e Q⁶ representam, de modo particularmente preferido,
 independentemente um do outro, hidrogênio ou C₁-C₃-alquila.

Q³ representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio, C₁-C₄-alquila ou C₃-C₆-cicloalquila, opcionalmente mono- a dissubs-
 tituída com metila ou metóxi, ou

Q³ e Q⁴ representam, de modo particularmente preferido, junta-
 mente com o carbono, ao qual estão ligados, um anel C₅-C₆ saturado, op-
 cionalmente substituído com C₁-C₂-alquila ou C₁-C₂-alcóxi, no qual, opcio-

nalmente, um elemento anelar está substituído com oxigênio ou enxofre.

G representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio (a) ou um dos grupos



- 5 particularmente para (a), (b) ou (c),
nas quais

E representa um equivalente de íon metálico ou um íon de amônio,

L representa oxigênio ou enxofre,

- 10 M representa oxigênio ou enxofre,

- R¹ representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₈-alquila, C₂-C₈-alquenila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₂-alquila, C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₂-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor ou cloro, ou C₃-C₆-cicloalquila, opcionalmente substituída com flúor, cloro, C₁-C₂-alquila ou C₁-C₂-alcóxi, na qual, opcionalmente, um ou dois elementos anelares, não diretamente adjacentes, estão substituídos com oxigênio,

- representa fenila, opcionalmente mono- a dissustituída com flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₂-halogenoalquila ou C₁-C₂-halogenoalcóxi,

- 20 R² representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₈-alquila, C₂-C₈-alquenila ou C₁-C₄-alcóxi-C₂-C₄-alquila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor,

representa C₃-C₆-cicloalquila, opcionalmente substituída com C₁-C₂-alquila ou C₁-C₂-alcóxi ou

- 25 representa fenila ou benzila, respectivamente, opcionalmente monossustituída com flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, C₁-C₄-alquila, (C₁-C₃)-alcóxi, trifluormetila ou trifluormetóxi.

R³ representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₆-alquila,

opcionalmente substituída com flúor ou representa fenila, opcionalmente monossubstituída com flúor, cloro, bromo, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, trifluormetila, trifluormetóxi, ciano ou nitro.

5 R⁴ representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquilamino, di-(C₁-C₆-alquil)amino, C₁-C₆-alquiltio, C₃-C₄-alqueniltio, C₃-C₆-cicloalquiltio ou representa fenila, fenóxi ou feniltio, respectivamente, opcionalmente monossubstituído com flúor, cloro, bromo, nitro, ciano, C₁-C₃-alcóxi, C₁-C₃-halogenoalcóxi, C₁-C₃-alquiltio, C₁-C₃-halogenalquiltio, C₁-C₃-alquila ou trifluormetila.

10 R⁵ representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₆-alcóxi ou C₁-C₆-alquiltio.

R⁶ representa, de modo particularmente preferido, hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-alcóxi, C₃-C₆-alquenila, C₁-C₆-alcóxi-C₁-C₄-alquila, representa fenila, opcionalmente monossubstituída com flúor, cloro, bromo, trifluormetila, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-alcóxi, representa benzila, 15 opcionalmente monossubstituída com flúor, cloro, bromo, C₁-C₄-alquila, trifluormetila ou C₁-C₄-alcóxi.

R⁷ representa, de modo particularmente preferido, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-alquenila ou C₁-C₆-alcóxi-C₁-C₄-alquila.

20 R⁶ e R⁷, representam, de modo particularmente preferido, um radical C₅-alquilenos, opcionalmente substituído com metila ou etila, no qual, opcionalmente, um grupo metileno está substituído com oxigênio ou enxofre.

Nas definições dos radicais, citadas como particularmente preferidas, halogênio representa flúor, cloro, bromo e iodo, particularmente, flúor, 25 cloro e bromo.

W representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio, metila, etila, i-propila, vinila ou etinila.

X representa, de modo especialmente preferido, metila, etila, n-propila, isopropila, vinila ou etinila.

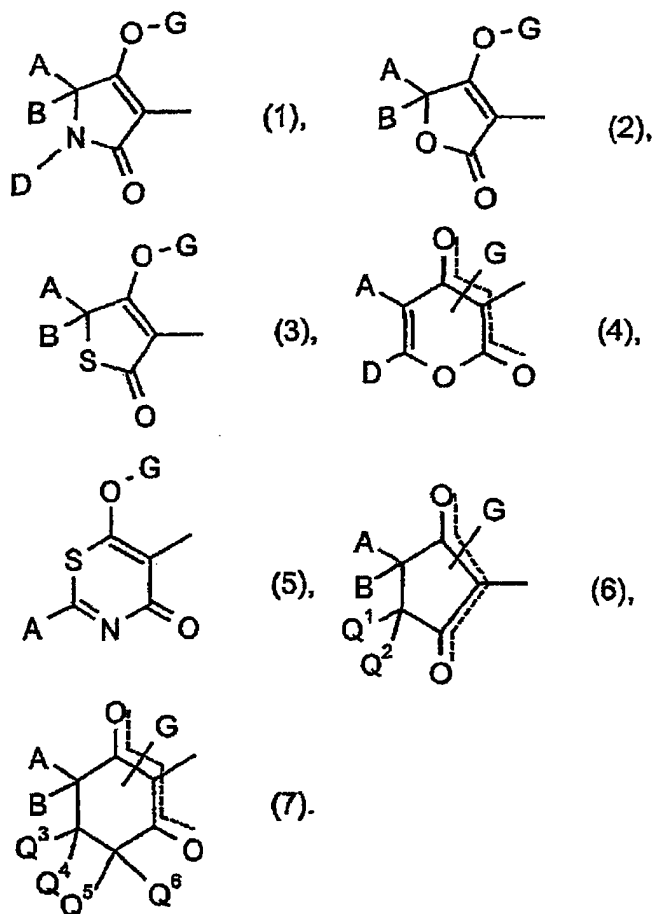
30 Y representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio, metila, etila, i-propila, vinila ou etinila.

Z representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio, me-

tila, etila, n-propila, i-butila, vinila ou etinila,

com a condição de que pelo menos um dos radicais W, X, Y ou Z represente uma cadeia com pelo menos dois átomos de carbono, sendo que, no máximo, apenas um dos radicais W, X, Y ou Z pode representar vinila ou etinila,

5 CKE representa, de modo especialmente preferido, um dos grupos



A representa, de modo especialmente preferido, C₁-C₄-alquila, opcionalmente substituída com flúor, ou C₁-C₂-alcóxi-C₁-C₂-alquila, ciclopentila, ciclopentila ou ciclohexila e, só no caso dos compostos da fórmula (I-5), representa fenila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor, clo-
 10 ro, bromo, metila, etila, n-propila, isopropila, metóxi, etóxi, trifluormetila, trifluormetóxi, ciano ou nitro.

15 B representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio, metila ou etila
 ou

A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados, representam,

de modo especialmente preferido, C₅-C₆-cicloalquila saturada, na qual, opcionalmente, um elemento anelar está substituído com oxigênio ou enxofre e que está opcionalmente monossubstituída com metila, etila, propila, isopropila, trifluormetila, metóxi, etóxi, propóxi ou butóxi

5 ou

A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados representam, de modo especialmente preferido, C₆-cicloalquila, que está substituída com um grupo alquilenodioxila, que contém dois átomos de oxigênio, não diretamente adjacentes,

10 A, B e o átomo de carbono ao qual estão ligados representam, de modo especialmente preferido, C₅-C₆-cicloalquila ou C₅-C₆-cicloalquenila, onde dois substituintes, junto com os átomos de carbono, ao qual estão ligados, representam C₂-C₄-alcanodiila ou C₂-C₄-alquenodiila ou butadienodiila.

D representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio, re-
15 presenta C₁-C₄-alquila, C₃-C₄-alquenila, C₁-C₄-alcóxi-C₂-C₃-alquila, ciclopropila, ciclopentila ou ciclohexila, opcionalmente substituída com flúor, ou (porém, não no caso dos compostos das fórmulas (I-a)), representa fenila ou piridila, opcionalmente monossubstituída com flúor, cloro, metila, etila, n-propila, isopropila, metóxi, etóxi ou trifluormetila,

20 ou

A e D representam, em conjunto, de modo especialmente preferido, C₃-C₄-alcanodiila, em que, opcionalmente, um átomo de carbono está substituído com oxigênio ou enxofre.

A e Q¹ representam, em conjunto, de modo especialmente preferido,
25 rido, C₃-C₄-alcanodiila, opcionalmente monossubstituída ou dissubstituída com metila ou metóxi,

ou

Q¹ representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio.

Q² representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio.

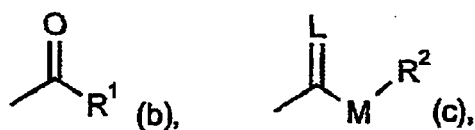
30 Q⁴, Q⁵ e Q⁶ representam, independentemente um do outro, de modo especialmente preferido, hidrogênio ou metila.

Q³ representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio,

metila, etila ou propila,
ou

Q³ e Q⁴ representam, de modo especialmente preferido, juntamente com o átomo de carbono, ao qual estão ligados, um anel C₅-C₆ saturado, opcionalmente monossubstituído com metila ou metóxi.

G representa, de modo especialmente preferido, hidrogênio (a) ou um dos grupos



nas quais

10 L representa oxigênio ou enxofre e

M representa oxigênio ou enxofre.

R¹ representa, de modo especialmente preferido, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₁-C₂-alcóxi-C₁-alquila, C₁-C₂-alquiltio-C₁-alquila ou ciclopropila ou ciclohexila, opcionalmente monossubstituída com flúor, cloro, metila ou metóxi,

representa fenila, opcionalmente monossubstituída com flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metila, metóxi, trifluormetila ou trifluormetóxi,

R² representa, de modo especialmente preferido, C₁-C₈-alquila, C₂-C₆-alquenila ou C₁-C₄-alcóxi-C₂-C₃-alquila, fenila ou benzila, respectivamente, opcionalmente substituída com flúor.

W representa, de modo principalmente preferido, hidrogênio, metila, etila ou i-propila,

X representa, de modo principalmente preferido, metila, etila, i-propila ou vinila,

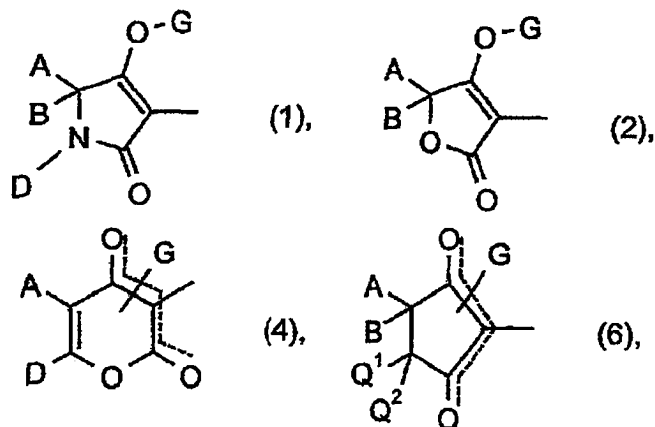
25 Y representa, de modo principalmente preferido, hidrogênio, metila, etila, i-propila, vinila ou etinila,

Z representa, de modo principalmente preferido, hidrogênio, metila, etila, n-propila ou i-butila,

com a condição de que pelo menos um dos radicais W, X, Y ou
30 Z represente uma cadeia com pelo menos dois átomos de carbono, sendo que, no máximo, apenas um dos radicais W, X, Y ou Z pode representar vini-

la ou etinila,

CKE representa, de modo principalmente preferido, um dos grupos



5

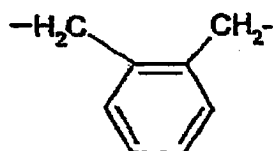
A representa, de modo principalmente preferido, metila,

B representa, de modo principalmente preferido, metila,

A, B e o átomo de carbono, ao qual estão ligados, representam, de modo principalmente preferido, C₅-C₆-cicloalquila saturada, na qual um elemento anelar está opcionalmente substituído com oxigênio e que, opcionalmente, está monossubstituída com metila, etila, metóxi, etóxi.

10

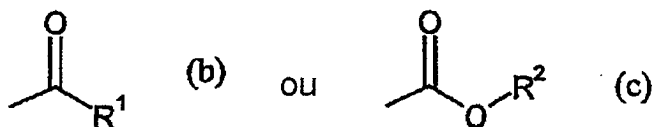
A e B representam, especialmente, em conjunto



D representa, de modo principalmente preferido, hidrogênio (porém, não no caso o composto da fórmula (I-1)), fenila, substituída com flúor,

15

G representa, de modo principalmente preferido, hidrogênio (a) ou um dos grupos



20

R¹ representa, de modo principalmente preferido, C₁-C₆-alquila, C₁-C₂-alcoximetila,

R² representa, de modo principalmente preferido, C₁-C₄-alquila.

Para CKE = (6),

A e Q¹ representam, em conjunto, de modo principalmente preferido, C₃-C₄-alcanodiila e

B e Q² representam, respectivamente, de modo principalmente preferido, hidrogênio.

5 As definições de radicais ou explicações gerais citadas acima ou citadas nas faixas preferidas podem ser combinadas de qualquer maneira desejada, portanto, também entre as respectivas faixas e faixas preferidas. Elas valem tanto para os produtos finais como, de modo correspondente, para os produtos preliminares e intermediários.

10 São preferidos de acordo com a invenção os compostos da fórmula (I), nos quais existe uma combinação dos significados citados acima como preferidos (preferivelmente).

São particularmente preferidos de acordo com a invenção os compostos da fórmula (I), nos quais existe uma combinação dos significados citados acima como particularmente preferidos.

15 São especialmente preferidos de acordo com a invenção os compostos da fórmula (I), nos quais existe uma combinação dos significados citados acima como especialmente preferidos.

São principalmente preferidos de acordo com a invenção os compostos da fórmula (I), nos quais existe uma combinação dos significados citados acima como principalmente preferidos.

20 Radicais de hidrocarboneto saturados ou insaturados, tal como alquila ou alquenila podem, também em ligação com heteroátomos, tal como, por exemplo, em alcóxi, ser respectivamente lineares ou ramificados, tanto quanto possível.

25 Radicais opcionalmente substituídos, desde que não indicados diversamente, podem estar mono- ou polissubstituídos, sendo que na polis-substituição, os substituintes podem ser iguais ou diferentes.

Individualmente, são citados, além dos compostos citados nos exemplos de produção, os seguintes compostos da fórmula (I-1-a):

30

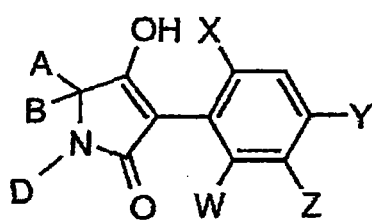

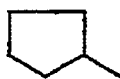



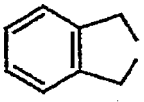
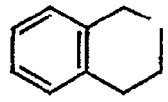
Tabela 1: W = CH₃, X = CH₃, Y = C≡CH, Z = H.

A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H

Continuação da Tabela 1:

A	B	D
C_2H_5	C_2H_5	H
C_3H_7	C_3H_7	H
	CH_3	H
	CH_3	H
	CH_3	H
$-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_4-$		H
$-(CH_2)_5-$		H
$-(CH_2)_6-$		H
$-(CH_2)_7-$		H
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$		H
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$		H
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$		H
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$		H

Continuação da Tabela 1:

A	B	D
$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}- \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \end{array}$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-\text{CH}_2- \\ \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_4 \end{array}$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_3 \end{array}$		H
		H
		H
$-(\text{CH}_2)_3-$		H
$-(\text{CH}_2)_4-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CH}_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{CHCH}_3-\text{CHCH}_3-$		H
$-\text{CH}_2-\text{S}-\text{CH}_2-$		H
$-\text{CH}_2-\text{S}-(\text{CH}_2)_2-$		H
$-(\text{CH}_2)_2-\text{S}-\text{CH}_2-$		H
$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-\text{CH}- \\ \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_3 \end{array}$		H
H	CH_3	H
H	C_2H_5	H
H	C_3H_7	H

Continuação da Tabela 1:


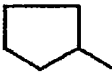
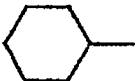

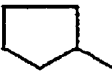
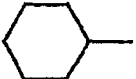
A	B	D
H	i-C ₃ H ₇	H
H		H
H		H
H		H
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	C ₂ H ₅	H
CH ₃	C ₃ H ₇	H
CH ₃	i-C ₃ H ₇	H
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

Tabela 2: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH=CH₂; Z = H.

5 Tabela 3: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

W = CH₃; X = C₂H₅; Y = CH₃; Z = H.

Tabela 4: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

W = CH₃; X = CH₃; Y = C₂H₅; Z = H.

Tabela 5: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

10 W = C₂H₅; X = C₂H₅; Y = CH₃; Z = H.

Tabela 6: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

W = C₂H₅; X = C₂H₅; Y = C₂H₅; Z = H.

Tabela 7: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

$W = \text{CH}_3$; $X = \text{C}\equiv\text{CH}$; $Y = \text{CH}_3$; $Z = \text{H}$.

Tabela 8: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

$W = \text{CH}_3$; $X = \text{CH}=\text{CH}_2$; $Y = \text{CH}_3$; $Z = \text{H}$.

Tabela 9: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

5 $W = \text{CH}_3$; $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $Y = \text{C}_2\text{H}_5$; $Z = \text{H}$.

Tabela 10: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{C}\equiv\text{CH}$; $Z = \text{H}$.

Tabela 11: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}=\text{CH}_2$; $Z = \text{H}$.

10 Tabela 12: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

$W = \text{H}$; $X = \text{C}_2\text{H}_5$; $Y = \text{CH}_3$; $Z = \text{H}$.

Tabela 13: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{C}_2\text{H}_5$; $Z = \text{H}$.

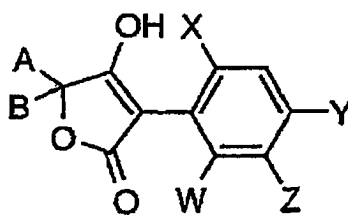
Tabela 14: A, B e D tal como indicados na Tabela 1

15 $W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{H}$; $Z = \text{C}_2\text{H}_5$.

Tabela : A, B e D tal como indicados na Tabela 1

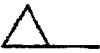

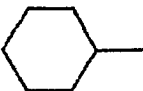
$W = \text{H}$; $X = \text{CH}_3$; $Y = \text{CH}_3$; $Z = \text{C}_2\text{H}_5$.

Individualmente, são citados, além dos compostos citados nos exemplos de produção, os seguintes compostos da fórmula (I-2-a):

Tabela 16: W = CH₃, X = CH₃, Y = C≡CH, Z = H.

A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
i-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
i-C ₄ H ₉	H
s-C ₄ H ₉	H
t-C ₄ H ₉	H
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃
i-C ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
i-C ₄ H ₉	CH ₃
s-C ₄ H ₉	CH ₃
t-C ₄ H ₉	CH ₃

Continuação da Tabela 16:

A	B
C_2H_5	C_2H_5
C_3H_7	C_3H_7
	CH_3
	CH_3
	CH_3
$-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_4-$	
$-(CH_2)_5-$	
$-(CH_2)_6-$	
$-(CH_2)_7-$	
$-(CH_2)_2-O-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-O-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-S-(CH_2)_2-$	
$-CH_2-CHCH_3-(CH_2)_3-$	
$-(CH_2)_2-CHCH_3-(CH_2)_2-$	
$(CH_2)_2-CHC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOCH_3-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_2H_5-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHOC_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-CHi-C_3H_7-(CH_2)_2-$	
$-(CH_2)_2-C(CH_3)_2-(CH_2)_2-$	

Continuação da Tabela 16:

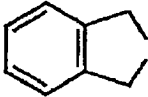
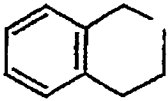
A	B
	$-\text{CH}_2-(\text{CHCH}_3)_2-(\text{CH}_2)_2-$
	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH}-(\text{CH}_2)_2-\text{CH}- \\ \qquad \qquad \\ \text{CH}_2 \end{array}$
	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \qquad \qquad \text{CH}-\text{CH}_2- \\ \qquad \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_4 \end{array}$
	$\begin{array}{c} -\text{CH}_2-\text{CH} \qquad \qquad \text{CH}-(\text{CH}_2)_2- \\ \qquad \qquad \qquad \\ (\text{CH}_2)_3 \end{array}$
	
	

Tabela 17: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = CH₃; X = CH₃; Y = CH=CH₂; Z = H.

5 Tabela 18: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = CH₃; X = C₂H₅; Y = CH₃; Z = H.

Tabela 19: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = CH₃; X = CH₃; Y = C₂H₅; Z = H.

Tabela 20: A e B tal como indicados na Tabela 16

10 W = C₂H₅; X = C₂H₅; Y = CH₃; Z = H.

Tabela 21: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = C₂H₅; X = C₂H₅; Y = C₂H₅; Z = H.

Tabela 22: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = CH₃; X = C≡CH; Y = CH₃; Z = H.

15 Tabela 23: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = CH₃; X = CH=CH₂; Y = CH₃; Z = H.

Tabela 24: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = CH₃; X = C₂H₅; Y = C₂H₅; Z = H.

Tabela 25: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = H; X = CH₃; Y = C≡CH; Z = H.

Tabela 26: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = H; X = CH₃; Y = CH=CH₂; Z = H.

5 Tabela 27: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = H; X = C₂H₅; Y = CH₃; Z = H.

Tabela 28: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = H; X = CH₃; Y = C₂H₅; Z = H.

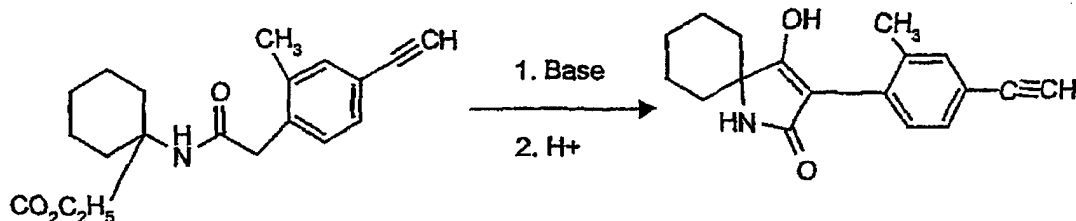
Tabela 29: A e B tal como indicados na Tabela 16

10 W = H; X = CH₃; Y = H; Z = H.

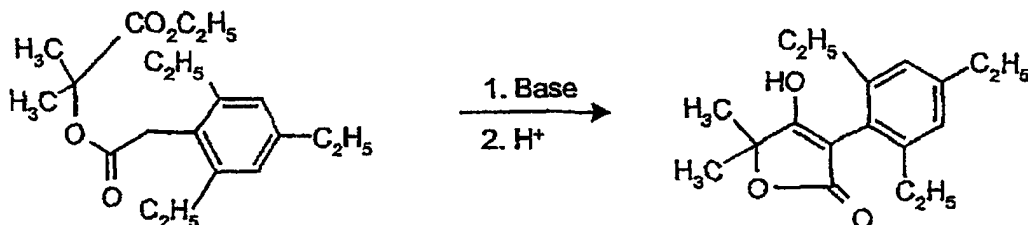
Tabela 30: A e B tal como indicados na Tabela 16

W = H; X = CH₃; Y = CH₃; Z = C₂H₅.

