



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

(21) PI 0807811-4 A2



* B R P I 0 8 0 7 8 1 1 A 2 *

(22) Data de Depósito: 28/01/2008
(43) Data da Publicação: 05/08/2014
(RPI 2274)

(51) Int.Cl.:

A01N 43/50
C07D 233/22
C07D 233/24
A01P 5/00
A01P 7/02
A01P 7/04
A01P 9/00

(54) Título: COMPOSTOS QUÍMICOS

(57) Resumo:

(30) Prioridade Unionista: 15/02/2007 EP 07 003189.3,
16/02/2007 EP 07 003303.0

(73) Titular(es): Syngenta Participations AG

(72) Inventor(es): Anthony Cornelius O'Sullivan, Christoph
Luethy, Jürgen Harry Schaetzer

(74) Procurador(es): Dannemann, Siemsen, Bigler &
Ipanema Moreira

(86) Pedido Internacional: PCT EP2008000629 de
28/01/2008

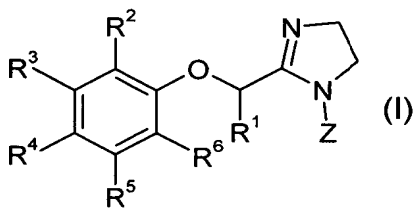
(87) Publicação Internacional: WO 2008/098674de
21/08/2008

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSTOS QUÍMICOS**".

A presente invenção refere-se a derivados de imidazolina e a seu uso como agentes inseticida, acaricida, moluscicida e nematocida. A invenção também estende-se a composições inseticida, acaricida, moluscicida e nematocida compreendendo tais derivados de imidazolina, e aos métodos de uso de tais derivados e/ou composições para combate e controle de pestes de inseto, acarina, molusco e nematódeo. Em particular, a presente invenção refere-se a imidazolinas com substituintes de alquila e flúor.

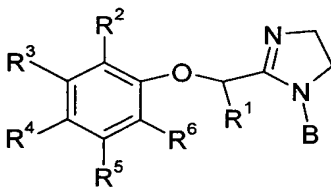
Vários derivados de imidazolina com propriedades de acaricida ou ectoparasiticida são conhecidas, por exemplo, de US4226876, US4414223, DE2818367, EP0011596, US4276302, US4232011, US4241075 e US4233306. Em particular, US5128361 descreve derivados de fluorofenóxi-metil-imidazolina úteis para combater ectoparasitas em animais hospedeiros e JP51106739 descreve derivados de triflúor- e flúor-fenóxi-metil-imidazolina que têm alguma atividade contra carrapatos ou mosquitos.

Tem agora encontrado outros novos derivados de imidazolina, que têm surpreendentemente boa atividade pesticida, em particular surpreendentemente boa atividade inseticida e/ou acaricida. Desse modo de acordo com um primeiro aspecto da invenção é fornecido um composto de fórmula (I):



ou sal ou N-óxido deste, em que R¹ é C₁₋₁₀ alquila; R² é hidrogênio, metila, etila, C₁₋₂ haloalquila, ou halogênio; R³ é hidrogênio, metila, etila, C₁₋₂ haloalquila, ou halogênio; R⁴ é hidrogênio, metila, ou halogênio; R⁵ é hidrogênio, metila, ou halogênio; R⁶ é hidrogênio, metila, etila, ou halogênio; Z é hidrogênio, hidróxi, nitro, ciano, rodano, formila, G, G-S-, G-S-S-, G-A-, R⁷R⁸N-, R⁷R⁸N-S-, R⁷R⁸N-A-, G-O-A-, G-S-A-, (R¹⁰O)(R¹¹O)P(X)-, (R¹⁰O)(R¹¹S)P(X)-, (R¹⁰O)(R¹¹)P(X)-, (R¹⁰S)(R¹¹S)P(X)-, (R¹⁰O)(R¹⁴R¹⁵N)P(X)-, (R¹¹)(R¹⁴R¹⁵N)P(X)-,

$(R^{14}R^{15}N)(R^{16}R^{17}N)P(X)-$, $G-N=CH-$, $G-O-N=CH-$, $N\equiv C-N=CH-$, ou Z é um grupo de fórmula (II)