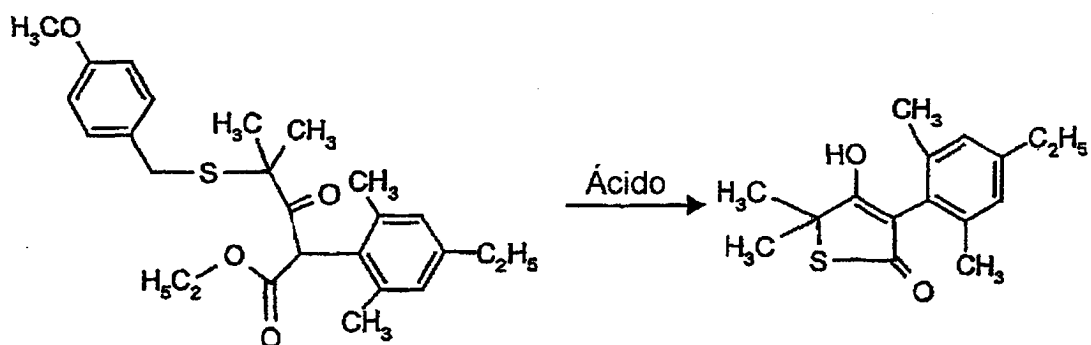
Se for utilizado, de acordo com o processo (A), N-(2-metil-4-etinil-fenilacetil)-1-amino-ciclohexano-etiléster de ácido carboxílico como material básico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



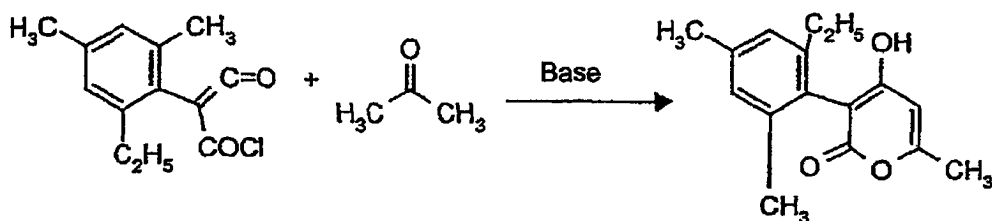
Se for utilizado, de acordo com o processo (B), O-(2,4,6-trietil-fenilacetil)-2-hidróxi-etiléster de ácido isobutárico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



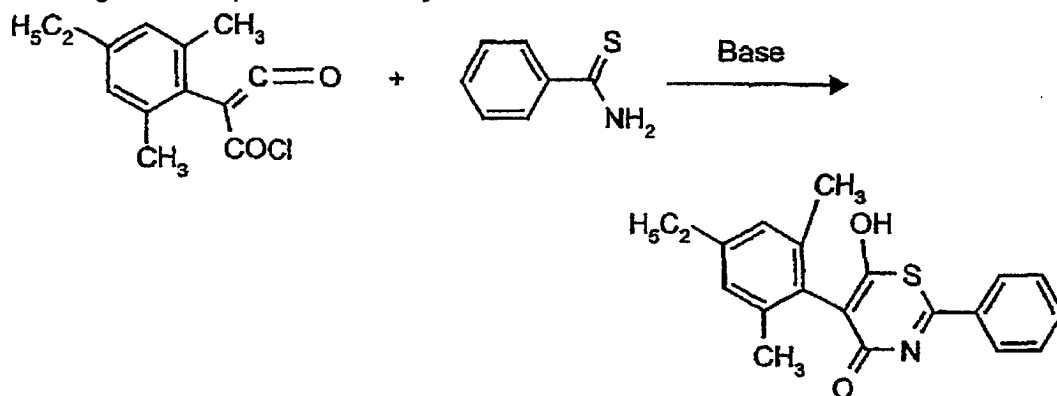
Se for utilizado, de acordo com o processo (C), 2-(2,6-dimetil-4-etil-fenil)-4-(4-metóxi)-bezilmercapto-4-metil-3-oxo-etiléster de ácido valeriânico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



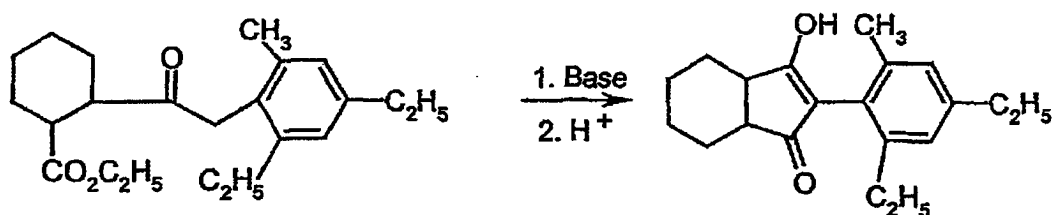
Se for utilizado, de acordo com o processo (D), (clorocarbonil)-2-(2-etil-4,6-dimetil)-fenil)-ceteno e acetona como compostos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



Se for utilizado, de acordo com o processo (E), (clorocarbonil)-2-(2,6-dimetil-4-etil-fenil)-ceteno e tiobenzamida como compostos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:

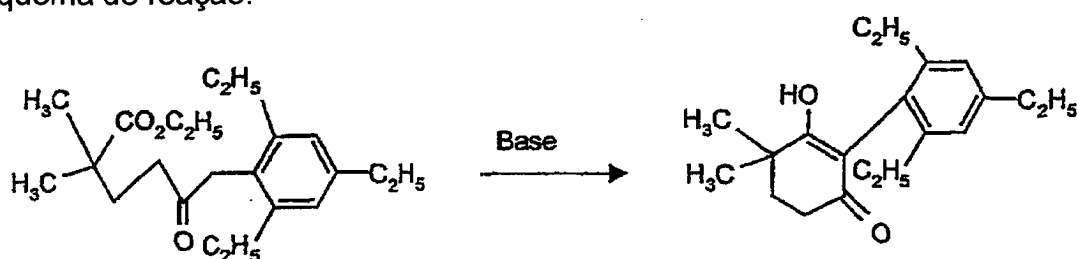


Se for utilizado, de acordo com o processo (F), 5-(2,4-dietil-6-metil-fenil)-2,3-tetrametileno-4-oxo-etiléster de ácido valeriânico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



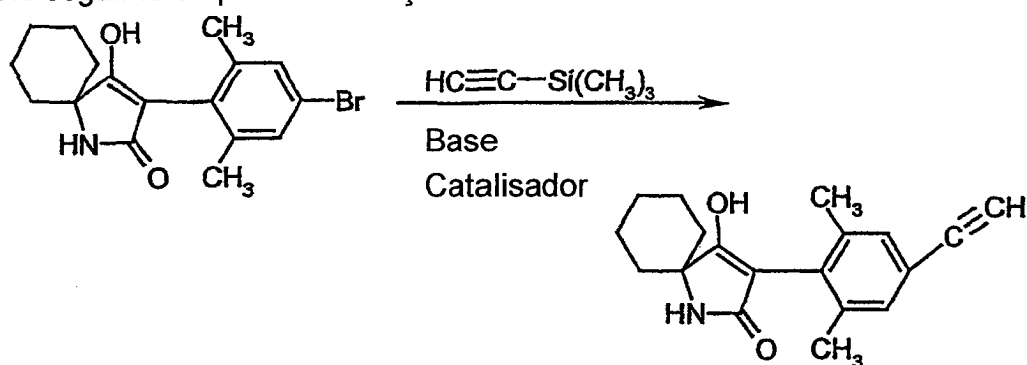
Se for utilizado, de acordo com o processo (G), 5-[(2,4,6-trietil-fenil)-fenil]-2,2-dimetil-5-oxo-etiléster de ácido hexânico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:

5



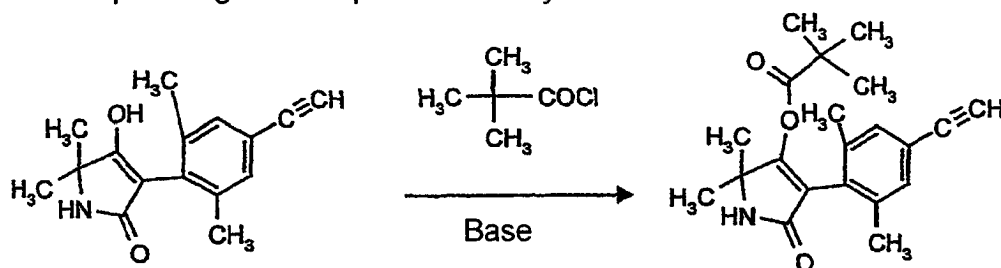
Se for utilizado, de acordo com o processo (H), 3-[(2,6-dimetil-4-bromo)-fenil]-4,4-(pentametileno)-pirrolidin-2,4-diona como produto básico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:

10

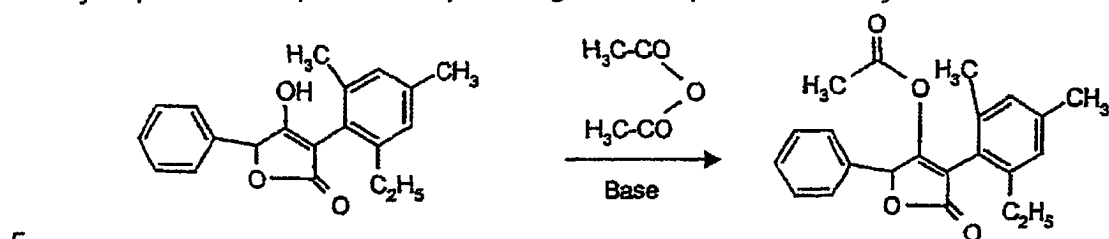


Se for utilizado, de acordo com o processo (Ia), 3-(2,6-dimetil-4-etinil-fenil)-5,5-dimetilpirolidin-2,4-diona e cloreto de pivaloila como materiais básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:

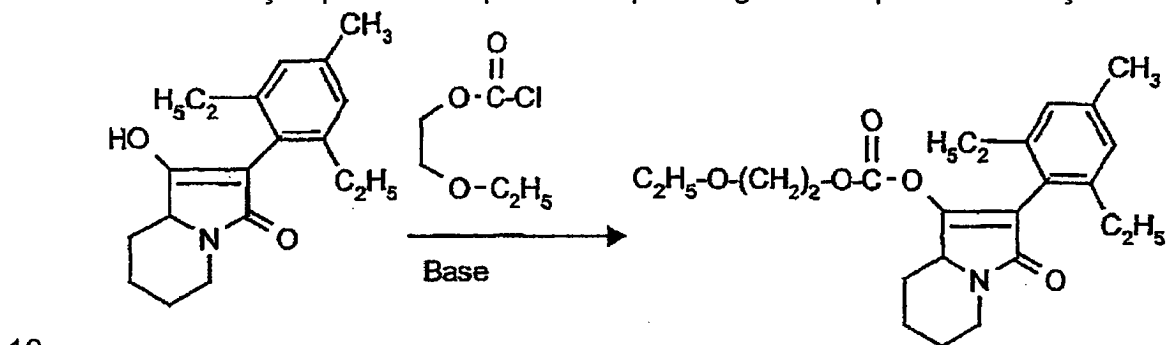
15



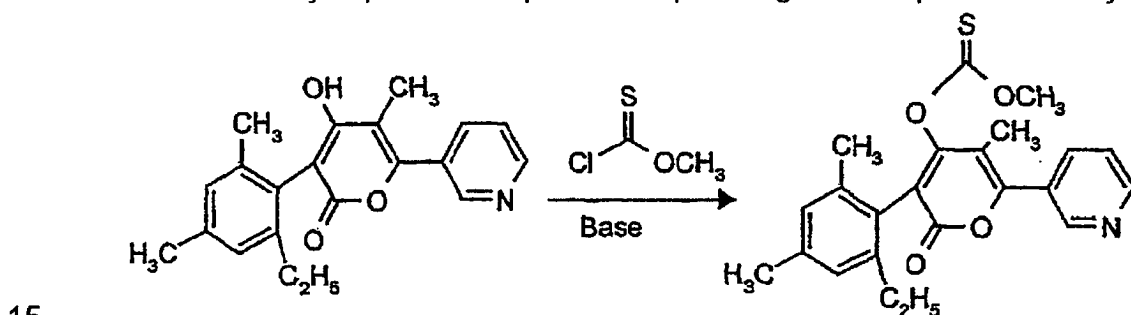
Se for utilizado, de acordo com o processo (Ib), 3-(2-etil-4,6-dimetil-fenil)-4-hidróxi-5-fenil- Δ^3 -dihidrofuran-2-ona e hidreto de acetano como compostos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



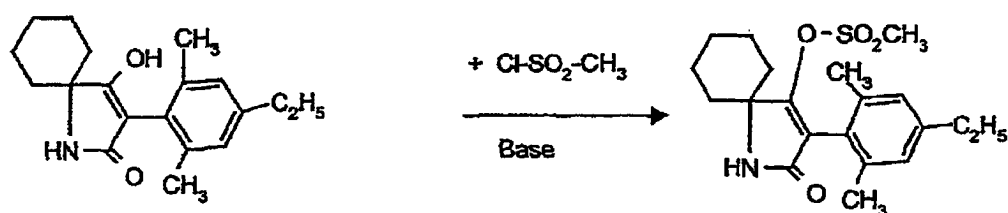
Se for utilizado, de acordo com o processo (J), 8-[(2,6-dietil-4-metil)-fenil]-1-azabicyclo-(4,3,0^{1,6})-nono-7,9-diona e etoxietiléster de ácido clorofórmico como compostos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



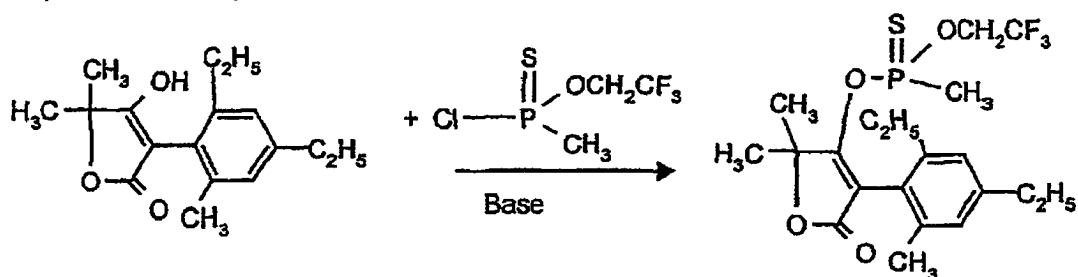
Se for utilizado, de acordo com o processo (K), 3-(2-etil-4,6-dimetil-fenil)-4-hidróxi-5-metil-6-(3-piridil)-pirona e metiléster de ácido cloromonotiofórmico como produtos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



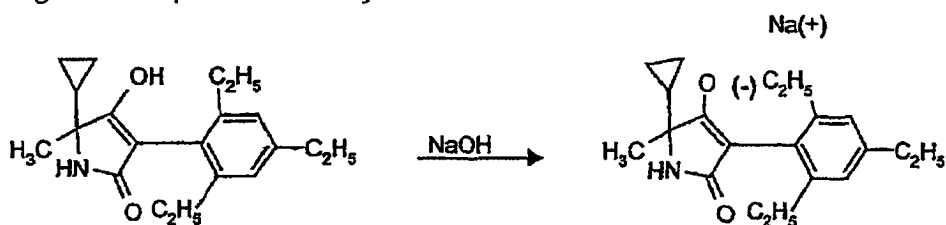
Se for utilizado, de acordo com o processo (L), 3-(2,6-dimetil-4-etil-fenil)-5,5-pentametileno-pirrolidina-2,4-diona e cloreto de ácido metanosulfônico como produto básico, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



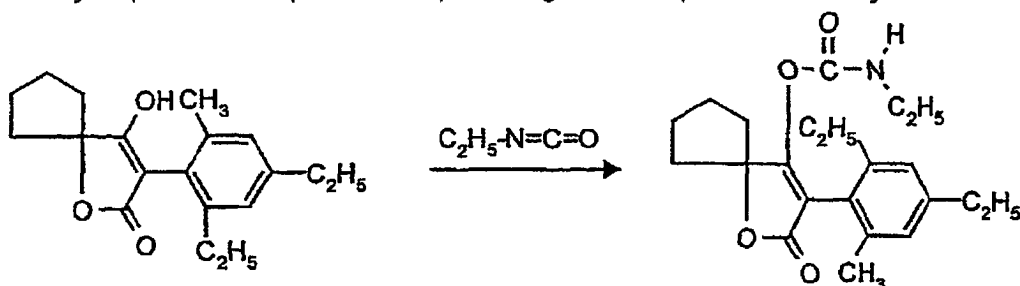
Se for utilizado, de acordo com o processo (M), 3-(2,4-dietil-6-metil-fenil)-4-hidróxi-5,5-dimetil- Δ^3 -dihidrofuran-2-ona e metanotio-cloreto de ácido fosfônico-(2,2,2-trifluoretiléster) como produtos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



Se for utilizado, de acordo com o processo (N), 3-(2,4,6-trietil-fenil]-5-ciclopropil-5-metil-pirrolidina-2,4-diona e NaOH como componentes, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:

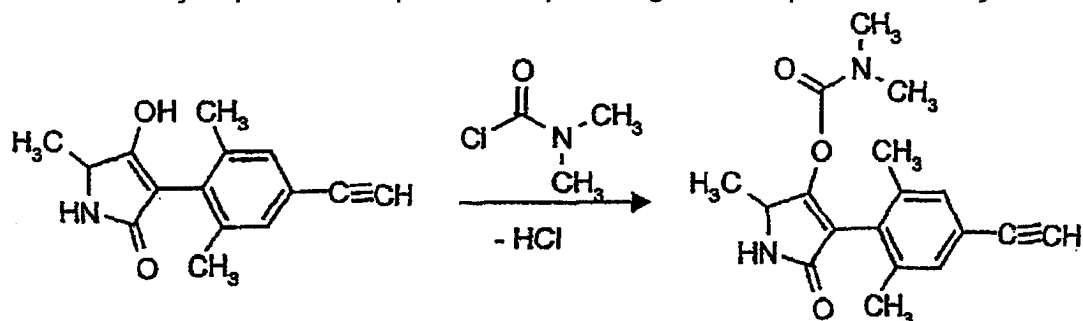


Se for utilizado, de acordo com o processo (O), variante α , 3-(2,4-dietil-6-metil-fenil)-4-hidróxi-5-tetrametileno- Δ^3 -dihidrofuran-2-ona e etili-socianato como produtos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:

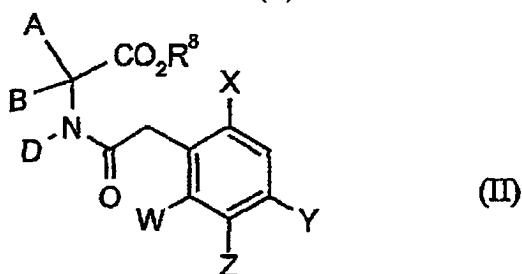


Se for utilizado, de acordo com o processo (O), variante β , 3-(4-

etinil-2,6-dimetil-fenil)-5-metil-pirolidina-2,4-diona e cloreto de ácido dimetil-carbamídico como produtos básicos, então o curso do processo de acordo com a invenção pode ser reproduzido pelo seguinte esquema de reação:



5 Os compostos da fórmula (II)

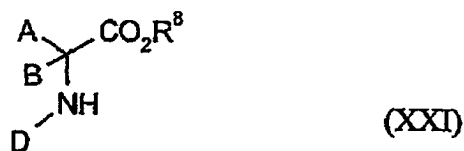


necessários como materiais básicos no processo (a) de acordo com a invenção,

em que

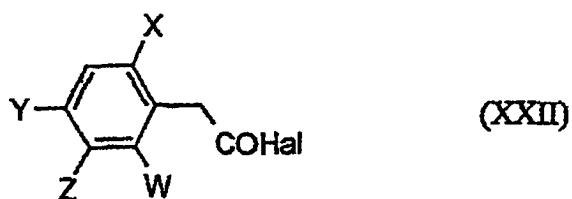
10 A, B, D, W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima, são novos.

Obtém-se os ésteres de aminoácido de acila da fórmula (II), por exemplo, quando derivados de ácido de amino da fórmula (XXI)



15 na qual

A, B, R⁸ têm os significados indicados acima, são acilados com halogenetos de ácido fenilacético substituídos da fórmula (XXII)



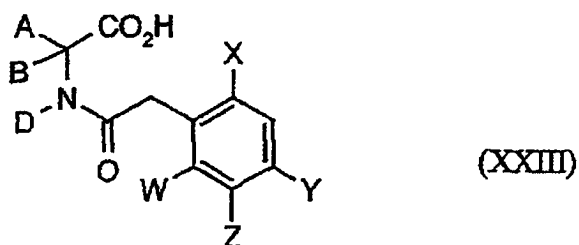
na qual

W, X, Y e Z têm os significados indicados acima e

Hal representa cloro ou bromo

- 5 (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968),

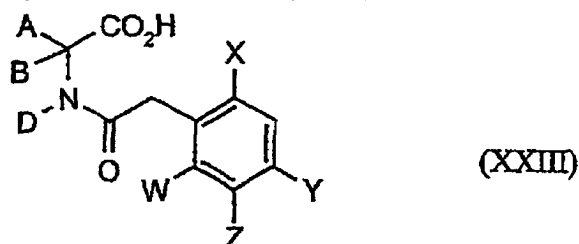
ou quando se esterifica aminoácidos de acima da fórmula (XXIII)



na qual

- 10 A, B, C, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima
(Chem. Ind. (Londres) 1568 (1968)).

Os compostos da fórmula (XXIII)



na qual

- 15 A, B, D, W, X, Y e Z têm os significados indicados cima,
são novos.

Obtém-se compostos da fórmula (XXIII) quando aminoácidos da
fórmula (XXIV)



- 20 na qual

A, B e D têm os significados indicados acima,
são acilados com halogenetos de ácido fenilacético da fórmula (XXII)



na qual

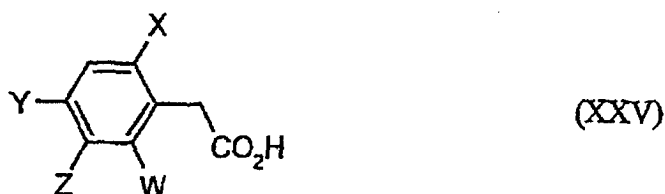
5 W, X, Y e Z têm os significados indicados acima e

Hal representa cloro ou bromo,

por exemplo, de acordo com Schotten-Baumann (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlim 1977, p. 505).

Os compostos da fórmula (XXII) são novos. Eles podem ser preparados de acordo com processos conhecidos, em princípio (vide, por exemplo, Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Vol. 8, p. 467-469 (1952)).

Os compostos da fórmula (XXII) são obtidos, por exemplo, reagindo-se ácidos fenilacéticos substituídos da fórmula (XXV)



15

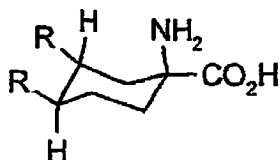
na qual

W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,

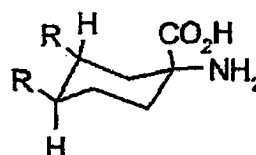
com agentes de halogenização (por exemplo, cloreto de tionila, brometo de tionila, cloreto de oxalila, fosgênio, tricloreto de fósforo, tribrometo de fósforo ou pentacloreto de fósforo), opcionalmente, na presença de diluente (por exemplo, opcionalmente, hidrocarbonetos alifáticos ou aromáticos, clorados, tal como tolueno ou cloreto de metileno), a temperaturas de -20°C a 150°C, preferivelmente, de -10°C e 100°C.

Os compostos da fórmula (XXI) e (XXIV) são em parte conhecidos e/ou podem ser produzidos de acordo com processos conhecidos (veja, por exemplo, Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, p. 11-22, 23-27 (1970)).

Os ácidos aminocarboxílicos cíclicos, substituídos, da fórmula (XXIV), nos quais A e B formam um anel, são obteníveis, em geral, de acordo com a síntese de Bucherer-Bergs ou de acordo com a síntese de Strecker e, nesse caso, apresentam-se, respectivamente em formas isoméricas diferentes. Desse modo, sob as condições da síntese de Bucherer-Bergs, obtém-se predominantemente os isômeros (doravante, por razões de simplificação, designadas como β), nos quais os radicais R e o grupo carboxila estão em posição equatorial, enquanto de acordo com as condições da síntese de Strecker, obtém-se, predominantemente, os isômeros, doravante, por razões de simplificação, designados como α), nos quais o grupo amino e os radicais R encontram-se em posição equatorial.



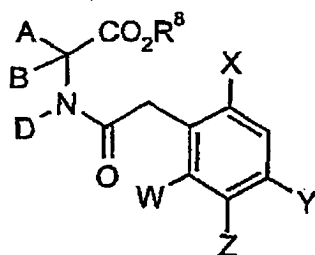
Síntese de Bucherer-Bergs
(isômeros β)



Síntese de Strecker
(isômeros α)

(L. Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975).

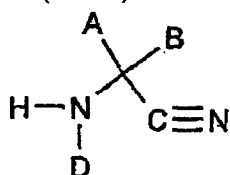
Além disso, os materiais básicos da fórmula (II)



(II)

na qual

A, B, D, W, X, Y, Z e R^8 têm os significados indicados acima, usados no processo (A) acima, podem ser produzidos quando se reage aminonitrilas da fórmula (XXVI)



(XXVI)

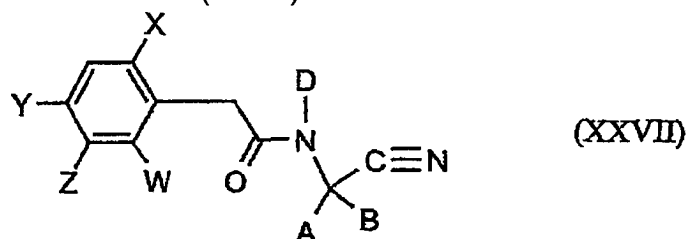
na qual

A, B e D têm os significados indicados acima,
com halogenetos de ácido fenilacético da fórmula (XXII)



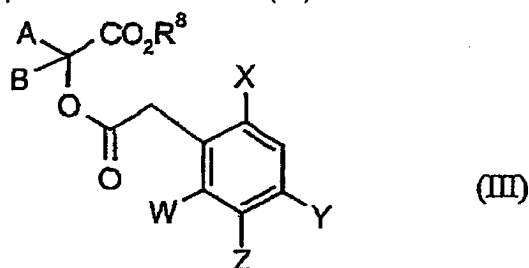
na qual

- 5 W, X, Y, Z e Hal têm os significados indicados acima,
para compostos da fórmula (XXVII)



na qual

- A, B, D, W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,
10 e subseqüentemente submete-se os mesmos a uma alcoólise ácida.
Os compostos da fórmula (XXVII) são igualmente novos.
Os compostos da fórmula (III)



na qual

- 15 A, B, W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima,
necessários como materiais básicas no processo B de acordo com a invenção,
são novos.

Em princípio, eles podem ser produzidos de acordo com métodos conhecidos.
20

Desse modo, obtém-se os compostos da fórmula (III), por exemplo, quando ésteres de ácido 2-hidroxicarboxílico da fórmula (XXVIII)



na qual

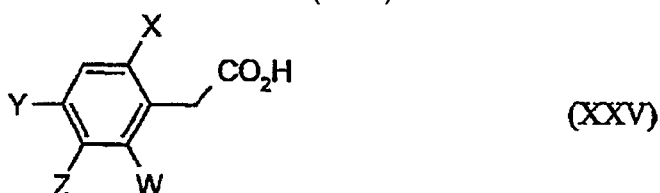
A, B e R^8 têm os significados indicados acima,
são acilados com halogenetos de ácido fenilacético substituídos da fórmula
5 (XXII)



na qual

W, X, Y, Z e Hal têm os significados indicados acima
(Chem. Reviews 52, 237-416 (1953)).

10 Além disso, obtém-se compostos da fórmula (III), quando ácidos
fenilacéticos substituídos da fórmula (XXV)



na qual

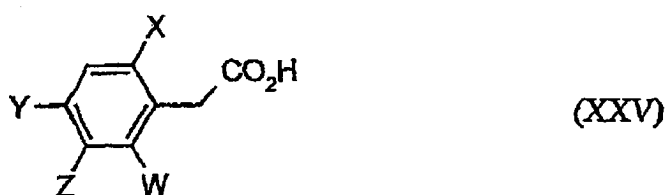
15 W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,
são alquilados com ésteres de ácido α -halogencarboxílico da fórmula (XXIX)



na qual

A, B e R^8 têm os significados indicados acima e
Hal representa cloro ou bromo.
20 Os compostos da fórmula (XXV) são novos.
Os compostos da fórmula (XXIX) podem ser adquiridos comercialmente.

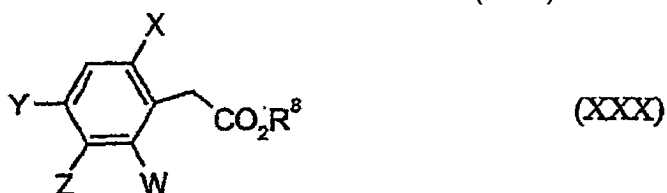
Por exemplo, obtém-se os compostos da fórmula (XXV)



na qual

W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,
e Y pode representar, além disso, $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$,

5 quando ésteres de ácido fenilacético da fórmula (XXX)

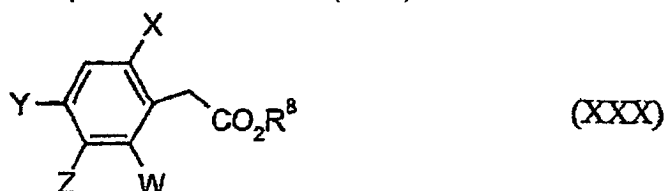


na qual

W, X, Y, Z e R^8 têm o significado indicado acima,
são saponificados na presença de ácidos ou bases, na presença de um sol-
10 vente, sob condições padrão, em geral conhecidas.

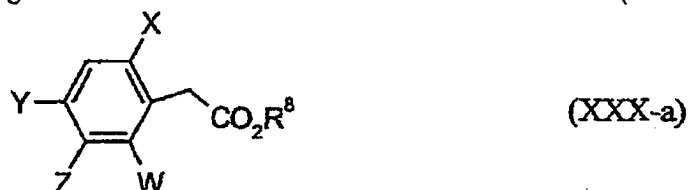
Os compostos da fórmula (XXX) são novos.

Os compostos da fórmula (XXX)



na qual

15 W, X, Y, Z e R^8 têm o significado indicado acima,
e Y pode representar, além disso, $-\text{C}\equiv\text{C}-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$,
são obtidos, por exemplo,
quando se reage ésteres de ácido fenilacético da fórmula (XXX-a)



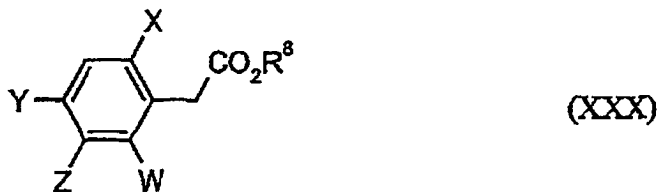
20 na qual

R^8 , W, X, Y e Z têm o significado indicado acima,

necessários como materiais básicos no processo (C) acima, são novos.

Eles podem ser produzidos de acordo com métodos, em princípio, conhecidos.

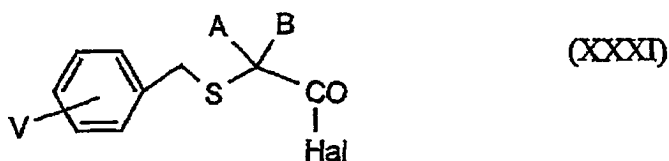
- 5 Os compostos da fórmula (IV) são obtidos, por exemplo, quando ésteres de ácido fenilacético substituídos da fórmula (XXX)



a qual

W, X, Y, R⁸ e Z têm os significados indicados acima,

- 10 são acilados com halogenetos de 2-benziltio ácido carboxílico da fórmula (XXXI)



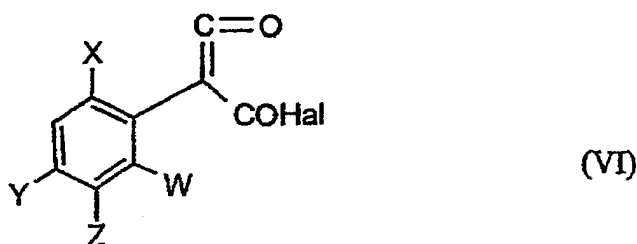
na qual

A, B e V têm os significados indicados acima e

- 15 Hal representa halogênio (particularmente, cloro ou bromo), na presença de bases fortes (veja, por exemplo, M.S. Chambers, E.J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228).

Os halogenetos de benziltio ácido carboxílico da fórmula (XXXI) são em parte conhecidos e/ou podem ser produzidos de acordo com processos conhecidos (J. Antibiotics (1983), 26, 1589).

- 20 Os cetenos de halogencarbonila da fórmula (VI), necessários como materiais básicos nos processos (D) e (E) acima são novos. Eles podem ser produzidos de maneira simples, de acordo com processos, em princípio, conhecidos (compare, por exemplo, Org. Prep. Proced. Int., 7 (4), 155-158, 1975 e DE 1 945 703). Desse modo, são obtidos, por exemplo, os compostos da fórmula (VI)
- 25



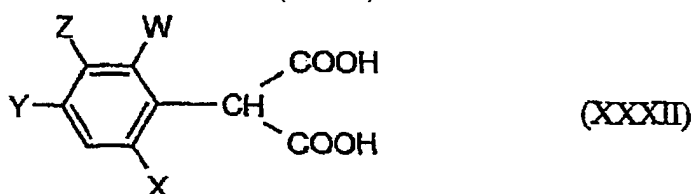
na qual

W, X, Y e Z têm os significados indicados acima e

Hal representa cloro ou bromo,

5 quando se reage

ácidos fenilmalônicos da fórmula (XXXII)



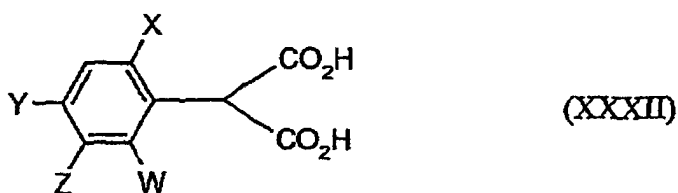
na qual

W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,

10 com halohalogenetos de ácido, tal como, por exemplo, cloreto de tionila, cloreto de fósforo(V), cloreto de fósforo(III), cloreto de oxalila, fosgênio ou brometo de tionila, opcionalmente, na presença de catalisadores, tal como, por exemplo, dimetilformamida, metil-estearilformamida ou trietilfosfina e, opcionalmente, na presença de bases, tal como, por exemplo, piridina ou trietilamina.

Os ácidos fenilmalônicos substituídos da fórmula (XXXII) são novos. Eles podem ser produzidos de modo simples de acordo com processos conhecidos (compare, por exemplo, Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlim 1977, p. 517 ss., EP-A-528 156, WO 96/35 664, WO 20 97/02 243, WO 97/01535, WO 97/36868 e WO 98/05638).

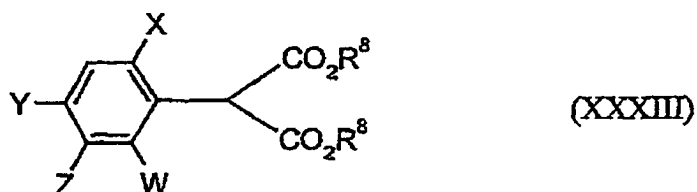
Desse modo, são obtidos ácidos fenilmalônicos da fórmula (XXXII)



na qual

W, X, Y e Z têm os significados indicados acima,
quando se saponifica, primeiramente, na presença de uma base e um sol-
vente, subsequente, se acidifica cuidadosamente

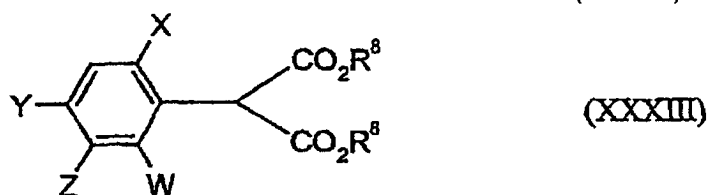
5 ésteres de ácido fenilmalônico da fórmula (XXXIII)



na qual

W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima
(EP-528 156, WO 96/35 664, WO 97 02 243).

10 Os ésteres de ácido malônico da fórmula (XXXIII)



na qual

W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima,
são em parte conhecidos.

15 Eles podem ser produzidos de acordo com os métodos em geral
conhecidos da química orgânica (compare, por exemplo, Tetrahedron Lett.
27, 2763 (1986), Organikum VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften,
Berlim, 1977, p. 587 ss., WO 96/35 664, WO 97/02 243, WO 97/01 535, WO
97/36 868, WO 98/05 638 e WO 99/47 525).

20 Os compostos de carbonila da fórmula (V)



na qual

A e D têm os significados indicados acima,
ou os sililéteres dos mesmos da fórmula (Va)



na qual

A, D e R^8 têm os significados indicados acima, necessários como materiais básicos para o processo (D) de acordo com a
 5 invenção, são compostos em geral conhecidos, que podem ser adquiridos comercialmente ou que são acessíveis de acordo com processos conhecidos.

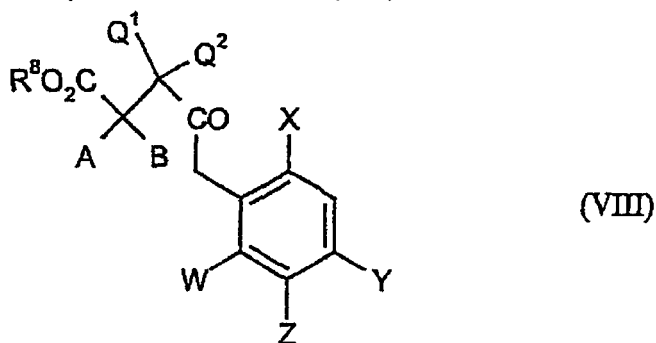
A produção dos cloretos de ácido cetênico da fórmula (VI), necessários como materiais básicos para realização do processo (E) de acordo
 10 com a invenção, já foram descritos acima. As tioamidas da fórmula (VII)



na qual

A tem o significado indicado acima, necessários para realização do processo (E) de acordo com a invenção, são
 15 compostos em geral conhecidos na química orgânica.

Os compostos da fórmula (VIII)



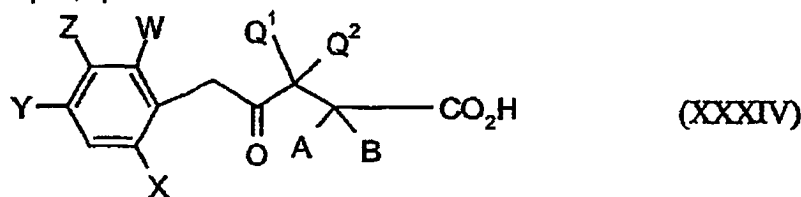
na qual

A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y, Z e R^8 têm os significados indicados acima, necessários como materiais básicos no processo (F) acima,
 20 são novos.

Eles podem ser produzidos de acordo com métodos em princípio conhecidos.

São obtidos éter de ácido 5-aryl-4-cetocarboxílico da fórmula (VII-

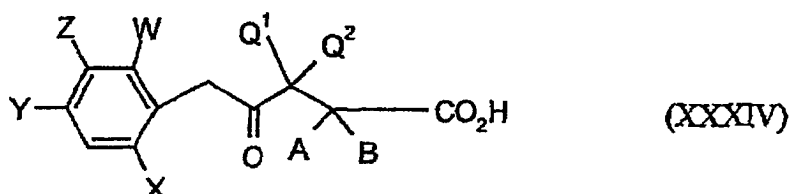
I), por exemplo, quando ácidos 5-aryl-4-cetocarboxílico da fórmula (XXXIV)



na qual

- W, X, Y, Z, A, B, Q¹ e Q² têm os significados indicados acima,
 5 são esterificados (compare, por exemplo, Organikum, 15ª edição, Berlim, 1977, página 499) ou alquilados (veja exemplo de produção).

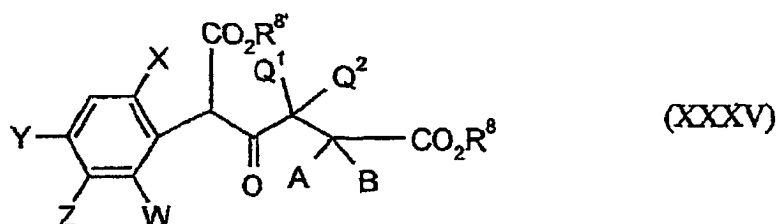
Os ácidos 5-aryl-4-cetocarboxílicos da fórmula (XXXIV)



na qual

- 10 A, B, Q¹, Q², W, X, Y e Z, têm os significados indicados acima, são novos, mas podem ser produzidos de acordo com métodos em princípio conhecidos (veja exemplo de produção).

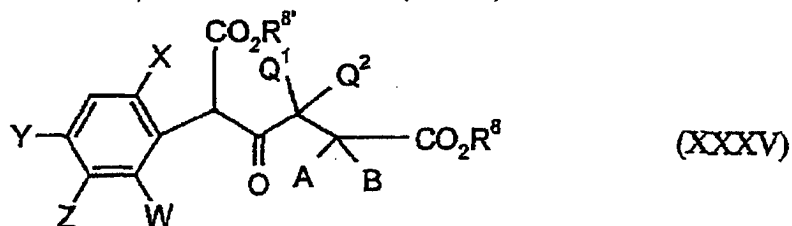
- Os ácidos 5-aryl-4-cetocarboxílicos da fórmula (XXXIV) são obtidos, por exemplo, quando 2-fenil-3-oxo-ésteres de ácido adípico da fórmula
 15 (XXXV)



na qual

- A, B, D¹, D², W, X, Y e Z têm os significados indicados acima e
 R⁸ e R⁸¹ representam alquila (particularmente, C₁-C₈-alquila) e no
 20 uso do composto da fórmula (XXXVII), R⁸ representa hidrogênio, são descarboxilados, opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de uma base ou ácido (compare, por exemplo, Organikum, 15ª edição, Berlim, 1977, página 519 a 521).

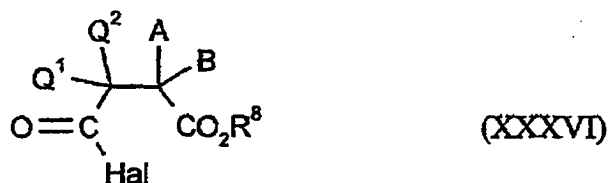
Os compostos da fórmula (XXXV)



na qual

A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R⁸ e R^{8'} têm os significados indicados
 5 acima e no uso do composto da fórmula (XXXVII), R⁸ representa hidrogênio,
 são novos.

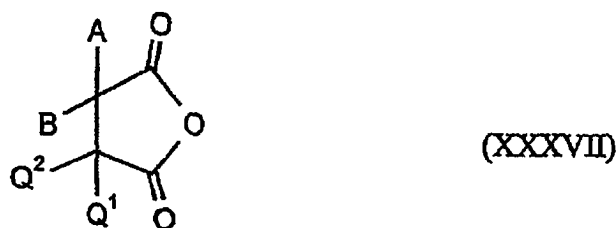
Os compostos da fórmula (XXXV) são obtidos, por exemplo,
 quando os cloretos de semi-ésteres de ácido dicarboxílico da
 fórmula (XXXVI)



10

na qual

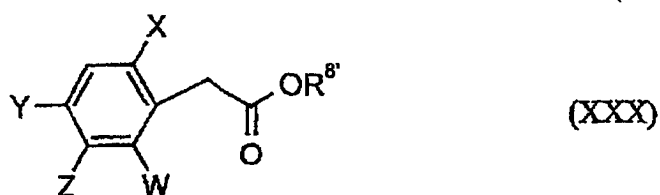
A, B, Q¹, Q² e R⁸ têm os significados indicados acima e
 Hal representa cloro ou bromo,
 ou os anidridos de ácido carboxílico da fórmula (XXXVII)



15

na qual

A, B, Q¹ e Q² têm os significados indicados acima,
 são acilados
 com um éster de ácido fenilacético da fórmula (XXX)



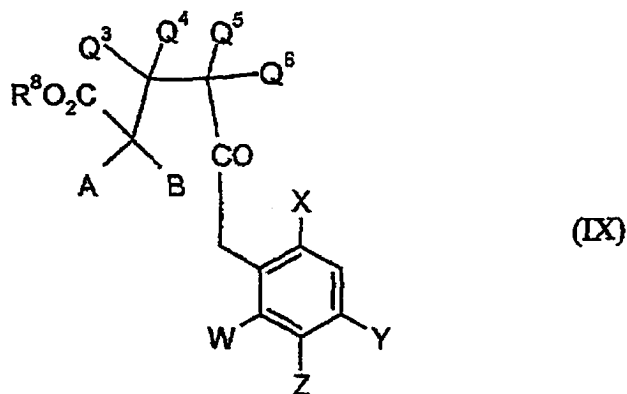
20

na qual

W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima,
na presença de um diluente e na presença de uma base (compare, por exemplo, M.S. Chambers, E.J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, comp. também os exemplos de produção).

5 Os compostos de fórmula (XXXVII) são compostos parcialmente conhecidos da química orgânica e/ou são produzidos, em princípio, por métodos conhecidos, de forma simples.

Os compostos da fórmula (IX)



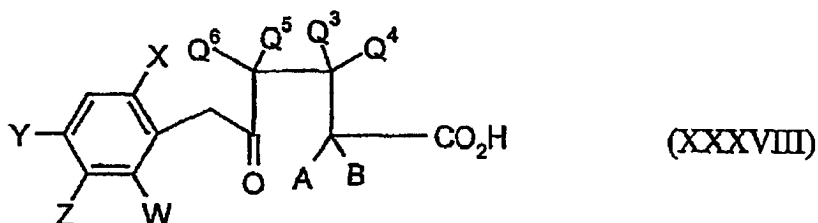
10

na qual

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z e R⁸ têm o significado indicado acima,
necessários como materiais básicos no processo (G) acima,
15 são novos.

Eles podem ser produzidos de acordo com métodos em princípio conhecidos.

Os ésteres de ácido 6-aryl-5-cetocarboxílico da fórmula (IX) são obtidos, por exemplo, quando ácidos 6-aryl-5-cetocarboxílicos da fórmula
20 (XXXVIII)



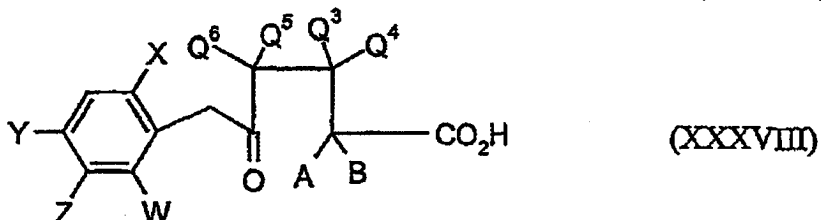
na qual

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm o significado indicado aci-

ma,

são esterificados (compare, por exemplo, Organikum, 15^a edição, Berlim, 1977, página 499).

Os ácidos 6-aryl-5-cetocarboxílicos da fórmula (XXXVIII)



5

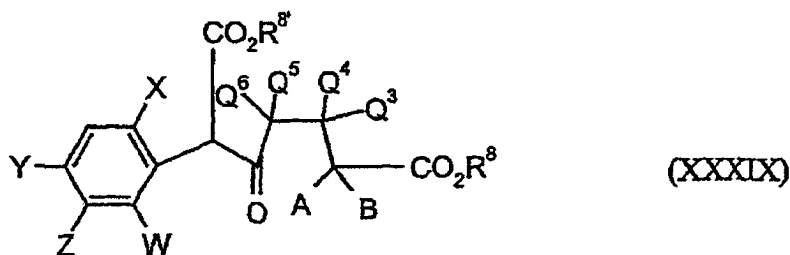
na qual

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm o significado indicado aci-

ma,

são novos. Eles podem ser produzidos de acordo com métodos em princípio

10 conhecidos, por exemplo, quando se saponifica e descarboxiliza 2-fenil-3-oxo-ésteres de diácido heptânico da fórmula (XXXIX)



na qual

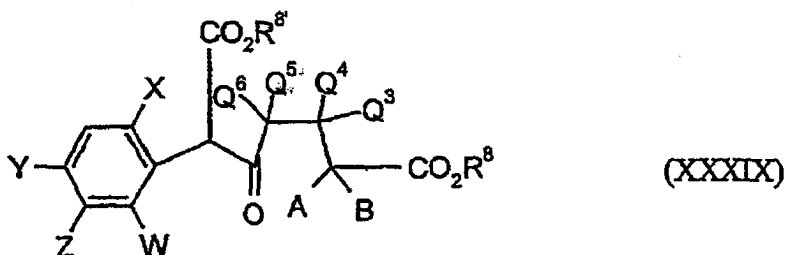
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y e Z têm o significado indicado aci-

15 ma, e

R⁸ e R^{8'} representam alquila (preferivelmente, C₁-C₆-alquila),

opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de uma base ou ácido (compare, por exemplo, Organikum, 15^a edição, Berlim, 1977, página 519 a 521).

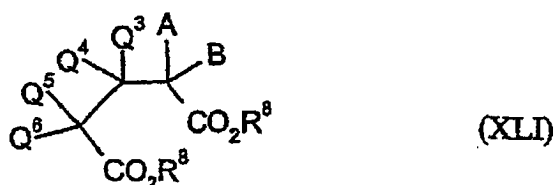
20 Os compostos da fórmula (XXXIX)



na qual

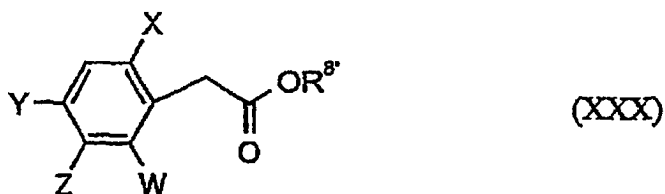
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R⁸ e R⁸ⁱ têm o significado indicado acima,

são novos e obtíveis quando se condensa ésteres de ácido dicarboxílico
5 da fórmula (XLI)



na qual

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶ e R⁸ têm o significado indicado acima,
com um éster de ácido fenilacético da fórmula (XXX)



10

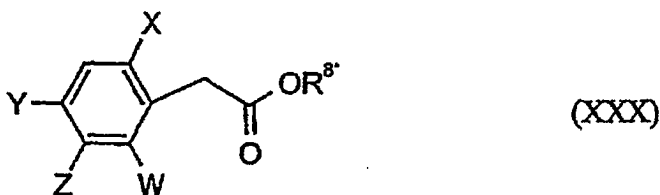
na qual

W, X, Y, Z e R⁸ⁱ têm o significado indicado acima,
na presença de um diluente e na presença de uma base.

Os compostos da fórmula (XLI) são em parte conhecidos e/ou
15 podem ser preparados de acordo com processos conhecidos.

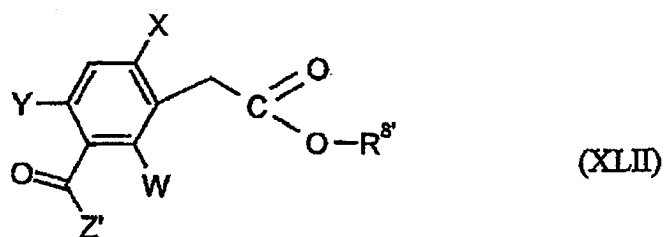
Os compostos da fórmula (XXX) já foram descritos nas etapas
preliminares para o processo (B) ou estão descritos explicitamente nos pro-
cessos (P) e (Q) a seguir.

(P) Desse modo, são obtidos, ainda, compostos da fórmula
20 (XXX)



na qual

W, X, Y, Z e R⁸ⁱ têm o significado indicado acima,
quando se reduz ésteres de ácido acilfenilfenilacético da fórmula (XLII)



na qual

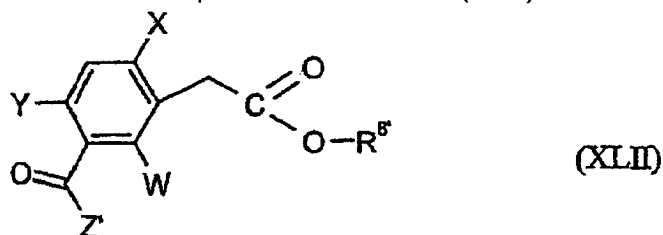
W, X, Y e R^8 têm o significado indicado acima e

Z' representa alquila,

- 5 opcionalmente na presença de um solvente, com agentes de reação apropriados (tal como, por exemplo, Zn/HCl, hidrogênio/catalisador, hidrazina/base).

Os compostos da fórmula (XLII) são novos.

São obtidos compostos da fórmula (XLII)

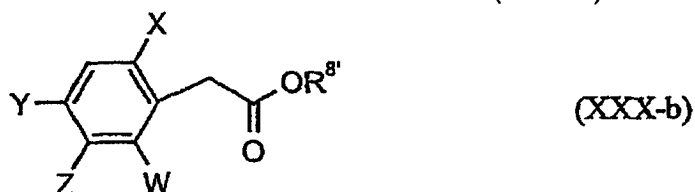


10

na qual

W, X, Y, Z' e R^8 têm o significado acima,

quando ésteres de ácido fenilacético da fórmula (XXX-b)



15 na qual

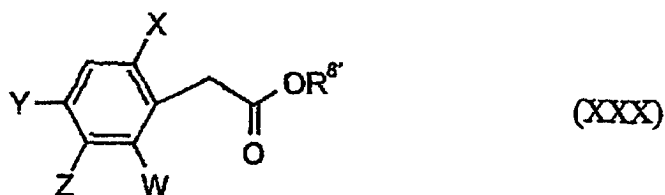
W, X, Y e R^8 têm o significado indicado acima e

Z representa hidrogênio,

- são acilados, opcionalmente na presença de um solvente, com um cloreto de ácido carboxílico ou anidrido de ácido carboxílico, na presença de um ácido ou ácido de Lewis (por exemplo, cloreto de alumínio, brometo de ferro(III)),
 20 de acordo com Fridel-Crafts.

Os compostos (XXX-b) são conhecidos ou podem ser produzidos de acordo com os processos descritos na literatura citada inicialmente.

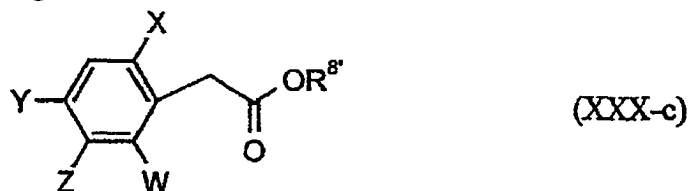
(Q) São obtidos, ainda, ésteres de ácido fenilacético da fórmula (XXX)



na qual

- 5 X representa alquila,
W, Y e Z representam hidrogênio ou alquila e
R^{8'} representa alquila,

quando deshalogeniza ésteres de ácido fenilacético da fórmula (XXX-c)



10 na qual

- X representa alquila,
R^{8'} representa alquila e

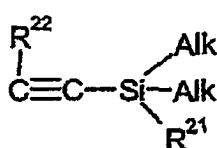
W, Y e Z podem representar, além de hidrogênio e alquila, também cloro ou bromo,

- 15 na presença de um solvente e na presença de um agente de redução (por exemplo, hidrogênio, na presença de um catalisador de metal nobre, tal como, por exemplo, paládio ou platina).

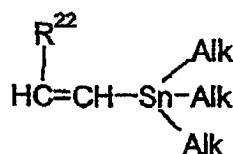
- Os compostos da fórmula (XXX-c) são conhecidos dos pedidos de patente citados inicialmente ou podem ser produzidos de acordo com os processos ali descritos.
- 20

- Os compostos das fórmulas (I-1'a) a (I-8'a), necessários como materiais básicos no processo (H) acima, nas quais A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W', X', Y' e Z' têm o significado indicado acima, são em parte conhecidos (WO 96/35 664), WO 97/02 243, WO 97/01535, WO 97/36868, WO 98/05638) ou podem ser produzidos de acordo com os processos ali descritos.
- 25

Os reagentes de conjugação da fórmula (X-a) e (X-b)



(X-a)



(X-b)

a qual

Alk, R²¹ e R²² têm o significado indicado acima,

podem, em parte ser adquiridos comercialmente ou podem ser produzidos

5 de acordo com processos em geral conhecidos.

Os halogenetos de ácido da fórmula (XI), anidridos de ácido carboxílico da fórmula (XII), ésteres de ácido clorofórmico ou tioésteres de ácido clorofórmico da fórmula (XIII), ésteres de ácido cloromonotiofórmico ou ésteres de ácido cloroditiofórmico da fórmula (XIV), cloretos de ácido sulfônico da fórmula (XV) compostos de fósforo da fórmula (XVI) e hidróxidos metálicos, alcóxidos metálicos ou aminas da fórmula (XVII) e (XVIII) e isocianatos da fórmula (XIX) e cloretos de ácido carbamídico da fórmula (XX), necessários, além disso, como materiais básicos para a realização dos processos (I), (J), (K), (L), (M), (N) E (O) de acordo com a invenção, são compostos em

10

15

geral conhecidos da química orgânica ou inorgânica.

Os compostos das fórmulas (V), (VII), (XI) a (XX), (XXI), (XXIV), (XXVI), (XXVIII), (XXIX), (XXXI), (XXXVI), (XXXVII) e (XLI), além disso, são conhecidos dos pedidos de patente citados inicialmente e/ou podem ser produzidos de acordo com os métodos ali indicados.

20 O processo (A) está caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (II), na qual A, B, D, W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima, são submetidos a uma condensação intramolecular, na presença de uma base.

No processo (A) de acordo com a invenção, podem ser usados

25

como diluentes todos os solventes orgânicos inertes. São utilizáveis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, éteres, tal como dibutiléter, tetrahydrofurano, dioxano, glicoldimetiléter e diglicoldimetiléter, além disso, solventes polares, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona, bem como álcoois, tal como metanol, etanol,

30

propanol, isopropanol, butanol, isobutanol e terc-butanol.

Como base (agentes de desprotonização) podem ser usados na realização do processo (A) de acordo com a invenção todos os aceitantes de prótons. São utilizáveis, preferivelmente, óxidos, hidróxidos e carbonatos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, tal como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, óxido de magnésio, óxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, que também podem ser usados na presença de catalisadores de transferência de fase, tal como, por exemplo, cloreto de trietilbenzilamônio, brometo de tetrabutilamônio, Adogen 464 (= cloreto de metiltrialquil(C₈-C₁₀)amônio) ou TDA 1 (= tris(metoxietoxietil)amina. Além disso, podem ser usados metais alcalinos, tal como sódio ou potássio. Além disso, são utilizáveis amidas e hidretos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tal como amida de sódio, hidreto de sódio e hidreto de cálcio, e além disso, também alcoolatos de metal alcalino, tal como metilato de sódio, etilato de sódio e terc-butilato de potássio.

15

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (A) de acordo com a invenção. Em geral, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 250°C, preferivelmente, entre 50°C e 150°C.

20 O processo (A) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

Na realização do processo (A) de acordo com a invenção utiliza-se, em geral, os componentes de reação da fórmula (II) e as bases de desprotonização em quantidades aproximadamente duplamente equimolares. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um excesso maior (de até 3 moles).

25 O processo (B) está caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (III), na qual A, B, W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima, são submetidos a uma condensação intramolecular, na presença de um diluente e na presença de uma base.

30

No processo (B) de acordo com a invenção, podem ser usados como diluentes todos os solventes orgânicos inertes. São utilizáveis, preferi-

velmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, éteres, tal como dibutiléter, tetrahidrofurano, dioxano, glicoldimetiléter e diglicoldimetiléter, além disso, solventes polares, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona. Além disso, podem ser usados álcoois, tal como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol e terc-butanol.

Como base (agentes de desprotonização) podem ser usados na realização do processo (B) de acordo com a invenção todos os aceitantes de prótons. São utilizáveis, preferivelmente, óxidos, hidróxidos e carbonatos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, tal como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, óxido de magnésio, óxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, que também podem ser usados na presença de catalisadores de transferência de fase, tal como, por exemplo, cloreto de trietilbenzilamônio, brometo de tetrabutilamônio, Adogen 464 (= cloreto de metiltrialquil(C₈-C₁₀)amônio) ou TDA 1 (= tris(metoxietoxietil)amina. Além disso, podem ser usados metais alcalinos, tal como sódio ou potássio. Além disso, são utilizáveis amidas e hidretos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tal como amida de sódio, hidreto de sódio e hidreto de cálcio, e além disso, também alcoolatos de metal alcalino, tal como metilato de sódio, etilato de sódio e terc-butilato de potássio.

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (A) de acordo com a invenção. Em geral, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 250°C, preferivelmente, entre 50°C e 150°C.

O processo (B) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

Na realização do processo (B) de acordo com a invenção utiliza-se, em geral, os componentes de reação da fórmula (III) e as bases de desprotonização em quantidades aproximadamente equimolares. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um excesso maior (de até 3 moles).

O processo (C) está caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (IV), na qual A, B, V, W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima, são ciclizados intramolecularmente, na presença de um ácido e, opcionalmente, na presença de um diluente.

5 No processo (C) de acordo com a invenção, podem ser usados como diluentes todos os solventes orgânicos inertes. São utilizáveis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, hidrocarbonetos halogenados, tal como diclorometano, clorofórmio, cloreto de etileno, clorobenzeno, diclorobenzeno, além disso, solventes polares, tal como dimetilsul-
10 fóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona. Além disso, podem ser usados álcoois, tal como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol e terc-butanol.

Opcionalmente, também o ácido usado pode servir como diluente.

15 Como ácido, podem ser usados no processo (C) de acordo com a invenção todos os ácidos inorgânicos e orgânicos usuais, tal como, por exemplo, ácido halogenídricos, ácido sulfúrico, ácidos alquil-, aril- e haloalquilsulfônicos, particularmente, ácidos alquilcarboxílicos halogenados, tal como, por exemplo, ácido trifluoracético.

20 As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (C) de acordo com a invenção. Em geral, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 250°C, preferivelmente, entre 50°C e 150°C.

25 O processo (A) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

Na realização do processo (C) de acordo com a invenção utiliza-se, em geral, os componentes de reação da fórmula (IV) e os ácidos, por exemplo, em quantidades equimolares. Porém, também é possível usar o ácido como solvente ou como catalisador.

30 O processo (D) de acordo com a invenção está caracterizado pelo fato de que compostos de carbonila da fórmula (V) ou os enoléteres do mesmo da fórmula (V-a) são reagidos com halogenetos de ácido cetênico da

fórmula (VI), na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aceitante de ácido.

No processo (D) de acordo com a invenção, podem ser usados como diluentes todos os solventes orgânicos inertes. São utilizáveis, preferi-
5 velmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, éteres, tal como dibutiléter, glicoldimetiléter e diglicoldimetiléter, além disso, solventes polares, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona.

Como aceitantes de ácido podem ser usados todos os aceitantes de ácido usuais, na realização da variante de processo (D) de acordo com a invenção.

São utilizáveis, preferivelmente, aminas terciárias, tal como trietilamina, piridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicycloundecano (DBU), diazabicyclononas (DBN), base de Hünig e N,N-dimetil-anilina.

15 As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (D) de acordo com a invenção. Convenientemente, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 250°C, preferivelmente, entre 50°C e 220°C.

O processo (D) de acordo com a invenção é realizado, convenientemente, sob pressão normal.

Na realização do processo (D) de acordo com a invenção utiliza-se os componentes de reação das fórmulas (V) e (VI), nas quais A, D, W, X, Y e Z têm o significado indicado acima e Hal representa halogênio, e, opcionalmente, os aceitantes de ácido, em geral, em quantidades aproximada-
25 mente equimolares. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um excesso maior (de até 5 moles).

O processo (E) de acordo com a invenção está caracterizado pelo fato de que tioamidas das fórmula (VII) são reagidas com halogenetos de ácido cetênico da fórmula (VI), na presença de um diluente e, opcional-
30 mente, na presença de um aceitante de ácido.

Na variante de processo (E) de acordo com a invenção, podem ser usados como diluentes todos os solventes orgânicos inertes. São utilizá-

veis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, éteres, tal como dibutiléter, glicoldimetiléter e diglicoldimetiléter, além disso, solventes polares, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona.

- 5 Como aceitantes de ácido podem ser usados todos os aceitantes de ácido usuais, na realização do processo (E) de acordo com a invenção.

São utilizáveis, preferivelmente, aminas terciárias, tal como trietilamina, piridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicycloundecano (DBU),
10 diazabicyclononas (DBN), base de Hünig e N,N-dimetil-anilina.

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (E) de acordo com a invenção. Convenientemente, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 250°C, preferivelmente, entre 20°C e 220°C.

- 15 O processo (E) de acordo com a invenção é realizado, convenientemente, sob pressão normal.

Na realização do processo (E) de acordo com a invenção utilizase os componentes de reação das fórmulas (VII) e (VI), nas quais A, W, X, Y e Z têm o significado indicado acima e Hal representa halogênio, e, opcio-
20 nalmente, os aceitantes de ácido, em geral, em quantidades aproximadamente equimolares. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um excesso maior (de até 5 moles).

O processo (F) está caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (VIII), na qual A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados
25 indicados acima, são submetidos a uma condensação intramolecular, na presença de uma base.

No processo (F) de acordo com a invenção, podem ser usados como diluentes todos os solventes orgânicos, inertes em relação aos parceiros de reação. São utilizáveis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, éteres, tal como dibutiléter, tetrahydrofurano, dioxano,
30 glicoldimetiléter e diglicoldimetiléter, além disso, solventes polares, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona. Além dis-

so, podem ser usados álcoois, tal como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol, terc-butanol.

Como bases (agentes de desprotonização) podem ser usados na realização do processo (F) de acordo com a invenção todos os aceitantes de prótons usuais. São utilizáveis, preferivelmente, óxidos, hidróxidos e carbonatos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, tal como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, óxido de magnésio, óxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, que também podem ser usados na presença de catalisadores de transferência de fase, tal como, por exemplo, cloreto de trietilbenzilamônio, brometo de tetrabutylamônio, Adogen 464 (= cloreto de metiltrialquil(C₈-C₁₀)amônio) ou TDA 1 (= tris(metoxietoxietil)amina. Além disso, podem ser usados metais alcalinos, tal como sódio ou potássio. Além disso, são utilizáveis amidas e hidretos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tal como amida de sódio, hidreto de sódio e hidreto de cálcio, e além disso, também alcoolatos de metal alcalino, tal como metilato de sódio, etilato de sódio e terc-butilato de potássio.

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (F) de acordo com a invenção. Convenientemente, trabalha-se a temperaturas entre -75°C e 250°C, preferivelmente, entre -50°C e 150°C.

O processo (F) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

Na realização do processo (F) de acordo com a invenção utilizam-se os componentes de reação da fórmula (VIII) e as bases desprotonizantes, em geral, em quantidades aproximadamente equimolares. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um excesso maior (de até 3 moles).

O processo (G) está caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (IX), na qual A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z e R⁸ têm os significados indicados acima, são submetidos a uma condensação intramolecular, na presença de bases.

No processo (G) de acordo com a invenção, podem ser usados como diluentes todos os solventes orgânicos, inertes em relação aos parceiros de reação. São utilizáveis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como tolueno e xileno, ainda, éteres, tal como tetrahidrofurano, dioxano, glicoldimetiléter e diglicoldimetiléter, além disso, solventes polares, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilformamida e N-metil-pirrolidona. Além disso, podem ser usados álcoois, tal como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, isobutanol e terc-butanol.

Como base (agentes de desprotonização) podem ser usados na realização do processo (G) de acordo com a invenção todos os aceitantes de prótons usuais.

São utilizáveis, preferivelmente, óxidos, hidróxidos e carbonatos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, tal como hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, óxido de magnésio, óxido de cálcio, carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, que também podem ser usados na presença de catalisadores de transferência de fase, tal como, por exemplo, cloreto de trietilbenzilamônio, brometo de tetrabutylamônio, Adogen 464 (= cloreto de metiltrialquil(C₈-C₁₀)amônio) ou TDA 1 (= tris(metoxietoxietil)amina. Além disso, podem ser usados metais alcalinos, tal como sódio o potássio. Além disso, são utilizáveis amidas e hidretos de metais alcalinos e de metais alcalino-terrosos, tal como amida de sódio, hidreto de sódio e hidreto de cálcio, e além disso, também alcoolatos de metal alcalino, tal como metilato de sódio, etilato de sódio e terc-butilato de potássio.

As temperaturas podem ser variadas dentro de uma ampla faixa na realização do processo (G) de acordo com a invenção. Em geral, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 250°C, preferivelmente, entre 50°C e 150°C.

O processo (G) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

Na realização do processo (G) de acordo com a invenção utiliza-se, em geral, os componentes de reação da fórmula (IX) e as bases de des-

protonização em quantidades aproximadamente equimolares. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um excesso maior (de até 3 moles).

Para realização do processo (H) de acordo com a invenção são
5 apropriados complexos de paládio(0) como catalisador. É preferido, por exemplo, tetraquis-(trifenilfosfino)paládio ou bis-(trifenilfosfino)-paládio-dicloreto/trifenilfosfino.

Como aceitantes de ácido, para realização do processo (H) de acordo com a invenção, são de interesse bases inorgânicas ou orgânicas.
10 Às mesmas pertencem, preferivelmente, hidróxidos, acetatos, carbonatos ou hidrogenocarbonatos de metais alcalino-terrosos ou de metais alcalinos, tal como, por exemplo, hidróxido de sódio, potássio, bário ou amônio, acetato de sódio, potássio, cálcio ou amônio, carbonato de sódio, potássio ou amônio, hidrogenocarbonato de sódio ou de potássio, fluoretos alcalinos, tal como,
15 por exemplo, fluoreto de cézio, bem como aminas terciárias, tal como trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbenzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolino, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononas (DBN) ou diazabicycloundeceno (DBU).

Como diluentes para a realização do processo (H) de acordo com a invenção, são de interesse água, solventes orgânicos e quaisquer misturas desejadas dos mesmos. Exemplificadamente, são citados: hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tal como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou dicalino; hidrocarbonetos halogenados, tal como, por exemplo,
25 cloreto de metileno, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano, tricloroetano ou tetracloreto de carbono; éteres, tal como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-t-amiléter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano, dietilenoglicol-dimetiléter ou anisol; álcoois, tal como metanol, etanol, n- ou i-propanol, n-, iso-, sec- ou terc-butanol, etanodiol, propan-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, monometiléter
30 fr dietilenoglicol, monometiléter de dietilenoglicol; água.

No processo (H) de acordo com a invenção, a temperatura de

reação pode ser variada dentro de uma ampla faixa. Em geral, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e +140°C, preferivelmente, entre 50°C e +100°C.

Na realização do processo (H) de acordo com a invenção, os reagentes de conjugação da fórmula (X-a) ou (X-b) e compostos das fórmulas (I-1'-a) a (I-8'-a) são usados na relação molar de 1:1 a 5:1, preferivelmente, 1:1 a 2:1. Do catalisador são usados, em geral, 0,005 a 0,5 mol, preferivelmente, 0,01 mol a 0,1 mol por mol dos compostos das fórmulas (I-1'-a) a (I-8'-a). A base é usada, em geral, com um excesso.

O processo (I- α) está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são reagidos, respectivamente, com halogenetos de ácido carboxílico da fórmula (XI), opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

Como diluentes, podem ser usados no processo (I- α) de acordo com a invenção todos os solventes inertes em relação aos halogenetos de ácido. São utilizáveis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como benzina, benzeno, tolueno, xileno e tetralina, ainda, hidrocarbonetos halogenados, tal como cloreto de metileno, clorofórmio, tetraclorocarbono, clorobenzeno e o-diclorobenzeno, além disso, cetonas, tal como acetona e metilisopropilcetona, ainda, éteres, tal como dietiléter, tetrahidrofurano e dioxano, além disso, ésteres de ácido carboxílico, tal como acetato de etila, e também solventes fortemente polares, tal como dimetilsulfóxido e sulfolano. Se a estabilidade de hidrólise do halogeneto de ácido o permitir, a reação também pode ser realizada na presença de água.

Como aglutinantes de ácido, na reação de acordo com o processo (I- α) de acordo com a invenção são de interesse todos os aceitantes de ácido usuais. São utilizáveis, preferivelmente, aminas, tal como trietilamina, piridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabicicoundeceno (DBU), diazabiciclononas (DBN), base de Hünig e N,N-dimetil-anilina, ainda, óxidos de metais alcalino-terrosos, tal como óxido de magnésio e óxido de cálcio, além disso, carbonatos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, tal como carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, bem como hidróxidos alcalinos, tal como hidróxido de sódio e hidróxido de potássio.

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa no processo (I- α) de acordo com a invenção. Em geral, trabalha-se com temperaturas entre -20°C e +150°C, preferivelmente, entre 0°C e 100°C.

5 Na realização do processo (I- α) de acordo com a invenção, os materiais básicos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) e o halogeneto de ácido carboxílico da fórmula (XI) são usados, em geral, em quantidades respectivamente aproximadamente equivalentes. Porém, também é possível usar o halogeneto de ácido carboxílico em um excesso maior (de até 5 moles). O
10 acabamento se dá de acordo com métodos usuais.

O processo (I- β) está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são reagidos com anidridos de ácido carboxílico da fórmula (XII), opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

15 Como diluentes podem ser usados no processo (I- β) de acordo com a invenção, preferivelmente, aqueles diluentes, que também são preferivelmente de interesse no uso de halogenetos de ácido. Aliás, também um anidrido de ácido carboxílico usado em excesso pode servir, simultaneamente, como diluente.

20 Como aglutinantes de ácido opcionalmente adicionados, são de interesse no processo (I- β), preferivelmente, aqueles aglutinantes de ácido, que também são preferivelmente de interesse no uso e halogenetos de ácido.

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma
25 ampla faixa no processo (I- β) de acordo com a invenção. Em geral, trabalha-se com temperaturas entre -20°C e +150°C, preferivelmente, entre 0°C e 100°C.

Na realização do processo (I- β) de acordo com a invenção, os materiais básicos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) e o anidrido de ácido carboxílico da fórmula (XII) são usados, em geral, em quantidades respectivamente
30 aproximadamente equivalentes. Porém, também é possível usar o anidrido de ácido carboxílico em um excesso maior (de até 5 moles). O acabamento

se dá de acordo com métodos usuais.

Em geral, procede-se de tal modo que o diluente e anidrido de ácido carboxílico, existente em excesso, bem como o ácido carboxílico formado, são removidos por destilação ou por lavagem com um solvente orgânico ou com água.

O processo (J) está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são respectivamente reagidos com ésteres de ácido clorofórmico ou tiolésteres de ácido clorofórmico da fórmula (XIII), opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

Como aglutinantes de ácido, na reação de acordo com o processo (J) de acordo com a invenção são de interesse todos os aceitantes de ácido usuais. São utilizáveis, preferivelmente, aminas, tal como trietilamina, piridina, DABCO, DBU, DBA, base de Hünig e N,N-dimetil-anilina, ainda, óxidos de metais alcalino-terrosos, tal como óxido de magnésio e óxido de cálcio, além disso, carbonatos de metais alcalinos e alcalino-terrosos, tal como carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, bem como hidróxidos alcalinos, tal como hidróxido de sódio e hidróxido de potássio.

Como diluentes, podem ser usados no processo (J) de acordo com a invenção todos os solventes inertes em relação aos ésteres de ácido clorofórmico ou tiolésteres de ácido clorofórmico. São utilizáveis, preferivelmente, hidrocarbonetos, tal como benzina, benzeno, tolueno, xileno e tetralina, ainda, hidrocarbonetos halogenados, tal como cloreto de metileno, clorofórmio, tetraclorohidrocarboneto, clorobenzeno e o-diclorobenzeno, além disso, cetonas, tal como acetona e metilisopropilcetona, ainda, éteres, tal como dietiléter, tetrahidrofurano e dioxano, além disso, ésteres de ácido carboxílico, tal como acetato de etila, e também solventes fortemente polares, tal como dimetilsulfóxido e sulfolano.

As temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma ampla faixa no processo (J) de acordo com a invenção. Trabalhando-se na presença de um diluente e de um aglutinante de ácido, então as temperatu-

ras de reação situam-se, em geral, entre -20°C e $+100^{\circ}\text{C}$, preferivelmente, entre 0°C e 50°C .

O processo (J) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

5 Na realização do processo (J) de acordo com a invenção, os materiais básicos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) e o éster de ácido clorofórmico ou tioléster de ácido clorofórmico correspondente da fórmula (XIII) são usados, em geral, em quantidades respectivamente aproximadamente equivalentes. Porém, também é possível usar um ou outro componente em um
10 excesso maior (de até 2 moles). O acabamento se dá de acordo com métodos usuais. Em geral, procede-se de tal modo que sais precipitados são removidos e a mistura de reação restante é concentrada por retirada do diluente.

O processo (K) de acordo com a invenção está caracterizado
15 pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são respectivamente reagidos com compostos da fórmula (XIV), opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

No processo de produção (K), utiliza-se por mol de composto básico das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) aproximadamente 1 mol de éster de ácido cloromonotiofórmico ou éster de ácido cloroditiofórmico da fórmula (XIV),
20 a temperaturas de 0 a 120°C , preferivelmente, a 20 a 60°C .

Como diluentes, opcionalmente adicionados, são de interesse todos os solventes orgânicos, polares, tal como éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos, mas também halogenoalcanos.

25 São usados, preferivelmente, dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida ou cloreto de metileno.

Se em uma forma de realização preferida, for produzido, por adição de fortes agentes de desprotonização, tal como, por exemplo, hidreto de sódio ou butilato terciário de potássio, o sal de enolato dos compostos (I-1-a)
30 a (I-7-a), pode ser dispensada a adição adicional de aglutinantes de ácido.

Se forem usados aglutinantes de ácido, então são de interesse bases inorgânicas ou orgânicas, por exemplo, são citados, hidróxido de só-

dio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, piridina, trietilamina.

A reação pode ser realizada à pressão normal ou sob pressão alta, preferivelmente, trabalha-se à pressão normal. O acabamento se dá de acordo com métodos usuais.

5 O processo (L) de acordo com a invenção está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são respectivamente reagidos com cloretos de ácido sulfônico da fórmula (XV), opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

10 No processo de produção (L), utiliza-se por mol de composto básico das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) aproximadamente 1 mol de cloreto de ácido sulfônico da fórmula (XV), a temperaturas de -20 a 150°C, preferivelmente, a 20 a 70°C.

Como diluentes, opcionalmente adicionados, são de interesse 15 todos os solventes orgânicos, polares, tal como éteres, amidas, nitrilas, sulfonas, sulfóxidos, ou hidrocarbonetos halogenados, tal como cloreto de metileno.

São usados, preferivelmente, dimetilsulfóxido, tetrahydrofurano, dimetilformamida ou cloreto de metileno.

20 Se em uma forma de realização preferida, for produzido, por adição de fortes agentes de desprotonização (tal como, por exemplo, hidreto de sódio ou butilato terciário de potássio), o sal de enolato dos compostos (I-1-a) a (I-7-a), pode ser dispensada a adição adicional de aglutinantes de ácido.

Se forem usados aglutinantes de ácido, então são de interesse 25 bases inorgânicas ou orgânicas, por exemplo, são citados, hidróxido de sódio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, piridina, trietilamina.

A reação pode ser realizada à pressão normal ou sob pressão alta, preferivelmente, trabalha-se à pressão normal. O acabamento se dá de acordo com métodos usuais.

30 O processo (M) de acordo com a invenção está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são respectivamente reagidos com compostos de fósforo da fórmula (XVI), opcionalmente, na

presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

No processo de produção (M), reage-se, para obtenção dos compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a), para 1 mol dos compostos (I-1-a) a (I-7-a), 1 a 2, preferivelmente, 1 a 1,3 mol do composto de fósforo da fórmula (XVI), a temperaturas entre -40°C e 150°C, preferivelmente, entre -10 e 110°C.

Como diluentes, opcionalmente adicionados, são de interesse todos os solventes orgânicos, polares, tal como éteres, amidas, nitrilas, álcoois, sulfetos, sulfonas, sulfóxidos etc..

São usados, preferivelmente, acetonitrila, dimetilsulfóxido, tetra-hidrofurano, dimetilformamida, cloreto de metileno.

Como aglutinantes de ácido, opcionalmente adicionados, são de interesse bases inorgânicas ou orgânicas usuais, tal como hidróxidos, carbonatos ou amidas. Exemplificadamente, são citados, hidróxido de sódio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, piridina, trietilamina.

A reação pode ser realizada à pressão normal ou sob pressão alta, preferivelmente, trabalha-se à pressão normal. O acabamento se dá de acordo com métodos usuais da química orgânica. A purificação dos produtos finais formados se dá, preferivelmente, por cristalização, purificação cromatográfica ou pela chamada "destilação", isto é, a remoção dos componentes voláteis no vácuo.

O processo (N) está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são reagidos com hidróxidos metálicos ou alcóxidos metálicos da fórmula (XVII) ou aminas da fórmula (XVIII), opcionalmente na presença de um diluente.

Como diluente, podem ser usados no processo (N) de acordo com a invenção, preferivelmente, éteres, tal como tetrahidrofurano, dioxano, dietiléter ou então álcoois, tal como metanol, etanol, isopropanol, mas também água.

O processo (N) de acordo com a invenção é realizado, em geral, sob pressão normal.

As temperaturas de reação situam-se, em geral, entre -20°C e 100°C, preferivelmente, entre 0°C e 50°C.

O processo (O) de acordo com a invenção está caracterizado pelo fato de que compostos das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) são reagidos, respectivamente, com (O- α) compostos da fórmula (XIX), opcionalmente, na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um catalisador, ou (O- β) com compostos da fórmula (XX), opcionalmente na presença de um diluente e, opcionalmente, na presença de um aglutinante de ácido.

No processo de produção (O- α), reage-se por mol de composto básico das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a) aproximadamente 1 mol de isocianato da fórmula (XIX), a 0 a 100°C, preferivelmente, a 20 a 50°C.

Como diluentes, opcionalmente adicionados, são de interesse todos os solventes orgânicos, inertes, tal como éteres, amidas, nitrilas, sulfonas, sulfóxidos.

Opcionalmente, podem ser adicionados catalisadores para aceleração da reação. Como catalisadores podem ser usados, de modo muito vantajoso, compostos orgânicos de estanho, tal como, por exemplo, dilaurato de dibutilestanho. Trabalha-se, preferivelmente, à pressão normal.

No processo de produção (O- β), reage-se por mol de composto básico das fórmulas (I-1-a) a (I-7-a), aproximadamente 1 mol de cloreto de ácido carbamídico da fórmula (XX), a -20 a 150°C, preferivelmente, a 0 a 70°C.

Como diluentes, opcionalmente adicionados, são de interesse todos os solventes orgânicos, inertes, tal como éteres, amidas, sulfonas, sulfóxidos ou hidrocarbonetos halogenados.

Preferivelmente, são usados dimetilsulfóxido, tetrahidrofurano, dimetilformamida ou cloreto de metileno.

Se em uma forma de realização preferida, for produzido, por adição de fortes agentes de desprotonização (tal como, por exemplo, hidreto de sódio ou butilato terciário de potássio), o sal de enolato dos compostos (I-1-a) a (I-7-a), pode ser dispensada a adição adicional de aglutinantes de ácido.

Se forem usados aglutinantes de ácido, então são de interesse

bases inorgânicas ou orgânicas usuais, exemplificadamente, são citados hidróxido de sódio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, trietilamina ou piridina.

5 A reação pode ser realizada à pressão normal ou sob pressão alta, preferivelmente, trabalha-se à pressão normal. O acabamento se dá de acordo com métodos usuais.

A uma boa compatibilidade com plantas e toxicidade favorável para animais de sangue quente, as substâncias ativas são apropriadas para combate de pragas animais, particularmente insetos, aracnídeos e nematói-
 10 des, que se apresentam na agricultura, na silvicultura, na proteção de produtos armazenados e na proteção e materiais, bem como no setor de higiene. Elas podem ser usadas, preferivelmente, coo agentes de proteção para plantas. Elas são eficazes contra espécies normalmente sensíveis e resistentes, bem como todos os estágios de desenvolvimento ou estágios de desenvol-
 15 vimento individuais. Às pragas mencionadas acima pertencem:

Da ordem dos Isopoda, por exemplo, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Da ordem dos Diplopoda, por exemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Da ordem dos Chilopoda, por exemplo, *Geophilus carpophagus*,
 20 *Scutigera* spp..

Da ordem dos Symmphylla, por exemplo, *Scutigerella immacula-
 ta*.

Da ordem dos Thysanura, por exemplo, *Lepisma saccharina*.

Da ordem dos Collembola, por exemplo, *Onychiurus armatus*.

25 Da ordem dos Orthoptera, por exemplo, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

Da ordem dos Blattaria, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

30 Da ordem dos Dermaptera, por exemplo, *Forficula auricularia*.

Da ordem dos Isoptera, por exemplo, *Reticulitermes* spp..

Da ordem dos Phthiraptera, por exemplo, *Pediculus humanus*

corporis, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..

Da ordem dos Thysanoptera, por exemplo, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis*.

- 5 Da ordem dos Heteroptera, por exemplo, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp..

- Da ordem dos Homoptera, por exemplo, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*,
10 *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..
15

- Da ordem dos Lepidoptera, por exemplo, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hypomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrostis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila psuedospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.
20
25

- Da ordem dos Coleoptera, por exemplo, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hy-*
30

pera postica, Dermestes spp., Trogoderma spp., Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp, Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica,
 5 Lissorhoptrus oryzophilus.

Da ordem dos Hymenoptera, por exemplo, Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

Da ordem dos Diptera, por exemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp, Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..
 10

Da ordem dos Siphonaptera, por exemplo, Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..
 15

Da classe dos Arachnida, por exemplo, Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..
 20

Aos nematóides parasitários de plantas pertencem, por exemplo, Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..
 25

Os compostos de acordo com a invenção também podem ser usados, opcionalmente, em determinadas concentrações ou quantidades de aplicação, como herbicidas e microbicidas, por exemplo, como fungicidas, antimicóticos e bactericidas. Opcionalmente, eles também podem ser usados como produtos intermediários ou precursores para a síntese de outras
 30

substâncias ativas.

As substâncias ativas podem ser transformadas nas formulações usuais, tal como soluções, emulsões, pós de pulverização, suspensões, pós, agentes de polvilhamento, pastas, pós solúveis, granulados, concentrados
5 de suspensão-emulsão, materiais naturais e sintéticos, impregnados com substância ativa, bem como encapsulamentos finos em materiais poliméricos.

Essas formulações são preparadas de maneira conhecida, por exemplo, por mistura das substâncias ativas com diluentes, portanto, solventes líquidos e/ou veículos sólidos, opcionalmente, sob uso de agentes tenso-
10 ativos, portanto, emulsificantes e/ou agentes de dispersão e/ou agentes formadores de espuma.

No caso do uso de água como diluente, também podem ser usados solventes orgânicos, como solventes auxiliares. Como solventes líquidos são substancialmente de interesse: aromatos, tal como xileno, tolueno,
15 ou alquilnaftalinas, aromatos clorados e hidrocarbonetos alifáticos, clorados, tal como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno, hidrocarbonetos alifáticos, tal como ciclohexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, óleos minerais e vegetais, álcoois, tal como butanol ou glicol, bem
20 como éteres e ésteres dos mesmos, cetonas, tal como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona ou ciclohexanona, solventes fortemente polares, tal como dimetilformamida e dimetilsulfóxido, bem como água.

Como veículos sólidos são de interesse: por exemplo, sais de amônio e farinhas de pedra naturais, tal como caulins, terras argilosas, talco,
25 carbonato de cálcio, quartzo, atapulguita, montmorilonita ou terra diatomácia, e farinhas de pedra sintética, tal como ácido silícico altamente disperso, óxido de alumínio e silicatos, como veículos sólidos para granulados são de interesse: pedras naturais, trituradas e fracionadas, tal como calcita, mármore, pedra-pomes, sepiolita, dolomita, bem como granulados sintéticos de
30 farinhas inorgânicas e orgânicas, bem como granulados de material orgânico, tal como farelo de serragem, cascas de coco, espigas de milho e hastes de tabaco; como agentes emulsificantes e/ou formadores de espuma são de

interesse: por exemplo, emulsificantes não-ionógenos e aniônicos, tal como ésteres de ácido graxo de polioxietileno, éteres de ácido graxo de polioxietileno, por exemplo, poliglicoléter de alquilarila, sulfonatos de alquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de arila, bem como hidrolisados de proteína; como a-

5 agentes de dispersão são de interesse: por exemplo, lixívia de lignina-sulfito e metilcelulose.

Nas formulações podem ser usados agentes de adesividade, tal como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos, em forma de pó, de grãos ou látex, tal como goma arábica, polivinilálcool, polivinilacetato,

10 bem como fosfolipídios naturais, tal como cefalinas e lecitinas, e fosfolipídios sintéticos. Outros aditivos podem ser óleos minerais e vegetais.

Podem ser usados corantes, tal como pigmentos inorgânicos, por exemplo, óxido de ferro, óxido de titânio, azul ferro-ciano, e corantes orgânicos, tal como corantes de alizarina, azóicos e metalftalociânicos e nutri-

15 entes de vestígio, tal como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

As formulações contêm, em geral, entre 0,1 e 95% em peso de substância ativa, preferivelmente, entre 0,5 e 90%.

A substância ativa de acordo com a invenção pode se apresentar em suas formulações correntes no comércio, bem como nas formas de aplicação preparadas dessas formulações, em mistura com outras substâncias ativas, tal como inseticidas, iscas, esterilizadores, bactericidas, acarici-

20 das, nematocidas, fungicidas, substâncias reguladores de crescimento ou herbicidas. Nos inseticidas estão incluídos, por exemplo, ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, ésteres de ácido carboxílico, hidrocarbonetos clorados, feniluréias, materiais produzidos por microorganismos, entre outros.

25

Parceiros de reação particularmente favoráveis são, por exemplo, os seguintes:

Fungicidas:

30 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-potássio, Androprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin,

Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-

isobutyl, Bialaphos, binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blastacidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

Polissulfeto de cálcio, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon,
 5 Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,

Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrithione, Ditalimfos,
 10 Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,

Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol, Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fenciclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetato, Fentinhidróxido, Ferbam, Ferimzon, Fluazinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Alumínio, Fosetyl-Sódio, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxila, Furametpyr,
 15 Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Furmecyclox,

Guazatin, Hexaclorobenzeno, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminooctadinealbesilat, Iminooctadinetriacetato, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodiona, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovalediona,
 20

Kasugamycin, Kresoxim-metila, preparações de cobre, tal como, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxicloreto de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, cobre de oxina e mistura de Bordeaux.
 25

Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzona, Mepanipyrim, Meppronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomyacin, Myclobutanil, Myclozolin,

Dimetilditiocarbamato de níquel, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, ácido oxolínico, Oxycarboxim, Oxyfenthiin,
 30

Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdi-

- phen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosina-sódio, Propiconazol, Propineb, P-yrázophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon, Pyroxyfur,
- Quinconazol, Quintozen (PCNB),
- 5 Enxofre e preparações de enxofre,
- Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicyofen, Thifluzamide, Thiphanato-metila, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-metila, Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol, Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
- 10 Uniconazol,
- Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,
- Zarilamid, Zineb, Ziram, bem como
- Dagger G,
- OK-8705,
- 15 OK-8801,
- α -(1,1,-dimetiletil)- β -(2-fenoxietil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
- α -(2,4-diclorofenil)- β -flúor-b-propil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
- α -(2,4-diclorofenil)- β -metóxi-a-metil-1H-1,2,4-triazol-1-etanol,
- α -(5-metil-1,3-dioxan-5-il)- β -[[4-(trifluormetil)-fenil]-metileno]-1H-
- 20 1,2,4-triazol-1-etanol,
- (5RS,6RS)-6-hidróxi-2,2,7,7,-tetrametil-5-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-3-octanona,
- (E)-a-(metoxiimino)-N-metil-2-fenóxi-fenilacetamida,
- {2-metil-1-[[1-(4-metilfenil)-etil]-amino]-carbonil}-propil}-ácido
- 25 carbamínico-1-isopropiléster,
- 1-(2,4-diclorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-etanona-O-(fenilmetil)-oxima,
- 1-(2-metil-1-naftalenil)-1H-pirol-2,5-diona,
- 1-(3,5-diclorofenil)-3-(2-propenil)-2,5-pirrolidindiona,
- 30 1-[(diiodometil)-sulfonil]-4-metil-benzeno,
- 1-[[2-(2,4-diclorofenil)-1,3-dioxolan-2-il]-metil]-1H-imidazol,
- 1-[[2-(4-clorofenil)-3-feniloxiranil]-metil]-1H-1,2,4-triazol,

- 1-[1-[2-(2,4-diclorofenil)-metóxi]-fenil]-etenil]-1H-imidazol,
 1-metil-5-nonil-2-(fenilmetil)-3-pirrolidinol,
 2',6'-dibromo-2-metil-4'-trifluormetóxi-4'-trifluor-metil-1,3-tiazol-5-
 carboxanilida,
- 5 2,2-dicloro-N-[1-(4-clorofenil)-etil]-1-etil-3-metil-
 ciclopropanocarboxamida,
 2,6-dicloro-5-(metiltio)-4-pirimidinil-tiocianato,
 2,6-dicloro-N-(4-trifluormetilbenzil)-benzamida,
 2,6-dicloro-N-[[4-(trifluormetil)-fenil]-metil]-benzamida,
- 10 2-(2,3,3-triiodo-2-propenil)-2H-tetrazol,
 2-[(1-metiletil)-sulfonil]-5-(triclorometil)-1,3,4-tiadiazol,
 2-[[6-deóxi-4-O-(4-O-metil-β-D-glicopiranosil)-α-D-
 glucopiranosil]-amino]-4-metóxi-1H-pirrol[2,3-d]pirimidin-5-carbonitrila,
 2-aminobutano,
- 15 2-bromo-2-(bromometil)-pentanodinitrila,
 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-
 piridincarboxamida,
 2-cloro-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(isotiocianatometil)-acetamida,
 2-fenilfenol (OPP),
- 20 3,4-dicloro-1-[4-(difluormetóxi)-fenil]-1H-pirrol-2,5-diona,
 3,5-dicloro-N-[ciano[(1-metil-2-propinil)-óxi]-metil]-benzamida,
 3-(1,1-dimetilpropil-1-oxo-1H-indeno-2-carbonitrila,
 3-[2-(4-clorofenil)-5-etóxi-3-isoxazolidinil]-piridina,
 4-cloro-2-ciano-N,N-dimetil-5-(4-metilfenil)-1H-imidazol-1-
- 25 sulfonamida,
 4-metil-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-ona,
 8-(1,1-dimetiletil)-N-etil-N-propil-1,4-dioxaspiro[4.5]decano-2-
 metanamina,
 8-hidroxiquinolinsulfato,
- 30 9H-xanteno-9-ácido carboxílico-2-[(fenilamino)-carbonil]-
 hidrazida,
 bis-(1-metiletil)-3-metil-4-[(3-metilbenzoil)-óxi]-2,5-

- tiofendicarboxilato,
 cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol,
 cis-4-[3-[4-(1,1-dimetilpropil)-fenil-2-metilpropil]-2,6-dimetil-
 morfolina-hidrocloreto,
 5 etil-[(4-clorofenil)-azo]-cianoacetato,
 hidrogenocarbonato de potássio,
 metantetratiol-sal de sódio,
 metil-1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-
 carboxilato,
 10 metil-N-(2,6-dimetilfenil)-N-(5-isoxazolilcarbonil)-DL-alaninato,
 metil-N-(cloroacetil)-N-(2,6-dimetilfenil)-DL-alaninato,
 N-(2,3-dicloro-4-hidroxifenil)-1-metil-ciclohexanocarboxamida,
 N-(2,6-dimetilfenil)-2-metóxi-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanil)-
 acetamida,
 15 N-(2,6-dimetilfenil)-2-metóxi-N-(tetrahydro-2-oxo-3-tienil)-
 acetamida,
 N-(2-cloro-4-nitrofenil)-4-metil-3-nitro-benzenossulfonamida,
 N-(4-ciclohexilfenil)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pirimidinamina,
 N-(4-hexilfenil)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pirimidinamina,
 20 N-(5-cloro-2-metilfenil)-2-metóxi-N-(2-oxo-3-oxazolidinil)-
 acetamida,
 N-(6-metóxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida,
 N-[2,2,2-tricloro-1-[(cloroacetil)-amino]-etil]-benzamida,
 N-[3-cloro-4,5-bis-(2-propinilóxi)-fenil]-N'-metóxi-
 25 metanimidamida,
 N-formil-N-hidróxi-DL-alanina-sal de sódio,
 O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforamidotioato,
 O-metil-S-fenil-fenilpropilfosforamidotioato,
 S-metil-1,2,3-benzotiadiazol-7-carbotioato,
 30 spiro[2H]-1-benzopirano-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-ona.

Bactericidas:

Bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de ní-

quel, casugamicina, octilinona, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, pro-benazol, estreptomicina, tecloftalamo, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

Inseticidas/Acaricidas/Nematicidas:

- 5 Abamectin, Acephato, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldoxycarb, Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
- Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculovirus, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb,
- 10 carb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximato, Betacyfluthrin, Bifenazato, Bifenthrin, Bioethanomethrin, Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butylpyradaben,
- Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos,
- 15 Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentiezina, Cyanophos, Cyclopreno, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazina,
- Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-metila, Diefenthiuron,
- 20 Diazinon, Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimetoato, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sódio, Dofenapyn,
- Eflusilanato, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthor spp., Esfenvalerato, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin óxido, Fenitrothion,
- 25 Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrit-hrin, Fenpyroximato, Fenvalerato, Fipronil, Fluazinam, Fluazuron, Flubrocyl-hrinato, Flucycloxuron, Flucythrino, Flufenoxuron, Flutenzino, Fluvalinato, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,
- Granulosevírus,
- 30 Halofenozida, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydropreno,
- Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin,

- Kernpolyederviren,
 Lambda-cyhalothrin, Lufenuron,
 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozida, Metolcarb, Metoxadiazona, Mevinphos, Milbemectin,
- 5 Monocrotophos,
- Naled, Nienpyram, Nithiazine, Novaluron,
 Omethoat, Oxamyl, Oxydemethon M
 Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat, Phorat, Phosalona, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
- 10
- Quinalfos,
 Ribavirin,
- 15
- Salithion, Sebufos, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos,
 Tau-fluvalinato, Tebufenozida, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thetacypermethrin, Tiamethoxam, Tiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam oxalato de hidrogênio, Thidiocarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocythrin, Tralomethrin, Triarathena, Triazamato, Triazophos, Triazuron, Triclophenidina, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,
- 20
- Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii
 YI 5302
- 25
- Zeta-cypermethrin, Zolaprofos
 (1R-cis)-[5-(fenilmetil)-3-furanil]-metil-3-[(dihidro-2-oxo-3-(2H)-furaniliden)-metil]-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato
 (3-fenoxifenil)-metil-2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato
 1-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]tetrahidro-3,5-dimetil-N-nitro-1,3,5-
- 30
- triazin-2(1H)-imina
 2-(2-cloro-6-fluorfenil)-4-[4-(1,1-dimetiletil)fenil]-4,5-dihidro-oxazol

- 2-(acetilóxi)-3-dodecil-1,4-naftalindiona
- 2-cloro-N-[[[4-(1-feniletóxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida
- 2-cloro-N-[[[4-(2,2-dicloro-1,1-difluoretóxi)-fenil]-amino]-carbonil]-benzamida
- 5 3-metilfenil-propilcarbamato
- 4-[4-(4-etoxifenil)-4-metilpentil]-1-flúor-2-fenóxi-benzeno
- 4-cloro-2-(1,1-dimetiletil)-5-[[2-(2,6-dimetil-4-fenoxifenóxi)etil]tio]-3-(2H)-piridazinona
- 4-cloro-2-(2-cloro-2-metilpropil)-5-[(6-iodo-3-piridinil)metóxi]-3-(2H)-piridazinona
- 10 (2H)-piridazinona
- 4-cloro-5-[(6-cloro-3-piridinil)metóxi]-2-(3,4-diclorofenil)-3-(2H)-piridazinona
- Bacillus thuringiensis, espécie EG-2348
- ácido benzóico[2-benzoil-1-(1,1-dimetiletil)-hidrazida]
- 15 ácido butânico 2,2-dimetil-3-(2,4-diclorofenil)-2-oxo-1-oxaspiro-[4.5]dec-3-en-4-il-éster
- [3-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2-tiazolilidilideno]-cianamida
- dihidro-2-(nitrometilen)-2H-1,3-tiazina-3(4H)-carboxaldeído
- etil-[2-[[1,6-dihidro-6-oxo-1-(fenilmetil)-4-piridazinil]óxi]etil]-carbamato
- 20 N-(3,4,4-triflúor-1-oxo-3-butenil)-glicina
- N-(4-clorofenil)-3-[4-(difluormetóxi)fenil]-4,5-dihidro-4-fenil-1H-pirazol-1-carboxamida
- N-[(2-cloro-5-tiazolil)metil]-N'-metil-N"-nitro-guanidina
- 25 N-metil-N'-(1-metil-2-propenil)-1,2-hidrazindicarbotioamida
- N-metil-N'-2-propenil-1,2-hidrazindicarbotioamida
- O,O-dietil-[2-(dipropilamino)-2-oxoetil]-etilfosforamidotioato
- Também é possível uma mistura com outras substâncias ativas conhecidas, tal como herbicidas ou com fertilizantes e reguladores de crescimento.
- 30
- As substâncias ativas de acordo com a invenção, no uso como inseticidas, podem apresentar-se como inseticidas em suas formulações cor-

rentes no comércio, bem como nas formas de aplicação preparadas dessas formulações em misturas com agentes de sinergia. Agentes de sinergia são compostos pelos quais o efeito das substâncias ativas é aumentado, sem que o agente de sinergia adicionado precise, ele próprio, ser eficaz ativamente.

O conteúdo de substância ativa das formas de aplicação preparadas das formulações correntes no comércio pode variar em após limites. A concentração das substâncias ativas das formas de aplicação pode situar-se de 0,0000001 a 95% em peso de substância ativa, preferivelmente, entre 0,0001 e 1% em peso.

A aplicação se dá em um modo usual, adaptado às formas de aplicação.

No uso contra pragas no setor de higiene e de produtos armazenados, a substância ativa distingue-se por um excelente efeito residual sobre madeira e argila, bem como por uma boa estabilidade a álcalis sobre bases caiadas.

As substâncias ativas de acordo com a invenção não atuam só contra pragas em plantas, no setor de higiene e produtos armazenados, mas também no setor da medicina veterinária, contra parasitas animais (ectoparasitas), tal como carrapatos de carapaça, carrapatos de couro, ácaros da sarna, ácaros, moscas (que picam e lambem), larvas de moscas parasitárias, piolhos de pêlo, piolhos de penas e pulgas. A esses parasitas pertencem:

Da ordem dos Anoplurida, por exemplo, *Haematopinus* spp., *Linnognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* sp., *Solenopotes* spp..

Da ordem dos Mallophagida e das subordens Amblycerina, bem como Ischnocerina, por exemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp..

Da ordem dos Diptera e das subordens dos Nematocerina, bem como Brachycerina, por exemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides*

des spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfhartia spp., Sarcophaga
 5 spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Da ordem dos Siphonapterida, por exemplo, Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

Da ordem dos Heteropterida, por exemplo, Cimex spp., Triatoma
 10 spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Da ordem dos Blattarida, por exemplo, Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp..

Da subclasse dos Acaria (Acarida) e das ordens dos Meta-, bem como Mesostigmata, por exemplo, Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius
 15 spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Peneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

Da ordem dos Actinedida (Prostigmata) e Acaridida (Astigmata), por exemplo, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia
 20 spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

As substâncias ativas de acordo com a invenção também são
 25 apropriadas para combater artrópodes, que atacam animais úteis agrícolas, tal como, por exemplo, bois, ovelhas, cabras, cavalos, porcos, burros, camelos, búfalos, coelhos, galinhas, perus, patos, gansos, abelhas, outros animais domésticos, tal como, por exemplo, cães, gatos, pássaros de gaiola, peixes de aquário, bem como cobaias, tal como, por exemplo, hamsters,
 30 porquinhos-da-índia, ratos e camundongos. Pelo combate desses artrópodes, devem ser reduzidos casos de morte e quedas de rendimento (em carne, leite, lã, peles, ovos, mel etc.), de modo que pelo uso das substâncias

ativas de acordo com a invenção, é possível uma criação de animais mais econômica e simples.

A aplicação das combinações de substâncias ativas de acordo com a invenção no setor veterinário se dá de modo conhecido, por administração enteral, na forma de, por exemplo, comprimidos, cápsulas, embebição, drenching, granulados, pastas, glóbulos, do processo de feed-through, de supositórios, por administração parenteral, tal como, por exemplo, por injeções (por via intramuscular, subcutânea, intravenosa, intraperitoneal, entre outras), implantes, por aplicação nasal, por aplicação dermal, na forma, por exemplo, da imersão ou banho (dipping), pulverização (spraying), derramamento (pour-on e spot-on), da lavagem, do polvilhamento, bem como com ajuda de corpos moldados contendo substância ativa, tal como coleiras, marcas de orelha, marcas de cauda, tiras para elementos, cabrestos, dispositivos de marcação etc.

Na aplicação para gado, aves, animais domésticos etc., pode-se usar as substâncias ativas como formulações (por exemplo, pós, emulsões, agentes fluidos), que contêm as substâncias ativas em uma quantidade de 1 a 80% em peso, diretamente ou após diluição de 100 a 10.000 vezes, ou utilizar as mesmas como banho químico.

Além disso, foi descoberto que as substâncias ativas mostram uma alta eficácia contra insetos, que destroem materiais técnicos.

Exemplificadamente e preferivelmente - mas não restritivamente - podem ser citados os seguintes insetos:

Besouros, tal como

Hylotrupes bajulus, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*.

Himenópteros, tal como

Sirex juvencus, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Uroce-*

rus augur.

Cupins, tal como

Kaloterms flavicollis, Cryptoterms brevis, Heteroterms indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastoterms darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptoterms formosanus.

Traças, tal como Lepisma saccharina.

Por materiais técnicos são entendidos no presente contexto materiais não-vivos, tal como, preferivelmente, matérias sintéticas, adesivos, colas, papéis e papelões, couro, madeira, produtos processados de madeira e agentes de pintura.

De modo especialmente preferido, no caso do material a ser protegido contra ataque de insetos, trata-se de madeira e produtos processados de madeira.

Por madeira e produtos processados de madeira, que podem ser protegidos pelo agente de acordo com a invenção ou por misturas que contêm o mesmo, deve ser entendido, exemplificadamente:

Madeira de construção, vigas de madeira, dormentes de vias férreas, peças de pontes, pranchas para barcos, veículos de madeira, caixas, estrados para carga, contêineres, postes telefônicos, revestimentos de madeira, janelas e portas de madeira, compensado, placas de compensado, trabalhos de marcenaria ou produtos de madeira, que encontram utilização na construção de casas ou na carpintaria de construção.

As substâncias ativas podem ser usadas como tais, na forma de concentrados ou formulações em geral usuais, tal como pós, granulados, soluções, suspensões, emulsões ou pastas.

As formulações citadas podem ser preparadas de modo em si conhecido, por exemplo, por mistura das substâncias ativas com pelo menos um solvente ou diluente, emulsificante, agente de dispersão e/ou aglutinante ou fixador, agentes repelentes de água, opcionalmente, agentes secantes e estabilizadores de UV e, opcionalmente, corantes e pigmentos, bem como outros agentes auxiliares de processamento.

Os agentes inseticidas ou concentrados, usados para proteção de madeira e materiais de madeira, contêm a substância ativa de acordo com a invenção em uma concentração de 0,0001 a 95% em peso, particularmente, 0,001 a 60% em peso.

5 A quantidade de agentes ou concentrados a ser usada, depende da espécie e da infestação dos insetos e do meio. A quantidade de carga ótima pode ser determinada na aplicação, respectivamente por séries de testes. Em geral, porém, é suficiente usar 0,0001 a 20% em peso, preferi-
10 velmente, 0,001 a 10% em peso, da substância ativa, com relação ao material a ser protegido.

 Como solvente e/ou diluente, serve um solvente orgânico-químico ou misturas de solventes e/ou um solvente orgânico-químico oleoso ou semelhante a óleo, dificilmente volátil, ou mistura de solventes e/ou um
15 solvente orgânico-químico polar ou mistura de solventes e/ou água e, opcionalmente, um emulsificante e/ou reticulador.

 Como solventes orgânico-químicos, são usados, preferivelmente, solventes oleosos ou semelhantes a óleo, com um índice de evaporação acima de 35 e um ponto de inflamação acima de 30°C, preferivelmente, acima de 45°C. Como solventes dessa espécie, oleosos e semelhantes a óleo,
20 insolúveis em água, dificilmente voláteis, são usados óleos minerais correspondentes ou frações de aromatos dos mesmos ou misturas de solventes contendo óleo mineral, preferivelmente, benzina de teste, petróleo e/ou alquilbenzeno.

 Vantajosamente, são utilizados óleos minerais com uma faixa de
25 ebulição de 170 a 220°C, benzina de teste, com uma faixa de ebulição de 170 a 220°C, óleo fino para fusos, com uma faixa de ebulição de 250 a 350°C, petróleo ou aromatos, com uma faixa de ebulição de 160 a 280°C, óleo de terpentina e similar.

 Em uma forma de realização preferida, são usados hidrocarbonetos alifáticos, líquidos, com uma faixa de ebulição de 180 a 210°C ou mis-
30 turas de alta ebulição de hidrocarbonetos aromáticos e alifáticos, com uma faixa de ebulição de 180 a 220°C e/ou óleo fino para fusos e/ou monocloro-

naftalina, preferivelmente, α -monocloronaftalina.

Os solventes orgânicos, oleosos ou semelhantes a óleo, de difícil volatilidade, com um índice de evaporação acima de 35 e um ponto de inflamação acima de 30°C, preferivelmente, acima de 45°C, podem ser parcialmente substituídos com solventes orgânico-químicos, de volatilidade fácil ou média, com a condição de que a mistura de solvente apresente igualmente um índice de evaporação acima de 35 e um ponto de inflamação acima de 30°C, preferivelmente, acima de 45°C, e que a mistura de inseticida-fungicida seja solúvel ou emulsificável nessa mistura de solvente.

De acordo com uma forma de realização preferida, uma parte do solvente orgânico-químico ou mistura de solventes ou um solvente orgânico-químico polar, alifático, ou mistura de solventes é substituída. Preferivelmente, são utilizados solventes orgânico-químicos alifáticos, que contêm grupos hidroxila e/ou éster e/ou éter, tal como, por exemplo, glicoléteres, ésteres ou similar.

Como aglutinantes orgânico-químicos são usados no âmbito da presente invenção as resinas sintéticas e/ou óleos de secagem aglutinante, em si conhecidos, dilúveis em água ou solúveis, dispersíveis ou emulsificáveis nos solventes orgânico-químicos usados, particularmente aglutinantes, que consistem em ou contêm uma resina de acrilato, uma resina vinílica, por exemplo, polivinilacetato, resina de poliéster, resina de policondensação ou poliadição, resina de poliuretano, resina alquídica ou resina alquídica modificada, resina fenólica, resina de hidrocarboneto, tal como resina de indeno-cumarona, resina de silicone, óleos secantes vegetais e/ou óleos secantes e/ou aglutinantes de secagem física, na base de uma resina natural e/ou sintética.

A resina sintética utilizada como aglutinante pode ser usada na forma de uma emulsão, dispersão ou solução. Como aglutinante, também podem ser usados betume ou substâncias betuminosas, até 10% em peso. Adicionalmente, podem ser usados corantes, pigmentos, agentes repelentes de água, corretores de odor e inibidores ou agentes de proteção contra corrosão, em si conhecidos, ou similares.

Preferivelmente, está contida de acordo com a invenção, como aglutinante orgânico-químico, pelo menos uma resina alquídica ou resina alquídica modificada e/ou um óleo vegetal secante no agente ou no concentrado. Preferivelmente, são usadas de acordo com a invenção resinas alquídicas, com um conteúdo de óleo de mais de 45% em peso, preferivelmente, 50 a 68% em peso.

O aglutinante citado pode ser substituído totalmente ou parcialmente por um agente (mistura) de fixação ou um agente (mistura) plastificante. Esses aditivos devem prevenir uma volatilização das substâncias ativas, bem como uma cristalização ou precipitação. Preferivelmente, eles substituem 0,01 a 30% do aglutinante (com relação a 100% do aglutinante usado).

Os plastificantes originam-se das classes químicas dos éteres de ácido ftálico, tal como dibutil-, dioctil- ou benzilbutilftalato, ésteres de ácido fosfórico, tal como tributilfosfato, ésteres de ácido adípico, tal como di-(2-etilhexil)-adipato, estearatos, tal como butilestearato ou amilestearato, oleatos, tal como butiloleato, glicerinéteres ou glicoléteres de alta molecularidade, glicerinésteres, bem como ésteres de ácido p-toluenossulfônico.

Agentes de fixação baseiam-se quimicamente em polivinilalquiléteres, tal como, por exemplo, polivinilmetiléter ou cetonas, tal como benzofenona, etilenbenzofenona.

Como solventes ou diluentes, também água é particularmente de interesse, opcionalmente em mistura com um ou mais dos solventes orgânico-químicos citados acima, ou diluentes, emulsificantes ou agentes de dispersão.

Uma proteção de madeira particularmente eficaz é obtida por processos de impregnação, de tecnologia industrial, por exemplo, vácuo, vácuo duplo ou processos de pressão.

Os produtos prontos para aplicação podem ainda conter, opcionalmente, outros inseticidas e, opcionalmente, ainda um ou mais fungicidas.

Como parceiros de mistura são de interesse, preferivelmente, os inseticidas e fungicidas mencionados no documento WO 94/29 268. Os compostos citados nesse documento são parte integrante expressa do pre-

sente pedido.

Parceiros de mistura especialmente preferidos podem ser inseticidas, tal como cloropirifos, foxima, silafluofina, alfa-metrina, ciflutrina, cipermetrina, deltametrina, permetrina, imidacloprida, NI-25, flufenoxurona, hexaflumurona, transflutrina, tiacloprida, metoxifenóxido e triflumurona, bem como fungicidas, tal como epoxiconazóis, hexaconazóis, azaconazóis, propiconazóis, tebuconazóis, ciproconazóis, metconazóis, imazalila, diclorofluanida, tolilfluanida, 3-iodo-2-propinil-butilcarbamato, N-octil-isotiazolin-3-ona e 4,5-dicloro-N-octilisotiazolin-3-ona.

Ao mesmo tempo, os compostos de acordo com a invenção podem ser usados para proteção contra as incrustações em objetos, particularmente em corpos de navios, peneiras, redes, obras, cais e sinalizações, que entram em contato com água do mar ou água salobra.

Incrustações por oligoquetos sésseis, tal como Tubificidae, bem como por conchas e espécies do grupo dos Ledamorpha (mariscos), tal como diversas espécies de Lepas e Scalpellum, ou por espécies do grupo dos Balanomorpha (cracas), tal como espécies de Balanus ou Pollicipes, aumenta a resistência ao atrito de navios e, em consequência, por consumo de energia mais alto e, além disso, por freqüentes permanências em estaleiro seco, leva a um nítido aumento dos custos operacionais.

Além das incrustações por algas, por exemplo, Ectocarpus sp. e Ceramium sp., uma importância especial é atribuída às incrustações por grupos de entomóstracos sésseis, que são englobados sob o nome de Cirripedia (carangueijos de água doce).

Surpreendentemente, foi descoberto agora que os compostos de acordo com a invenção, sozinhos ou em combinação com outras substâncias ativas, apresentam um efeito antifouling (anti-incrustações) excepcional.

Pelo uso de compostos de acordo com a invenção, sozinhos ou em combinação com outras substâncias ativas, pode ser dispensado o uso de metais pesados, tal como, por exemplo, sulfetos de bis(trialquilestano), laurato de tri-n-butilestano, cloreto de tri-n-butilestano, óxido de cobre(I), cloreto de trietilestano, estano de tri-n-butil(2-fenil-4-clorofenóxi), óxido de

tributilestanho, dissulfeto de molibdênio, óxido de antimônio, butiltitanato polimérico, cloreto de fenil-(bispiridin)-bismuto, fluoreto de tri-n-butilestanho, bistiocarbamato de manganês-etileno, dimetilditiocarbamato de zinco, etilenobistiocarbamato de zinco, sais de zinco e cobre de óxido de 2-piridintiol-1, 5 bistiocarbamato de bisdimetilditiocarbamoilazincetoileno, óxido de zinco, bistiocarbamato de cobre(I)-etileno, tiocianato de cobre, naftenato de cobre e halogenetos de tributilestanho, ou a concentração desses compostos pode ser decisivamente diminuída.

10 As tintas antifouling, prontas para aplicação, ainda podem conter, opcionalmente, outras substâncias ativas, preferivelmente, algicidas, fungicidas, herbicidas, molusquicidas ou outras substâncias ativas antifouling.

Como parceiros de combinação para os agentes antifouling de acordo com a invenção, são apropriados:

15 Algicidas, tal como

2-terc-butilamino-4-ciclopropilamino-6-metiltio-1,3,5-triazina, diclorofeno, diurona, endotal, fentinacetato, isoproturona, metabenzotiazurona, oxifluorfenol, quinoclaminas e terbutina;

Fungicidas, tal como

20 benzo[b]ácido tiofenocarboxílico-ciclohexilamida-S,S-dióxido, diclofluanida, fluorfolpeto, 3-iodo-2-propinil-butilcarbamato, tolilfluana e azóis, tal como azaconazóis, ciproconazóis, epoxiconazóis, hexaconazóis, metconazóis, propiconazóis e tebuconazóis;

Molusquicidas, tal como

25 fentinacetato, metaldeído, metiocarbo, niclosamida, tiodicarbo e trimetacarbo;

ou substâncias ativas antifouling convencionais, tal como

4,5-dicloro-2-octil-4-isotiazolin-3-ona, diiodometilparatrisulfona, 2-(N,N-dimetiltiocarbamoiltio)-5-nitrotiazila, sais de potássio, cobre, sódio e 30 zinco de 2-piridintiol-1-óxido, piridin-trifenilborano, tetrabutildistannoxano, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, 2,4,5,6-tetracloroisofaltonitrila, dissulfeto de tetrametiltiuramo e 2,4,6-triclorofenilmaleinimida.

Os agentes antifouling usados contêm as substâncias ativas dos compostos de acordo com a invenção em uma concentração de 0,001 a 50% em peso, particularmente, de 0,01 a 20% em peso.

5 Os agentes antifouling de acordo com a invenção contêm, além disso, os componentes usuais, tal como descrito, por exemplo, em Ungerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732 e Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973.

Agentes de pintura antifouling contêm, além das substâncias ativas algicidas, fungicidas, molusquicidas e das substâncias ativas inseticidas de acordo com a invenção, particularmente, aglutinantes.

Exemplos de aglutinantes reconhecidos são cloreto de polivinila em um sistema de solvente, caucho clorado em um sistema de solvente, resinas acrílicas em um sistema de solvente, particularmente, em um sistema aquoso, sistemas de copolímero de cloreto de vinila/acetato de vinila, na forma de dispersões aquosas ou na forma de sistemas de solvente orgânicos, cauchos de butadieno/estireno/acrilnitrila, óleos secantes, tal como óleo de semente de linho, éster de resina ou resinas duras modificadas, em combinação com alcatrão ou betume, asfalto, bem como compostos de epóxi, pequenas quantidades de caucho de cloro, polipropileno clorado e resinas vinílicas.

Opcionalmente, os agentes de pintura também contêm pigmentos inorgânicos, pigmentos orgânicos ou corantes, que são preferivelmente insolúveis em água do mar. Além disso, os agentes de pintura podem conter materiais, tal como colofônia, para possibilitar uma liberação controlada das substâncias ativas. Os agentes de pintura podem conter, ainda, plastificantes, agentes modificadores, que influenciam as propriedades reológicas, bem como outros componentes convencionais. Também em sistemas de Self-Polishing-Antifouling, podem ser incorporados os compostos de acordo com a invenção ou as misturas citadas acima.

30 As combinações de substâncias ativas também são apropriadas para combate de pragas animais, particularmente, de insetos, aracnídeos e ácaros, que ocorrem em espaços fechados, tal como, por exemplo, casas,

galpões de fábricas, escritórios, cabines de veículos e similar. Elas podem ser usadas sozinhas ou em combinação com outras substâncias ativas e auxiliares, para combate dessas pragas em produtos inseticidas domésticos. Elas são eficazes contra espécies sensíveis e resistentes, bem como contra

5 todos os estágios de desenvolvimento. A essas pragas pertencem:

Da ordem dos Scorpionidea, por exemplo, *Buthus occitanus*.

Da ordem dos Acarina, por exemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

10

Da ordem dos Araneae, por exemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Da ordem dos Opiliones, por exemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

15 Da ordem dos Isopoda, por exemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Da ordem dos Diplopoda, por exemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*

Da ordem dos Chilopoda, por exemplo, *Geophilus spp.*

20 Da ordem dos Zigentoma, por exemplo, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Da ordem dos Blattaria, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

25

Da ordem dos Saltatoria, por exemplo, *Acheta domesticus*.

Da ordem dos Dermaptera, por exemplo, *Forficula auricularia*.

Da ordem dos Isoptera, por exemplo, *Kalotermea spp.*, *Reticulitermes spp.*

30 Da ordem dos Psocoptera, por exemplo, *Lepinatus spp.*, *Liposcelis spp.*

Da ordem dos Coleptera, por exemplo, *Anthrenus spp.*, *Attage-*

nus spp., Dermestes spp., Latheticus oryzae, Necrobia spp., Ptinus spp., Rhizopertha dominica, Sitophilus granarius, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Stegobium paniceum.

5 Da ordem dos Diptera, por exemplo, Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles spp., Calliphora erythrocephala, Chrysosoma pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Drosophila spp., Fannia canicularis, Musca domestica, Phlebotomus spp., Sacrophaga carnaria, Simulium spp., Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa.

10 Da ordem dos Lepidoptera, por exemplo, Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

Da ordem dos Siphonaptera, por exemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis.

15 Da ordem dos Hymenoptera, por exemplo, Camponotus herculeanus, Lasius fuliginosus, Lasius niger, Lasius umbratus, Monomorium phaeonis, Paravespula spp., Tetramorium caespitum.

Da ordem dos Anoplura, por exemplo, Pediculus humanus capitis, Pediculus humanus corporis, Phthirus pubis.

20 Da ordem dos Heteroptera, por exemplo, Cimex hemipterus, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma infestans.

25 A aplicação no setor dos inseticidas domésticos se dá sozinha ou em combinação com outras substâncias ativas apropriadas, tal como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretróides, reguladores de crescimento ou substâncias ativas de outras classes de inseticidas conhecidas.

30 A aplicação se dá em aerossóis, agentes de pulverização sem pressão, por exemplo, sprays de bomba e pulverizador, dispositivos automáticos de nebulização, de fogo, de espuma, géis, produtos de evaporação, com pastilhas de evaporação de celulose ou matéria sintética, evaporadores de líquido, evaporadores de gel e membrana, evaporadores acionados por hélices, sistemas de evaporação sem energia e passivos, papéis para traças, saquinhos para traças e géis para traças, como granulados ou pós, em

iscas de aspersão ou estações de iscas.

As substâncias ativas de acordo com a invenção podem ser usadas como desfolhantes, desseccantes, agentes de erradicação de ervas e, particularmente, como agentes de erradicação de ervas daninhas. Por ervas daninhas devem ser entendidas, em sentido mais amplo, todas as plantas que crescem em locais onde são indesejáveis. Se as substâncias de acordo com a invenção agem como herbicidas totais ou seletivos, depende, substancialmente, da quantidade usada.

As substâncias ativas de acordo com a invenção podem ser usadas, por exemplo, nas seguintes plantas:

Ervas daninhas dicotiledôneas das espécies: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapsis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Culturas dicotiledôneas das espécies: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Ervas daninhas monocotiledôneas das espécies: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

Culturas monocotiledôneas das espécies: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

O uso das substâncias ativas de acordo com a invenção, porém, não está de modo algum restrito a essas espécies, mas estende-se do mesmo modo também a outras plantas.

As substâncias ativas de acordo com a invenção são apropriadas, na dependência da concentração, para erradicação total de ervas daninhas, por exemplo, em instalações industriais e estradas de ferro e em caminhos e praças, com e sem cobertura de árvores. Do mesmo modo, as substâncias ativas de acordo com a invenção podem ser usadas para combate de ervas daninhas em culturas permanentes, por exemplo, silvicultura, árvores ornamentais, fruticultura, viticultura, citricultura, plantações de nozes, bananas, café, chá, borracha, palmeiras oleaginosas, cacau, amoras e lúpulo, em campos ornamentais e esportivos e em áreas de pastagem, bem como para o combate seletivo de ervas daninhas em culturas anuais.

Os compostos de acordo com a invenção mostram uma forte eficácia herbicida e um amplo espectro de ação na aplicação sobre o solo e sobre partes de plantas aéreas. Em determinada medida eles também são apropriados para o combate seletivo de ervas daninhas monocotilidôneas e dicotilidôneas em culturas monocotilidôneas e dicotilidôneas, tanto no processo de pré-emergência como no processo de pós-emergência.

Em determinadas concentrações ou quantidades de aplicação, as substâncias ativas de acordo com a invenção também podem ser usadas para combate de pragas animais e doenças fúngicas ou bacterianas das plantas. Opcionalmente, elas também podem ser usadas como produtos intermediários ou preliminares para a síntese de outras substâncias ativas.

De acordo com a invenção, podem ser tratadas todas as plantas e partes de plantas. Por plantas são entendidas, nesse caso, todas as plantas e populações de plantas, tal como plantas silvestres desejáveis e indesejáveis ou plantas de cultura (inclusive plantas de cultura de ocorrência natural). Plantas de cultura podem ser plantas que podem ser obtidas por métodos de cultivo e de otimização convencionais, ou por métodos de biotecnologia ou tecnologia genética ou combinação desses métodos, inclusive plantas transgênicas e, inclusive de espécies de plantas protegidas ou não pro-

tegidas por direitos de proteção de espécies. Por partes de plantas devem ser entendidos todas as partes e órgãos das plantas, aéreos e subterrâneos, tal como broto, folha, flor e raiz, sendo que, exemplificadamente, são relacionados folhas, agulhas, hastes, troncos, flores, corpos de frutas, frutos e sementes, bem como raízes, tubérculos e rizomas. Às partes de plantas também pertencem material de colheita, bem como material de multiplicação vegetativo e generativo, por exemplo, estacas, tubérculos, rizomas, mudas e sementes.

O tratamento de acordo com a invenção das plantas e partes de plantas com as substâncias ativas se dá diretamente ou por ação sobre o entorno, ambiente de vida ou local de armazenamento, de acordo com os métodos de tratamento usuais, por exemplo, por imersão, pulverização, evaporação, nebulização, aspersão, pintura e, no caso de material de propagação, particularmente, em sementes, ainda por revestimento de uma ou mais camadas.

Tal como já mencionado acima, de acordo com a invenção podem ser tratadas todas as plantas e partes das mesmas. Em uma forma de realização preferida, são tratados gêneros de plantas e espécies de plantas de ocorrência natural ou obtidas por métodos de cultivo biológicos convencionais, tal como cruzamento ou fusão protoplástica, bem como partes das mesmas. Em uma outra forma de realização preferida, são tratadas plantas e espécies de plantas transgênicas, que foram obtidas por métodos de tecnologia genética, opcionalmente, em combinação com métodos convencionais (Genetic Modified Organisms) e partes da mesmas. O termo "partes" ou "partes de plantas" foi explicado acima.

De modo particularmente preferido, de acordo com a invenção são tratadas plantas das espécies de plantas correntes no comércio ou das que se encontram em uso.

Dependendo dos gêneros de plantas ou espécies de plantas, do local e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, alimentação), pelo tratamento de acordo com a invenção também podem apresentar-se efeitos superaditivos ("sinérgicos"). Desse modo, são possíveis,

por exemplo, quantidades de aplicação menores e/ou ampliações do espectro de ação e/ou intensificação do efeito dos materiais e agentes utilizáveis de acordo com a invenção, um melhor crescimento das plantas, tolerância mais alta contra temperaturas altas ou baixas, tolerância mais alta contra
5 seca ou contra conteúdo de água ou sal no solo, floração mais intensa, colheita facilitada, aceleração da maturação, rendimentos de colheita mais altos, qualidade mais alta e/ou valor alimentício mais alto dos produtos de colheita, aptidão mais alta para o armazenamento e/ou processabilidade dos produtos de colheita, que ultrapassam os efeitos efetivamente esperados.

10 Às plantas ou espécies de plantas transgênicas (obtidas por tecnologia genética) preferidas, a ser tratadas de acordo com a invenção, pertencem todas as plantas que por modificação de tecnologia genética contêm material genético, que confere às plantas propriedades ("traits") particularmente vantajosas. Exemplos dessas propriedades são melhor crescimento
15 das plantas, tolerância mais alta em relação a temperaturas altas ou baixas, tolerância mais alta contra seca ou contra conteúdo de água ou sal no solo, floração mais intensa, colheita facilitada, aceleração da maturação, rendimentos de colheita mais altos, qualidade mais alta e/ou valor alimentício mais alto dos produtos de colheita, aptidão mais alta para o armazenamento
20 e/ou processabilidade mais alta dos produtos de colheita. Outros exemplos particularmente destacados dessas propriedades são uma defesa mais alta das plantas contra pragas animais e microbianas, bem como em relação a insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e/ou vírus, bem como uma tolerância mais alta das plantas contra determinadas substâncias ativas herbicidas. Como exemplos de plantas transgênicas, são citadas as plantas de
25 cultura importantes, tal como cereais (trigo, arroz), milho, soja, batata, algodão, colza, bem como plantas frutíferas (com as frutas maçãs, pêras, frutas cítricas e uvas), sendo que são particularmente destacados milho, soja, batata, algodão e colza. Como propriedades ("traits"), é particularmente destacada a defesa mais alta das plantas contra insetos por toxinas formadas nas
30 plantas, particularmente aquelas, que são produzidas nas plantas pelo material genético, de *Bacillus Thuringiensis* (por exemplo, pelos genes CryIA(a),

CryIA(b) CryIA(c), CRyIIa, CryIIIA CRyIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb e CryIF, bem como combinações dos mesmos) (doravante, "plantas Bt"). Como propriedades ("traits"), é ainda particularmente destacada a tolerância mais alta das plantas em relação a determinadas substâncias ativas herbicidas, por exemplo, imidazolinonas, sulfoniluréias, glifosatos ou fosfinotricina (por exemplo, gene "PAT"). Os genes que respectivamente conferem as propriedades ("traits") desejadas também podem apresentar-se em combinações entre si nas plantas transgênicas. Como exemplos de "plantas Bt" podem ser citadas espécies de milho, espécies de algodão, espécies de soja e espécies de batata, que são comercializadas sob os nomes comerciais de YIELD GARD® (por exemplo, milho, algodão, soja), Knock-Out® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), Nucotr® (algodão e NewLeaf® (batata). Como exemplos de plantas tolerantes a herbicida, podem ser citadas espécies de milho, espécies de algodão e espécies de soja, que são comercializadas sob os nomes comerciais de Roundup Ready® (tolerância contra glifosatos, por exemplo, milho, algodão e soja), Liberty Link® (tolerância contra fosfinotricina, por exemplo, colza), IMI® (tolerância contra imidazolinonas) e STS® (tolerância contra sulfoniluréias, por exemplo, milho). Como plantas resistentes a herbicida (cultivadas convencionalmente para tolerância a herbicidas), também podem ser citadas as espécies comercializadas sob a designação de Clearfield® (por exemplo, milho). Naturalmente, o exposto acima também vale para espécies de plantas a ser desenvolvidas no futuro ou que chegarão futuramente ao mercado, com essas propriedades genéticas("traits") ou propriedades a ser desenvolvidas futuramente.

As plantas descritas podem ser tratadas de modo particularmente vantajoso de acordo com a invenção, com os compostos da fórmula (I). As faixas preferidas indicadas acima nas substâncias ativas, também valem para o tratamento dessas plantas. Deve ser particularmente destacado o tratamento das plantas com as misturas descritas especialmente no presente texto.

As substâncias ativas podem ser transformadas nas formulações

usuais, tal como soluções, emulsões, pós para pulverização, suspensões, pós, agentes de polvilhamento, pastas, pós solúveis, granulados, concentrados de suspensão-emulsão, materiais naturais e sintéticos impregnados com substância ativa, bem como encapsulamento fino em materiais poliméricos.

5 Essas formulações são produzidas de modo conhecido, por exemplo, por mistura das substâncias ativas com diluentes, portanto, solventes líquidos e/ou veículos sólidos, opcionalmente, sob uso de surfatantes, portanto, agentes de emulsificação e/ou agentes de dispersão e/ou agentes formadores de espuma.

10 No caso do uso de água como diluente, também podem ser usados, por exemplo, solventes orgânicos como solventes auxiliares. Como solventes líquidos são substancialmente de interesse: aromatos, tal como xileno, tolueno ou alquilnaftalinas, aromatos clorados e hidrocarbonetos alifáticos, clorados, tal como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno,
15 hidrocarbonetos alifáticos, tal como ciclohexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, óleos minerais e vegetais, álcoois, tal como butanol ou glicol, bem como éteres e ésteres dos mesmos, cetonas, tal como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona ou ciclohexanona, solventes fortemente polares, tal como dimetilformamida e dimetilsulfóxido, bem como água.

20 Como veículos sólidos são de interesse: por exemplo, sais de amônio e farinhas de pedra naturais, tal como caulins, terras argilosas, talco, carbonato de cálcio, quartzo, atapulguita, montmorillonita ou terras diatômicas, e farinhas de pedra sintéticas, tal como ácido silícico altamente disperso, óxido de alumínio e silicatos; como veículos sólidos para granulados são
25 de interesse: por exemplo, pedras naturais quebradas e fracionadas, tal como calcita, mármore, pedra pomes, sepiolita, dolomita, bem como granulados sintéticos de farinhas inorgânicas e orgânicas, bem como granulados de material orgânico, tal como serragem, cascas de coco, espigas de milho e hastes de tabaco; como emulsificantes e/ou agentes formadores de espuma
30 são de interesse: por exemplo, emulsificantes não ionogênicos e aniônicos, tal como ésteres de ácido graxo de polioxietileno, éteres de álcool graxo de polioxietileno, por exemplo, alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsul-

fatos, arilsulfonatos, bem como hidrolisados de proteína; como agentes de dispersão são de interesse: por exemplo, lixívia de lignina-sulfito e metilcelulose.

Podem ser usados nas formulações agentes de adesividade, tal
 5 como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos, em forma de pó, de grão ou látex, tal como goma arábica, polivinilálcool, polivinilacetato, bem como fosfolipídios naturais, tal como cefalinas e lecitinas e fosfolipídios sintéticos. Outros aditivos podem ser óleos minerais e vegetais.

Podem ser usados corantes, tal como pigmentos inorgânicos,
 10 por exemplo, óxido de ferro, óxido de titânio, azul de cianeto de ferro, e corantes orgânicos, tal como corantes de alizarina, azóicos e ftalocianina metálica e nutrientes de vestígio, tal como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

As formulações contêm, em geral, entre 0,1 e 95 por cento em
 15 peso de substância ativa, preferivelmente entre 0,5 e 90%.

As substâncias ativas podem ser usadas para combate de ervas daninhas como tais ou em suas formulações ou também em mistura com herbicidas conhecidos e/ou com substâncias que aperfeiçoam a compatibilidade com plantas de cultura ("safenadores"), sendo que são possíveis for-
 20 mulações prontas ou misturas em tanque. Portanto, também são possíveis misturas com agentes de combate de ervas daninhas, que contêm um ou mais herbicidas conhecidos e um safenador.

Para as misturas são de interesse herbicidas conhecidos, por exemplo,

25 Acetocloro, acifluorfen(-sódio), aclonifeno, alacloro, aloxidima(-sódio), ametrinas, amicarbazonas, amidocloro, amidossulfurona, anilofos, asulamo, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, BAS-662H, beflubutamida, benazolina(-etila), benfuresato, bensulfurona(-metila), bentazona, benzofendizona, benzobiciclona, benzofenap, benzoilprop(-etila), bialafos, bifenox,
 30 bispiribac(-sódio), bromobutídeo, bromofenoxima, bromoxinila, butacloro, butafenacil (-alila), butroxidima, butilato, cafenestiróis, caloxidima, carbetamida, carfentrazona(-etila), clometoxifeno, clorambeno, cloridazona, clorimuron(-

etila), cloronitrofenos, clorossulfurona, clorotolurona, cinidon (-etila), cinmetilino, cinossulfurona, clefoxidima, cletodima, clodinafop (-propargil), clomazona, clomeprop, clopiralida, clopirassulfuron(-metila), cloransulam(-metila), cumilurona, cianazina, cibutrina, cicloato, ciclossulfamurona, cicloxidima,

5 cihalofof(-butila), 2,4-D, 2,4-DB, desmedifamo, dialato, dicamba, dicloroprop (-P), diclofof(-metila), diclossulamo, dietatil(-etila), difenzoquat, diflufenican, diflufenzopiro, dimefurona, dimepiperato, dimetacloro, dimetametrina, dime-

tenamida, dimexiflam, dinitramina, difenamida, diquat, ditiopir, diurona, dimriona, epoprodano, EPTC, esprocarb, etalfluralina, etametsulfuron(-metila),

10 etofumesato, etoxifeno, etoxissulfurona, etobenzanida, fenóxaprop(-P-etila), fentrazamida, flamprop(-isopropila, isopropil-L, -metila), flazassulfurona, florassulamo, fluazifop(-P-butila), fluazolato, flucarbazona (-sódio), flufenaceto, flumetsulamo, flumiclorac(-pentila), flumioxazina, flumipropina, flumetsulamo, fluometurona, fluorocloridona, fluoroglicofeno (-etila), flupoxamo, flupropacil,

15 flurpirsulfurona (-metila, -sódio), flurenol (-butila), fluridona, fluoroxipir(-butoxipropila, -meptila), flurprimidol, flurtamona, flutiacet(-metila), flutiamida, fomesafen, foramsulfurona, glufosinato(-amônio), glifosato (-isopropilamônio), halosafen, haloxifop(-etóxi-etila-P-metila), haloxifop(-P-metila), hexazinona, imazametabenz(-metila), imazametapir, imazamox, im-

20 mazapic, imazapir, imazaquina, imazetapir, imazossulfurona, iodossulfurona (-metila, -sódio), ioxinila, isopropalina, isoproturona, isourona, isoxabeno, isoxaclorotol, isoxaflutol, isoxapirifop, lactofeno, lenacil, linurona, MCPA, mecoprop, mefenacet, mesotriona, metamitrona, metazacloro, metabenzotiazurona, metobenzurona, metobromurona, (alfa-)metolacloro, metossulamo,

25 metoxurona, metribuzina, metsulfuron(-metila), molinato, monolinurona, naproanilida, napropamida, neburona, nicossulfurona, norflurazona, orbencarb, orizalina, oxadiargila, oxadiazona, oxassulfurona, oxaziclomefona, oxifluorfenos, paraquat, ácido pelargônico, pendimetalina, pendralina, pentoxazona, fenmedifamo, picolinafeno, piperofos, pretilacloro, prmissulfuron(-metila), profluazol, prometrina, propacloro, propanila, propaquizafop, propiso-

30 cloro, propoxicarbazona (-sódio), propizamida, prossulfocarb, prossulfurona, piraflufeno (-etila), pirazogila, pirazolato, pirazossulfurona (-etila), pirazoxife-

no, piribenzoxima, piributicarb, piridato, piridatol, piriftalida, piriminobac (-metila), piritiobac (-sódio), quinclorac, quinmerac, quinoxiamina, quizalofop (-P-etila-P-tefurila), rimsulfurona, setoxidima, simazina, simetrina, sulcotriona, sufentrazone, sulfometuron (-metila), sulfosato, sulfossulfurona, tebutamo, 5 tebutiurona, tepraloxidima, terbutilazina, terbutrina, tenilcloro, tiafluamida, tiazopir, tidiazimina, tifensulfurona (-metila), tiobencarb, tiocarbamil, tralcoxi-dima, trialato, triassulfurona, tribenurona (-metila), triclopir, tridifano, triflurali-na, triflórissulfurona, triflússulfurona (-metila), trissulfurona.

Também é possível uma mistura com outras substâncias ativas 10 conhecidas, tal como fungicidas, inseticidas, acaricidas, nematicidas, agen-tes protetores contra ataque de pássaros, nutrientes de plantas e agentes de aperfeiçoamento da estrutura do solo.

As substâncias ativas podem ser usadas como tais, na forma de suas formulações ou nas formas de aplicação preparadas das mesmas por 15 diluição adicional, tal como soluções prontas para uso, suspensões, emul-sões, pós, pastas e granulados. A aplicação se dá de modo usual, por e-xemplo, por rega, pulverização, nebulização, aspersão.

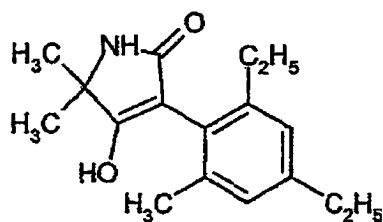
As substâncias ativas de acordo com a invenção podem ser a- 20 plicadas tanto antes como também depois da emergência das plantas. Elas também podem ser incorporadas no solo, antes da semeadura.

A quantidade de substância ativa aplicada pode variar em um amplo limite. Ela depende, substancialmente, da espécie do efeito desejado. Em geral, as quantidades de aplicação situam-se entre 1 g e 10 kg de subs- 25 tância ativa por hectare de área de solo, preferivelmente, entre 5 g e 5 kg por ha.

A produção e utilização das substâncias ativas de acordo com a invenção se evidencia dos exemplos abaixo.

EXEMPLOS DE PRODUÇÃO

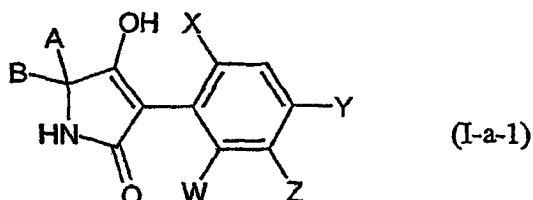
Exemplo I-1-a-1



A 6,5 g de terc-butilato de potássio em 25 ml de dimetilformamida (DMF) isenta de água, adiciona-se, por gotejamento, a 60°C, 7,4 g do composto de acordo com o exemplo II-1, dissolvido em 1 ml de DMF isenta de água e continua-se a agitar sob controle de cromatografia de camada fina. Após o término da reação, adiciona-se 170 ml de água gelada, acidifica-se com ácido clorídrico concentrado, de 0°C a 10°C, para pH 2, aspira-se e re-lava-se com água gelada. O resíduo é purificado cromatograficamente em sílica-gel com cloreto de metileno/metanol 9:1 como agente de purificação.

10 Rendimento: 3,90 g (\cong 58.00% da teoria), Pf. 199°C

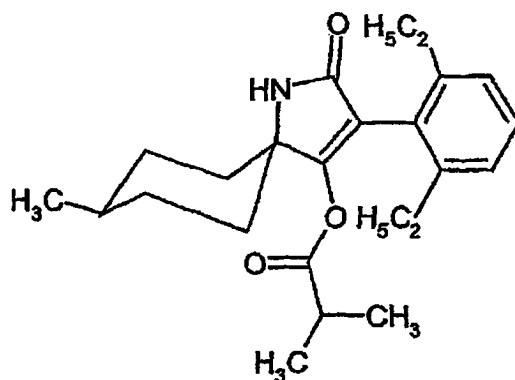
Em analogia ao exemplo (I-1-a-1) e de acordo com as instruções gerais para produção, foram obtidos os seguintes compostos da fórmula (I-a-1)



Ex. N°	W	X	Y	Z	A	B	Pf. °C	Isô- mero
I-1-a-2	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		154	B
I-1-a-3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		225	B
I-1-a-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	200	-
I-1-a-5	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		115	B
I-1-a-6	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		222	B
I-1-a-7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>230	B
I-1-a-8	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	>220	-

Ex. Nº	W	X	Y	Z	A	B	Pf. °C	Isô-mero
I-1-a-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		114	β
I-1-a-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		>220	β
I-1-a-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>220	-
I-1-a-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	109	-
I-1-a-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		216	β
I-1-a-14	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	160	-
I-1-a-15	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		197	β
I-1-a-16	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		193	β
I-1-a-17	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		233	β
I-1-a-18	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		184	β
I-1-a-19	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		156	β
I-1-a-20	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		168	β
I-1-a-21	CH ₃	CH ₃	-C≡CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		127	β
I-1-a-22	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		211	β
I-1-a-23	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		210	β
I-1-a-24	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>220	-
I-1-a-25	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	192	-
I-1-a-26	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		181	β
I-1-a-27	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		222	β
I-1-a-28	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		278	β
I-1-a-29	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		268	β
I-1-a-30	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		248	α

Exemplo I-1-b-1

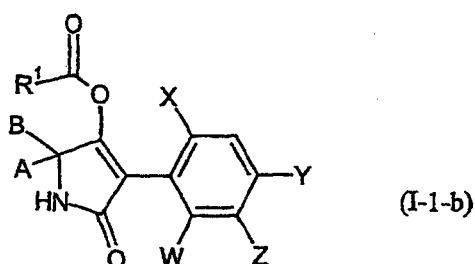


- 2,5 g do composto I-1-a em 50 ml de etiléster de ácido acético
- 5 isento de água são aquecidos sob refluxo com 1,7 ml de trietilamina e são adicionados, por gotejamento, 1,3 ml de cloreto de ácido isobutárico em 5 ml de etiléster de ácido acético isento de água e, sob controle cromatográfico

de camada fina agita-se sob refluxo. O solvente é removido por destilação e o resíduo é absorvido em cloreto de metileno, lavado com 50 ml de 0,5 N de NaOH, secado e concentrado. Subseqüentemente, o resíduo é recristalizado de metil-terc-butiléter (MTB-éter)/n-hexano.

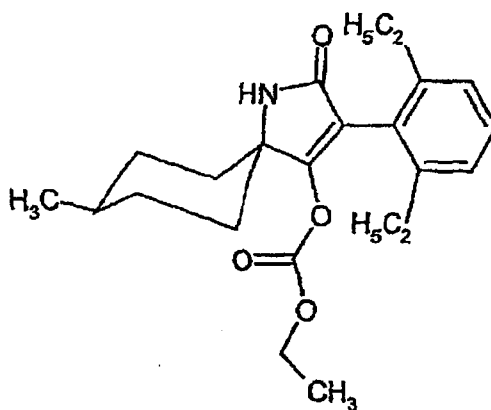
5 Rendimento: 2 g (\cong 64% da teoria), Pf. 209°C

Em analogia ao exemplo (I-1-b-1) e de acordo com as instruções gerais para produção, foram obtidos os seguintes compostos da fórmula (I-1-b)



Ex. N°	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	P.f °C	Isô-mero
I-1-b-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	145	-
I-1-b-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	135	B
I-1-b-4	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	76	-
I-1-b-5	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	201	B
I-1-b-6	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₄ H ₉	215	B
I-1-b-7	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	190	-

10 Exemplo I-1-c-1



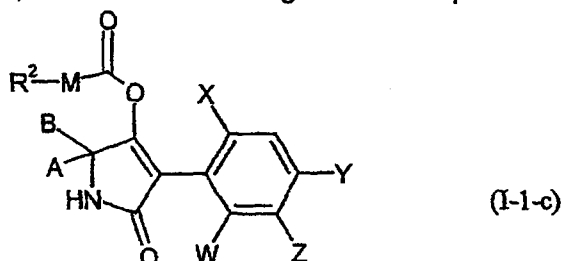
São carregados 2,51 g do composto da fórmula I-1-a-10 e 1,2 ml de trietilamina. A 0 a 10°C são adicionados por gotejamento 0,8 ml de etiléter de ácido clorofórmico em 5 ml de diclorometano isento de água e agita-se à temperatura ambiente, sob controle cromatográfico de camada fina. Lava-se com 0,5 N de NaOH, seca-se e remove-se o solvente por destilação. O resí-

15

duo é recristalizado de metil-terc-butiléter/n-hexano.

Rendimento: 1,1 g (\cong 30% da teoria), pf. 178°C

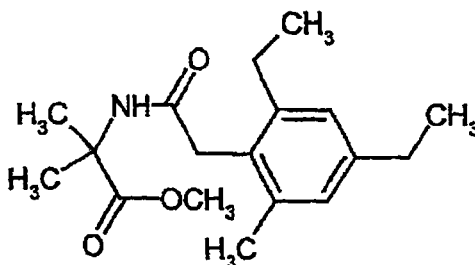
Em analogia ao exemplo (I-1-c-1) e de acordo com as instruções gerais para produção, são obtidos os seguintes compostos da fórmula (I-1-c)



Ex. N°	W	X	Y	Z	A	B	M	R ²	Pf °C	Isô-mero
I-1-c-2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	194	B
I-1-c-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	119	-
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	-C≡CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	171	B
I-1-c-5	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	i-C ₄ H ₉	155	B
I-1-c-6	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	215	-
I-1-c-7	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	137	B
I-1-c-8	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	168	B

5

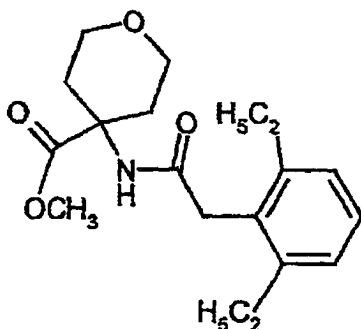
Exemplo II-1



7,5 g de 2,4-dietil-6-metil-ácido fenilacético e 9,2 ml de cloreto de tionila são agitados a 80°C, até que esteja concluído o desenvolvimento de gases. O cloreto de tionila excedente é removido por destilação e o resíduo é absorvido em 30 ml de THF seco. Essa solução é adicionada por gotejamento a 0 a 10°C a 12,3 g de 2-amino-2-metiléster de ácido metilpropânico em 320 ml de THF seco, que está misturado com 24,6 ml de trietilamina, e agitada por 1 h à temperatura ambiente. Essa solução é então concentrada, absorvida em cloreto de metileno e 1 N de HCl, extraída, secada e concentrada. O resíduo é recristalizado de éter de MTB/n-hexano.

15

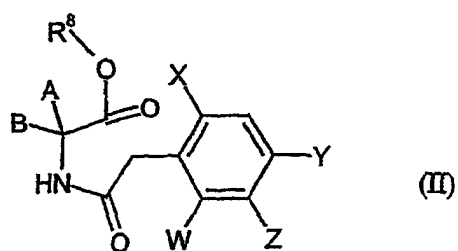
Rendimento: 8,07 g (\cong 66% da teoria), pf. 120 a 122°C

Exemplo II-11

5 A 16,9 g de ácido sulfúrico concentrado adiciona-se 10,3 g do composto de acordo com o exemplo XXVII-1 como suspensão em 110 ml de cloreto de metileno, a uma temperatura interna de 30 a 40°C e agita-se por 2 h. 23 ml de metanol seco são adicionados por gotejamento e agita-se a 40 a 70°C por 6 h. A solução é adicionada a 0,18 kg de gelo, extraída com cloreto de metileno e lavada com uma solução de NaHCO₃. Seca-se, concentração e recristaliza-se o resíduo de éter de MTB/n-hexano.

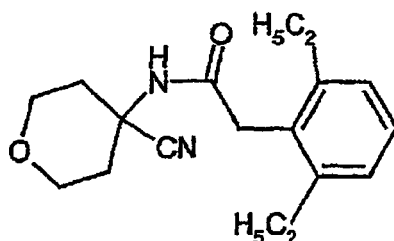
10 Rendimento: 8,7 g (76% da teoria), pf. 137°C

Em analogia ao exemplo (II-1) e de acordo com as instruções gerais para produção, foram obtidos os seguintes compostos da fórmula (II)



Ex. N°	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	P.f °C	Isó- mero
II-2	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	169	β
II-3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	94	β
II-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	109	-
II-5	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	141	β
II-6	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	165	β
II-7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	112	β
II-8	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	126	-
II-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	101	β
II-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	108	β
II-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	137	-
II-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	102	-
II-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	169	β
II-14	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃	93	-
II-15	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	112	β
II-16	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	71	β
II-17	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	69	β
II-18	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	61	β
II-19	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	151	β
II-20	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	123	β
II-21	CH ₃	CH ₃	-C≡CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	141	β
II-22	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	98	β
II-23	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	149	β
II-24	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		CH ₃	164	-
II-25	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	141	-

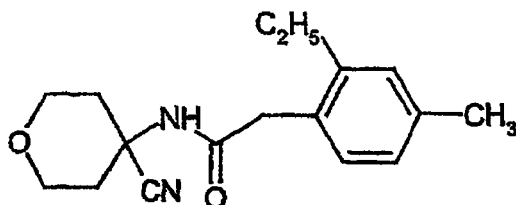
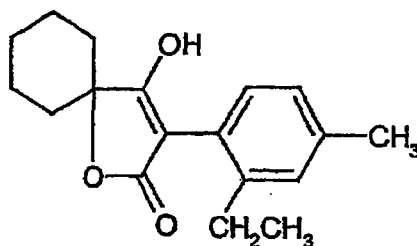
Ex. N°	W	X	Y	Z	A	B	R ^s	P.f °C	Isô- mero
II-26	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		CH ₃	103	8
II-27	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		CH ₃	01	8
II-28	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		CH ₃	234	8
II-29	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂		CH ₃	140	8

Exemplo XXVII-1

7,68 g de 2,4-dietil-6-metil-ácido fenilacético e 9,1 ml de cloreto
 5 de tionila são agitados a 80°C, até que esteja concluído o desenvolvimento
 de gases. O cloreto de tionila excedente é removido por destilação e o resí-
 duo é absorvido em 40 ml de tolueno seco. Essa solução é adicionada por
 gotejamento a 0 a 10°C a 9 g de 4-amino-4-ciano-tetrahidropirano em 80 ml
 de THF seco, que está misturado com 6,2 ml de trietilamina, e agitada por 1
 10 h à temperatura ambiente. Essa solução é então concentrada, absorvida em
 1 N de HCl em cloreto de metileno, secada e concentrada. O resíduo é re-
 cristalizado de éter de MTB/n-hexano.

Rendimento: 10,3 g (\cong 85% da teoria), pf. 155°C

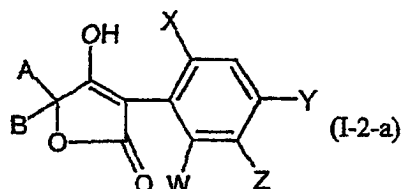
Em analogia ao exemplo (XXVII-1), é obtido o exemplo XXVII-2,
 15 com pf. 142°C.

Exemplo I-2-a-1

A 8,4 g de terc-butilato de potássio em 50 ml de DMF isento de água adiciona-se por gotejamento, a 0 a 10°C, 16,6 g do composto de acordo com o exemplo III-1, dissolvido em 50 ml de DMF isento de água e agita-se por 8 h à temperatura ambiente. Após o término da reação, adiciona-se
 5 por gotejamento, sob refrigeração com gelo, 1000 ml de 1N de HCl e agita-se por 30 minutos. O produto precipitado é separado por filtração, lavado com água e secado no vácuo.

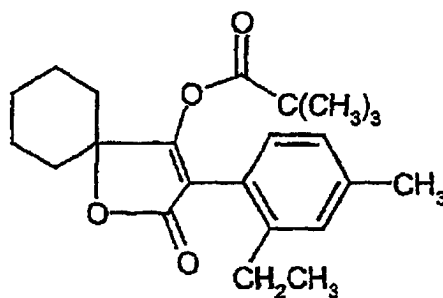
Rendimento: 11,5 g (= 80% da teoria), pf. 135°C

Em analogia ao exemplo (I-2-a-1) e de acordo com as instruções
 10 gerais para produção, são obtidos os seguintes compostos da fórmula (I-2-a)



Ex. N°	W	X	Y	Z	A	B	P.f. °C
I-2-a-2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Óleo
I-2-a-3	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		223-225
I-2-a-4	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		175-178
I-2-a-5	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Óleo

Exemplo I-2-b-1

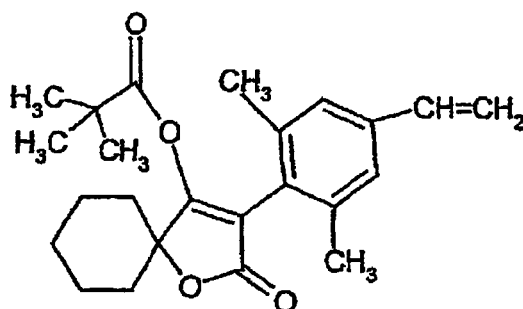


A 2,86 g do composto de acordo com o exemplo I-2-a-1, dissol-
 15 vido em 40 ml de cloreto de metileno seco (CH₂Cl₂) adicionam-se 2,08 ml de trietilamina. A 0 - 10°C adicionam-se 1,5 g de cloreto de pivaloíla em 10 ml de CH₂Cl₂ e agita-se por 20 h à temperatura ambiente.

A solução de reação é primeiramente lavada com ácido cítrico com concentração de 10% e depois, com 1 N de NaOH, secada e concen-
 20 trada e o resíduo é misturado com éter de petróleo.

Rendimento: 2,2 g (\cong 60% da teoria), pf. 110-112°C.

Exemplo I-2-b-2

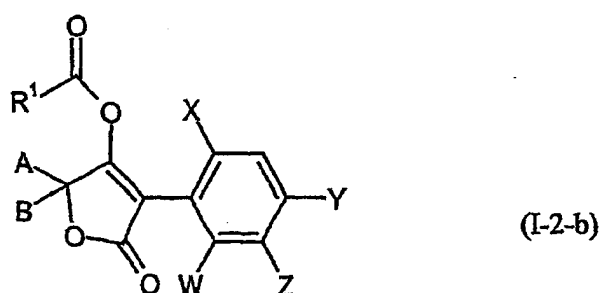



1,2 g (2,76 mmoles) do composto de acordo com o exemplo I-2-b-2 de WO 97/02243 são carregados em 20 ml de tolueno, são adicionados 3,5 g (11 mmoles) de tributil-vinilestanho, 133 mg (0,11 mmol) de Pd(PPh₃)₄ e 2 cristais de 2,6-di-t-butil-4-metilcresol, a mistura é fervida durante a noite, no refluxo e, subseqüentemente, concentrada.

Para purificação, a mistura bruta é cromatografada através de sílica-gel, sendo que, primeiramente, são purificados com ciclohexano compostos de estanho excedentes e, subseqüentemente, por troca do agente de purificação para ciclohexano/éster acético (2:1), o produto é purificado. Uma purificação adicional obtida por trituração do produto bruto com éter de petróleo.

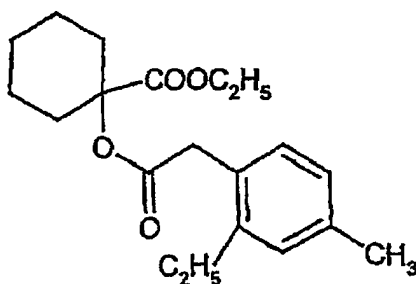
Rendimento: 0,46 g (44% da teoria), cristais incolores, com pf. 152-155°C.

Em analogia aos exemplos (I-2-b-1) e (I-2-b-2) e de acordo com as instruções gerais para produção, são obtidos os seguintes compostos da fórmula (I-2-b)



Ex. N°	W	X	Y	Z	A B	R ^I	P.f. °C
I-2-b-3	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -	t-C ₄ H ₉ -CH ₂	162-164
I-2-b-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	Óleo
I-2-b-5	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	158-160
I-2-b-6	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	143-145
I-2-b-7	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-H ₂ C-  -CH ₂ -	t-C ₄ H ₉	155-157
I-2-b-8	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	145
I-2-b-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -	t-C ₄ H ₉	96-98
I-2-b-10	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	t-C ₄ H ₉	90-93
I-2-b-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	H ₅ C ₂ -CHCH ₃ -	Óleo
I-2-b-12	H	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	s-C ₄ H ₉	Óleo
I-2-b-13	H	CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	i-C ₃ H ₇	Óleo

Exemplo III-1

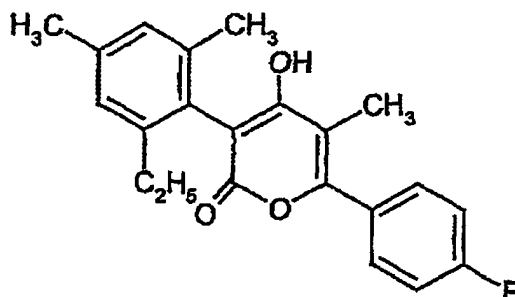


- 8,9 g de 2-etil-4-metil-ácido fenilacético em 50 ml de tolueno seco e 7,3 ml de cloreto de tionila são agitados a 80°C, até que esteja concluído o desenvolvimento de gases. O cloreto de tionila excedente é removido por destilação e o resíduo é absorvido em 30 ml de tolueno seco. Essa solução é adicionada por gotejamento, a 0-10°C a 8,6 g de 1-hidróxi-ciclohexano-etiléster de ácido carboxílico em 50 ml de tolueno seco e agitada por 8 h, sob refluxo. A solução é então concentrada.

Rendimento: 16,6 g (≅ 99% da teoria)

O resíduo é usado sem purificação adicional na condensação do Exemplo I-2-a-1.

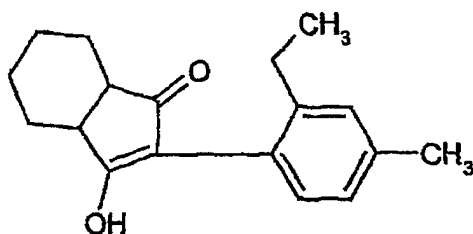
Exemplo I-4-a-1



- 5 2,4 g de 2-etil-4,6-dimetil-2-fenilclorocarbonilceteno são carregados em 30 ml de xileno abs. e adicionado 1,5 g de 4-fluorpropiofenona em 20 ml de xileno abs. Aquece-se por 8 h, sob refluxo. Lava-se a solução de xileno com água, seca-se através de sulfato de sódio e concentra-se no vácuo. A purificação cromatográfica se dá em sílica-gel com tolueno/etanol, 10 20:1, como agente de purificação.

Rendimento: 1 g (= 28% da teoria), com pf. 161-162°C.

Exemplo I-6-a-1

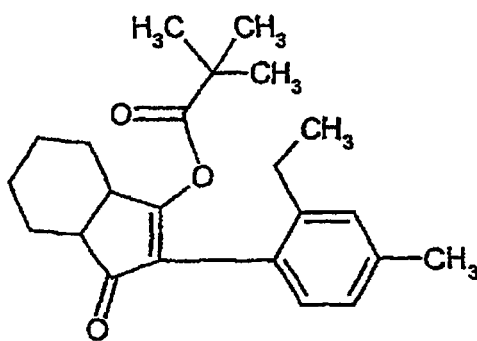


- 15 5,3 g do composto de acordo com o exemplo XIII-1 são carregados em 50 ml de DMF seco, misturados com 2,95 g de terc-butilato de potássio e aquecidos por 1 h para 60°C.

- 20 A solução de reação é misturada com 100 ml de 1N HCl, extraída com CH₂Cl₂, a fase orgânica é secada e concentrada. O resíduo é purificado por cromatografia de coluna (ciclohexano:etiléster de ácido acético, 5:1).

Rendimento: 2,35 g (49% da teoria), pf. 148°C.

Exemplo I-6-b-1



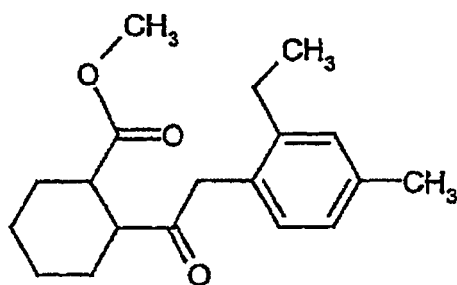
1 g do composto de acordo com o exemplo I-6-a-1 é carregado em 20 ml de cloreto de metileno seco, misturado com 0,77 ml de trietilamina. 0,68 ml de cloreto de pivaloila são dissolvidos em 1 ml de cloreto de metileno e adicionados por gotejamento sob refrigeração com gelo e agitados por 2 h, à temperatura ambiente.

A solução de reação é extraída duas vezes com 10% de solução de ácido cítrico e a fase orgânica é lavada duas vezes com 1N NaOH, secada e concentrada.

10 Rendimento: 1,2 g (92% da teoria). Óleo.

^1H -RMN (500 MHz, CDCl_3): δ = 1,1 (s, 9H, $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$), 2,31 (s, 3H, Ar- CH_3); 2,45 (q, 2H, Ar- $\text{CH}_2\text{-CH}_3$)ppm

Exemplo VIII-1

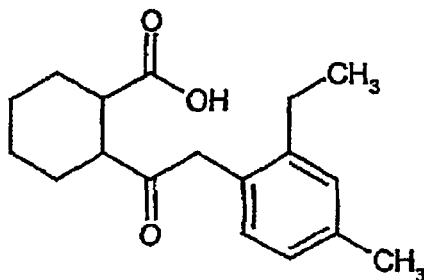


15 22,8 g de produto bruto do exemplo XXXIV-1 são carregados em 200 ml de acetona seca, misturados com 10,9 g de carbonato de potássio e adicionados por gotejamento 33,6 g (14,75 ml) de iodeto de metila. Agita-se por 16 h, sob refluxo.

20 O solvente é separado por destilação e o resíduo é purificado por cromatografia de coluna (cloreto de metileno/éter de petróleo: 8:1).

Rendimento: 3,5 g (30% da teoria), óleo.

O produto é usado diretamente na ciclização do exemplo I-6-a-1).

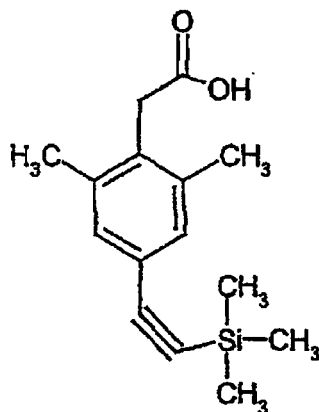
Exemplo XXXIV-1

11,2 g de monometiléster de ácido ciclohexanodicarboxílico são aquecidos para 100°C com 5,3 ml de cloreto de tionila e uma gota de DMF em 50 ml de tolueno seco, até que o desenvolvimento de gases esteja concluído. O solvente é concentrado.

A uma solução de 50 ml de solução de LDA em 100 ml de THF seco é adicionada por gotejamento uma solução de 17,3 g de 2-etil-4-metil-ácido fenilacético-metiléster em 20 ml de THF seco, a -15°C e agitada complementarmente por 30 min a essa temperatura. Depois, a -15°C, é adicionada por gotejamento uma solução do cloreto ácido recém-preparado, descrito acima, em 15 ml de THF seco.

A preparação é agitada por uma hora à temperatura ambiente, depois, são adicionados 150 ml de água e 40 g de cloreto de amônio. O produto intermediário é extraído com éter, a solução é concentrada. O resíduo é fervido com 100 g de KOH e 330 ml de água por dois dias, sob refluxo.

Rendimento: 23,70 g (91% da teoria), óleo.

Exemplo XXV-1

A 26 g do composto de acordo com o exemplo XXX-1 em 120 ml de THF são adicionados por gotejamento, à temperatura ambiente, 4,7 g de

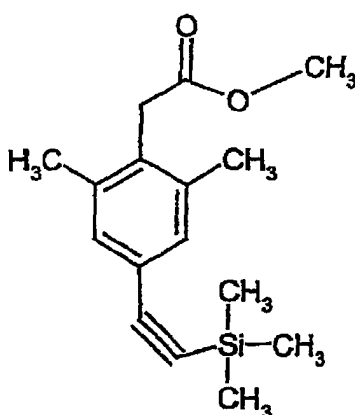
hidróxido de lítio, dissolvidos em 120 ml de água e agitados por 8 h à temperatura ambiente.

A solução de reação é concentrada, misturada com água e extraída com metil-terc-butiléter.

- 5 A fase aquosa é levada para pH 2 com ácido clorídrico concentrado e o produto precipitado é aspirado e secado.

Rendimento: 14 g (59% da teoria), pf.: 156,3°C.

Exemplo XXX-1



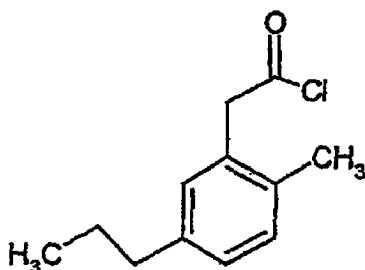
- 10 A uma solução de 7,32 g do composto de 2,6 dimetil-4-bromo-metiléster de ácido fenilacético (de acordo com o exemplo XXVI-1 de WO 97/02243) em 70 ml de trietilamina são adicionados por gotejamento, sob agitação e atmosfera de argonato, à temperatura ambiente, 0,27 g de iodeto de cobre(I), 0,745 g de trifenilfosfino, 1 g de bis(trifenilfosfino)dicloreto de
- 15 paládio e, subsequente, 19,7 ml de trimetilsilil-acetileno.

A conversão é acompanhada por meio de cromatografia de gás.

A purificação se dá por cromatografia de coluna em sílica-gel, com éter de petróleo/etiléster de ácido acético, 20:1, como agente de purificação.

- 20 Rendimento: 6 g (73% da teoria).

Exemplo XXII-1

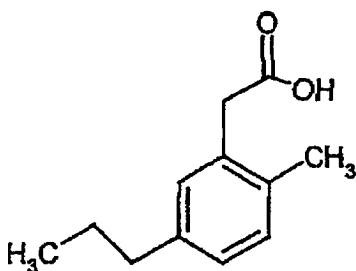


39 g do composto de acordo com o exemplo XXV-2 são agitados em 300 ml de cloreto de tionila, a 50°C, até que o desenvolvimento de gases esteja concluído.

- 5 O cloreto de tionila excedente é separado por destilação, o resíduo é absorvido em 30 ml de tolueno seco e separado por destilação.

Rendimento: 37 g (87% da teoria), Kp.: 90-92°C (0,05 mbar).

Exemplo XXV-2



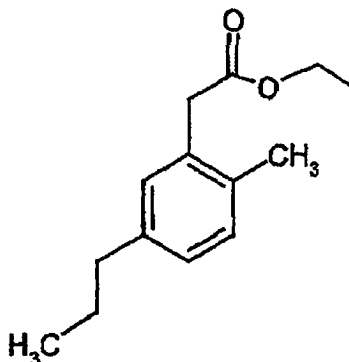
- 10 A 50 g do composto de acordo com o exemplo XXX-2 adicionam-se 60 ml de etanol, 30 ml de água, 25 g de hidróxido de potássio e aquece-se por 5 horas, sob refluxo.

Após o término da reação, o solvente é removido por destilação, o resíduo é dissolvido em água e o valor de pH é ajustado para ácido com

- 15 ácido clorídrico conc. O produto precipitado é aspirado, lavado e secado.

Rendimento: 41 g (93% da teoria).

Exemplo XXX-2 (Processo (P))



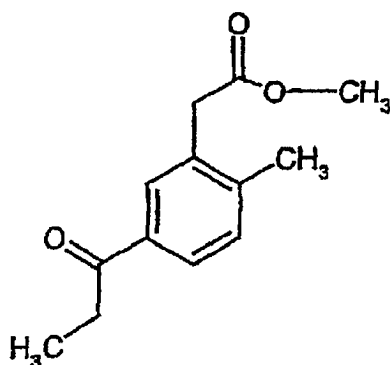
60 g do composto de acordo com o exemplo XLII-1 são dissolvidos em 600 ml de etanol, misturados com 50 ml de ácido clorídrico concentrado e são adicionados 5 g de Pd/C com concentração de 10%.

5 A 120°C e 150 bar, hidrogênio é comprimido sobre a mistura de reação.

Após o término da reação, filtra-se, o solvente é removido por destilação, o resíduo é dissolvido em 300 ml de cloreto de metileno e lavado com 300 ml de água, secado e concentrado.

Rendimento: 51 g (91% da teoria).

10 Exemplo XLII-1 (Processo (P))



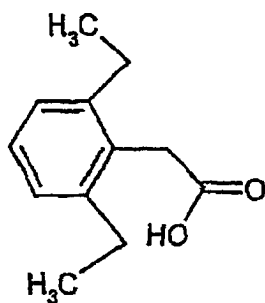
200 g de carbono de enxofre e 86,7 g de cloreto de alumínio são carregados. A 0°C, adiciona-se por gotejamento 50 g de 2-metilfenil-ácido acético-metiléster e 28,2 de cloreto de ácido propiônico. A solução é agitada
15 por quatro horas, sob refluxo.

A solução é posta, subsequente, sobre 1 kg de água gelada e extraída com 500 ml de cloreto de metileno.

A fase orgânica é lavada com ácido clorídrico com concentração de 10% e, subsequente, com solução de soda, secada e concentrada.

20 Rendimento: 60 g (91% da teoria).

Exemplo XXV-3

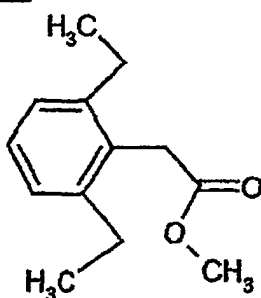


A 30 g do composto de acordo com o exemplo XXX-3 em 32 ml de metanol e 16 ml de água adicionam-se 12,2 g de hidróxido de potássio e agita-se por 5 h, sob refluxo.

5 A solução é concentrada e o resíduo é absorvido em água, lavado com etiléster de ácido acético e a fase aquosa é ajustada para pH 1 com HCl conc. O produto precipitado é aspirado, lavado e secado.

Rendimento: 25 g (99% da teoria), pf. 55-56°C.

Exemplo XXX-3 (Processo (Q))



10 20,8 g do composto 2,6 dietil-4-bromo-metiléster de ácido fenilacético (de acordo com o exemplo XXVI-6 de WO 97/02243) são dissolvidos em 100 ml de metanol. Adiciona-se 7,2 g de acetato de sódio e 2 g de hidróxido de paládio. Subseqüentemente, hidrogena-se com hidrogênio, sob pressão.

15 Após o término da reação, a solução é filtrada e concentrada. O resíduo é absorvido em cloreto de metileno, lavado com água, secado e concentrado.

Rendimento: 12 g (77% da teoria).

EXEMPLOS DE APLICAÇÃO

20 Exemplo A

Teste de Myzus

Solvente: 7 partes em peso de dimetilformamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

25 Para preparação de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante, para a concentração desejada.

Folhas de repolho (Brassica olearacea), que estão fortemente

atacadas pelo pulgão do pessegueiro (*Myzus persicae*), são tratadas por imersão na preparação de substância ativa com a concentração desejada.

Após o tempo desejado, é determinado o extermínio em %. Nesse caso, 100% significa que todos os pulgões foram exterminados; 0% significa que nenhum pulgão foi exterminado.

Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-2-a-4, I-2-b-5, I-2-b-6, I-1-a-6, I-1-c-4, I-4-a-1 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de 1000 ppm, um extermínio de 100% após 6 dias.

10 Exemplo B

Teste de *Nephotettix*

Solvente: 7 partes em peso de dimetilformamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água contendo emulsão, para a concentração desejada.

Broto de arroz (*Oryza sativa*) são tratados por imersão na preparação de substância ativa, com a concentração desejada, e carregados com a cigarra verde de arroz (*Nephotettix cincticeps*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

Depois do tempo desejado, é determinado o extermínio em %. Nesse caso, 100% significa que todas as cigarras foram exterminadas; 0% significa que nenhuma cigarra foi exterminada.

25 Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-2-b-9, I-2-a-4, I-1-a-9, I-1-a-8, I-1-a-2, I-1-a-1, I-1-a-3, I-4-a-1 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de 1000 ppm, um extermínio de 100% após 6 dias.

Exemplo C

30 Teste de larvas de *Phaedon*

Solvente: 7 partes em peso de dimetilformamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante, para a concentração desejada.

- 5 Folhas de repolho (*Brassica oleracea*) são tratadas por imersão na preparação de substância ativa, com a concentração desejada, e carregadas com larvas do besouro de rábano (*Phaedon cochleariae*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

Depois do tempo desejado, é determinado o extermínio em %.

- 10 Nesse caso, 100% significa que todas as larvas de besouro foram exterminadas; 0% significa que nenhuma larva de besouro foi exterminada.

- Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-2-a-3, I-2-b-8, I-2-b-6, I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-a-21, I-4-a-1 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de 1000 ppm, um extermínio de 100% após 7 dias.

Exemplo D

Teste de *Plutella*

Solvente: 7 partes em peso de dimetilformamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

- 20 Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água contendo emulsão, para a concentração desejada.

- 25 Folhas de repolho (*Brassica oleracea*) são tratadas por imersão na preparação de substância ativa, com a concentração desejada, e carregados com lagartas de crucíferas (*Plutella xylostella*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

Depois do tempo desejado, é determinado o extermínio em %.

- 30 Nesse caso, 100% significa que todas as lagartas foram exterminadas; 0% significa que nenhuma lagarta foi exterminada.

Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-1-a-8, I-4-a-1 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de

1000 ppm, um extermínio de 100% após 7 dias.

Exemplo E

Teste de Spodoptera frugiperda

Solvente: 7 partes em peso de dimetilformamida

5 Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água contendo emulsão, para a concentração desejada.

10 Folhas de repolho (*Brassica oleracea*) são tratadas por imersão na preparação de substância ativa, com a concentração desejada, e carregadas com lagartas do trigo (*Spodoptera frugiperda*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

Depois do tempo desejado, é determinado o extermínio em %.

15 Nesse caso, 100% significa que todas as lagartas foram exterminadas; 0% significa que nenhuma lagarta foi exterminada.

Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-2-a-3 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de 1000 ppm, um extermínio de 100% após 7 dias.

20 Exemplo F

Teste de Tetranychus

(resistente a OP/tratamento por imersão)

Solvente: 7 partes em peso de dimetilformamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

25 Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água contendo emulsão, para a concentração desejada.

30 Plantas de feijão (*Phaseolus vulgaris*), que estão fortemente atacadas por todos os estágios do ácaro rajado comum (*Tetranychus urticae*), são pulverizadas com uma preparação de substância ativa, com a concentração desejada.

Depois do tempo desejado, é determinado o extermínio em %. Nesse caso, 100% significa que todos os ácaros rajados foram exterminados; 0% significa que nenhum ácaro rajado foi exterminado.

- 5 Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-2-a-4, I-2-b-10, I-2-b-11, I-2-b-8, I-2-b-2, I-1-a-3, I-1-a-21, I-1-c-4, I-4-a-1 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de 1000 ppm, um extermínio de 100% após 7 dias.

Exemplo G

Teste de Bemisia

- 10 Solvente: 7,5 partes em peso de dimetilformamida
Emulsificante: 2,5 partes em peso de alquilarilpoliglicoléter

- 15 Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

Plantas de algodão (*Gossypium hirsutum*), que estão infestadas por ovos, larvas e pupas da mosca branca *Bemisia tabaci*, são imersas em uma preparação de substância ativa, com a concentração desejada.

- 20 Depois do tempo desejado, é determinado o extermínio em %.
Nesse caso, 100% significa que todos os animais foram exterminados; 0% significa que nenhum animal foi exterminado.

Nesse teste, os compostos dos exemplos de produção I-2-b-9, I-2-a-4, I-2-b-10 mostram, a uma concentração de substância ativa exemplificada de 1000 ppm, um extermínio de 100% após 10 dias.

- 25 Exemplo H

Teste de Pós-emergência

- Solvente: 5 partes em peso de acetona
Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

- 30 Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

Com a preparação de substância ativa, são pulverizadas plantas de teste, que têm uma altura de 5 a 15 cm, de tal modo que são aplicadas as quantidades de substância ativa respectivamente desejadas por unidade de superfície. As concentrações da calda de pulverização são escolhidas de tal modo que em 1000 l de água/ha é aplicada a quantidade de substância ativa respectivamente desejada.

Após 3 semanas, é avaliado o grau de danificação das plantas em % de danificação, em comparação com o desenvolvimento do controle não tratado.

10 Significam:

0% = sem efeito (tal como o controle não tratado)

100% = destruição total

Exemplo I

Teste de Pré-emergência

15 Solvente: 5 partes em peso de acetona

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

Para produção de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

Sementes das plantas de teste são semeadas em solo normal. Depois de 24 horas, o solo é pulverizado com a preparação de substância ativa, de tal modo que as quantidades de substância ativa respectivamente desejadas são aplicadas por unidade de superfície. A concentração da calda de pulverização é escolhida de tal modo que em 1000 l de água/ha as quantidades de substância ativa respectivamente desejadas são aplicadas.

Depois de três semanas, é avaliado o grau de danificação das plantas, em % de danificação, em comparação com o desenvolvimento do controle não tratado.

30 Significam:

0% = sem efeito (tal como o controle não tratado)

100% = destruição total

Post-emergence	g ai/ha	Weizen	Baumwolle	Alopecurus	Avena fatua	Lolium	Sorghum
Ex. I-2-a-4	60	0	0	95	80	95	80

Post-emergence	g ai/ha	Zuckerrüben	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Lolium	Setaria	Ipomoea	Polygonum
Ex. I-1-a-21	125	0	100	90	100	95	99	70	-
Ex. I-1-c-4	60	10	90	90	95	-	100	-	70

Post-emergence	g ai/ha	Soja	Digitaria	Lolium	Setaria	Sorghum	Galium
Ex. I-1-a-5	125	10	90	-	100	95	80
Ex. I-1-a-3	125	-	80	70	90	-	80

Post-emergence	g ai/ha	Zuckerrüben	Raps	Digitaria	Lolium	Setaria	Sorghum	Galium
Ex. I-1-a-2	125	0	0	80	70	95	80	80

Post-emergence	g ai/ha	Zuckerrüben	Baumwolle	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Setaria
Ex. I-1-a-9	15	10	0	100	95	95	100

Post-emergence	g ai/ha	Zuckerrüben	Baumwolle	Digitaria	Echinochloa	Setaria	Sorghum
Ex. I-1-a-8	60	10	0	95	100	100	95

Post-emergence	g ai/ha	Digitaria	Lolium	Setaria	Sorghum
Ex. I-1-a-6	125	95	80	95	100

Post-emergence	g ai/ha	Weizen	Soja	Baumwolle	Digitaria	Lolium	Setaria
Ex. I-2-b-12	125	-	0	0	95	90	95
Ex. I-2-b-13	125	10	0	0	80	70	95

Post-emergence	g ai/ha	Weizen	Zuckerrüben	Baumwolle	Digitaria	Echinochloa	Setaria	Sorghum
Ex. I-4-a-1	125	20	0	0	100	90	95	90

Post-emergence	g ai/ha	Weizen	Lolium	Cassia	Solanum	Viola
Ex. I-2-b-10	125	10	80	95	80	90

Pre-emergence	g ai/ha	Weizen	Mais	Zuckerrüben	Soja	Alopecurus	Avena fatua	Bromus	Lolium	Setaria
Ex. I-2-a-4	125	-	5	0	0	100	80	70	100	100
Ex. I-1-a-8	60	0	10	0	0	100	90	100	100	100

Pre-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa	Lolium	Setaria
Ex. I-1-a-3	125	100	95	100	100	100	100

Pre-emergence	g ai/ha	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa
Ex. I-1-a-6	60	90	80	90

Pre-emergence	g ai/ha	Zuckerrüben	Soja	Alopecurus	Digitaria	Lolium	Setaria	Veronica
Ex. I-4-a-1	125	0	0	100	100	100	100	95
Ex. I-1-a-21	125	0	0	100	100	100	100	100
Ex. I-1-a-9	125	0	0	100	100	100	100	90

Pre-emergence	g ai/ha	Weizen	Soja	Alopecurus	Echinochloa	Lolium	Setaria	Chenopodium
Ex. I-1-a-5	60	0	0	100	100	100	100	70

Pre-emergence	g ai/ha	Soja	Alopecurus	Bromus	Cyperus	Digitaria	Lolium	Setaria	Abutilo
Ex. I-1-c-4	125	20	95	100	100	100	100	100	70

Exemplo JTeste de concentração limite/insetos de solo - Tratamento de plantas transgênicas

Inseto de teste: *Diabrotica balteata* - larvas no solo

5 Solvente: 7 partes em peso

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

Para preparação de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com a quantidade indicada de solvente, adiciona-se a quantidade indicada de emulsificante e
10 dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

A preparação de substância ativa é derramada sobre o solo. Nesse caso, a concentração da substância ativa na preparação praticamente não tem importância, é decisiva apenas a quantidade de peso da substância ativa por unidade em volume de solo, que é indicada em ppm (mg/l). Enche-
15 se o solo em vasos de 0,25 l e reserva-se os mesmos a 20°C.

Imediatamente depois da preparação, são colocados em cada vaso 5 grãos de milho pré-germinados da espécie YIELD GUARD (marca registrada de Monsanto Comp., USA). Depois de 2 dias, os insetos de teste são colocados no solo tratado. Após mais 7 dias, é determinada a eficiência
20 da substância ativa por contagem das plantas de milho emergidas (1 planta = 20% de eficácia).

Exemplo KTeste de *Heliothis virescens* - Tratamento de plantas transgênicas

Solvente: 7 partes em peso

25 Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

Para preparação de uma preparação de substância ativa apropriada, mistura-se 1 parte em peso de substância ativa com a quantidade indicada de solvente, adiciona-se a quantidade indicada de emulsificante e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

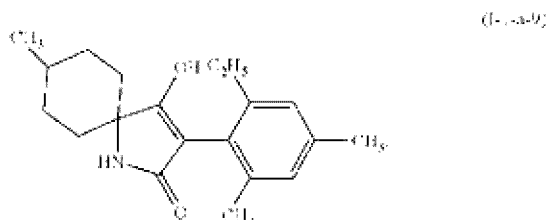
30 Brotos de soja (*Glycine max*) da espécie Roundup Ready (marca registrada da Monsanto Comp., USA) são tratadas por imersão na preparação de substância ativa com a concentração desejada e carregados com a

lagarta do tabaco *Heliothis virescens*, enquanto as folhas ainda estão úmidas.

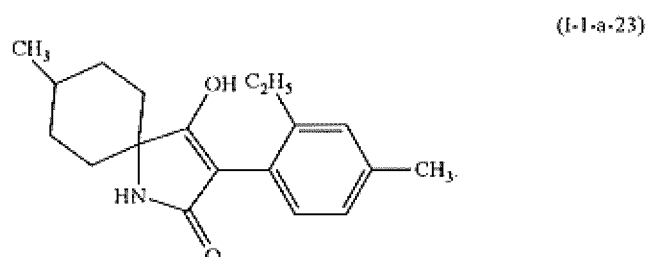
Após o tempo desejado, é determinado o extermínio dos insetos.

REIVINDICAÇÕES

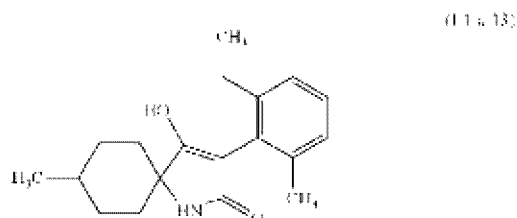
1. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula
(I-1-a-9)



2. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula
5 (I-1-a-23)

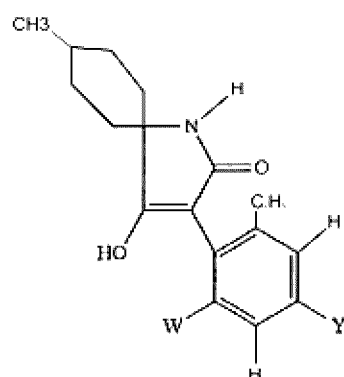


3. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula
(I-1-a-13)



4. Processo para produção de compostos, como definidos em
10 qualquer uma das reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de que:

(A) 3-fenilpirrolidina-2,4-dionas ou seus enóis de fórmula



na qual,

para os compostos da Fórmula (I-1-a-9),

W representa metila, e

Y representa metila;

5 para os compostos da Fórmula (I-1-a-23),

W representa hidrogênio, e

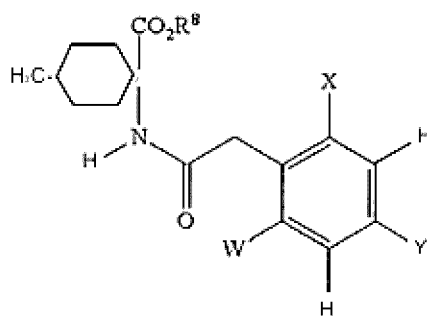
Y representa metila;

para os compostos da Fórmula (I-1-a-13),

W representa metila, e

10 Y representa hidrogênio;

são obtidas pela condensação intramolecular de ésteres de ácido N-acilamino de fórmula



na qual,

15 W, X e Y são cada um como definidos acima, e

R⁸ representa alquila,

na presença de um diluente, e na presença de uma base.

5. Pesticidas e herbicidas, caracterizados pelo fato de que compreendem pelo menos um composto da fórmula (I), como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, e um veículo pesticida ou herbicidamente aceitável.

20 6. Método para controlar pragas animais, caracterizado pelo fato de que compreende deixar compostos da fórmula (I), como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, atuarem sobre as pragas e/ou seu ambiente de vida.

25 7. Método para controlar crescimento de plantas indesejáveis, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar compostos da fórmula (I),

como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, às plantas indesejáveis ou ao solo ao redor das plantas.

8. Processo para produção de pesticidas e herbicidas, como definidos na reivindicação 5, caracterizado pelo fato de que compreende misturar os compostos da fórmula (I), como definidos na reivindicação 1, com diluentes e/ou substâncias tensoativas.

9. Método para produção de pesticidas e herbicidas, caracterizado pelo fato de que compreende adicionar compostos da fórmula (I), como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 3, a uma formulação herbicida ou pesticida usual.