(II)

em que B é S-, S-S-, S(O)-, -C(O)-, ou $(CH_2)_n-$, n é um número inteiro de 1 a 6 inclusive e R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , e R^6 são como definidos acima; G é C_{1-10} alquila opcionalmente substituída, C_{2-10} alquenila opcionalmente substituída, C_{2-10} alquinila opcionalmente substituída, C_{3-7} cicloalquila opcionalmente substituída, C_{3-7} cicloalquenila opcionalmente substituída, arila opcionalmente substituída, heteroarila opcionalmente substituída ou heterociclila opcionalmente substituída; A é S(O), SO_2 , C(O) ou C(S); R^7 , R^8 e R^9 são cada independentemente hidrogênio ou G; ou R^7 e R^8 juntos com o átomo N ao qual eles são ligados formam um grupo $N=CR^{12}R^{13}$; ou R^7 e R^8 juntos com o átomo N ao qual eles são ligados formam um anel heterocíclico de cinco, seis ou sete membros, cujo anel heterocíclico opcionalmente contém um ou dois heteroátomos adicionais selecionados de O, N ou S, e é opcionalmente substituído por um ou dois grupos C_{1-6} alquila; R^{10} e R^{11} são cada independentemente C_1-C_6 alquila, benzila, ou fenila, em que o grupo fenila é opcionalmente substituído com halogênio, nitro, ciano, C_{1-3} alquila, C_{1-3} haloalquila, C_{1-3} alcóxi, ou C_{1-3} haloalcóxi; R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} e R^{17} são cada independentemente hidrogênio ou C_1-C_6 alquila; X é O ou S; contanto que pelo menos um dos grupos R^2 , R^3 , R^4 , R^5 e R^6 seja flúor.

Para evitar dúvida, o termo "composto" como usado aqui inclui todos os sais e N-óxidos do referido composto.

Os compostos de fórmula (I) podem existir em formas geométricas diferentes ou isoméricas óticas ou tautoméricas diferentes. Um ou mais centros de quiralidade podem estar presentes, por exemplo, no átomo de carbono quiral CHR^1 ou uma unidade de carbonoquiral no grupo G, ou uma unidade -S(O)- quiral no grupo Z, em cujo caso compostos da fórmula (I) podem estar presentes como enantiômeros puros, misturas de enantiôme-

ros, diastereômeros puros ou misturas de diastereômeros. Podem existir ligações duplas presentes na molécula, tal como ligações C=C ou C=N, em cujo caso compostos de fórmula (I) podem existir como isômeros simples de misturas de isômeros. Centros de tautomerização podem estar presentes.

5 Esta invenção abrange todos tais isômeros e tautômeros e misturas dos mesmos em todas as proporções bem como formas isotópicas tais como compostos deuterados.

Sais de adição de ácido adequados incluem aqueles com um ácido inorgânico tal como ácidos clorídrico, bromídrico, sulfúrico, nítrico e fos-
10 fórico, ou um ácido carboxílico orgânico tal como ácidos oxálico, tartárico, láctico, butírico, toluico, hexanoico e ftálico, ou ácidos sulfônicos tais como ácidos metano, benzeno e toluenossulfônico. Outros exemplos de ácidos carboxílicos orgânicos incluem haloácidos tal como ácido trifluoroacético.

N-óxidos são formas oxidadas de aminas terciárias ou formas
15 oxidadas de nitrogênio contendo compostos heteroaromáticos. Eles são descritos em muitos livros, por exemplo, em "Heterocyclic N-oxides" por Angelo Albini e Silvio Pietra, CRC Press, Boca Raton, Florida, 1991.

Cada porção alquila sozinha ou como parte de um grupo maior (tal como G, alcóxi, alcoxicarbonila, alquilcarbonila, alquilaminocarbonila,
20 dialquilaminocarbonila) é uma cadeia linear ou ramificada e é, por exemplo, metila, etila, n-propila, n-butila, n-pentila, n-hexila, isopropila, n-butila, sec-butila, isobutila, terc-butila ou neopentila. Os grupos alquila são adequadamente grupos C₁ a C₁₀ alquila, porém são preferivelmente C₁-C₈, ainda mais preferivelmente C₁-C₆ e mais preferivelmente grupos C₁-C₄ alquila.

25 Anel ou cadeia formando grupos alquilenos, alquenileno e alquini-la pode opcionalmente ser também substituído por um ou mais halogênio, C₁₋₃ alquila e/ou C₁₋₃ alcóxi.

Quando presente, os substituintes opcionais em uma porção al-
30 quila (sozinhos ou como parte de um grupo maior tal como G, alcóxi, alcoxi-carbonila, alquilcarbonila, alquilaminocarbonila, dialquilaminocarbonila) incluem um ou mais de halogênio, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, C₃₋₇ cicloalquila (ela própria opcionalmente substituída com C₁₋₆ alquila ou halogê-

nio), C₅₋₇ cicloalquenila (ela própria opcionalmente substituída com C₁₋₆ alquila ou halogênio), hidróxi, C₁₋₁₀ alcóxi, C₁₋₁₀ alcóxi(C₁₋₁₀)alcóxi, tri(C₁₋₄) alquilsilil(C₁₋₆)alcóxi, C₁₋₆ alcóxicarbonil(C₁₋₁₀)alcóxi, C₁₋₁₀ haloalcóxi, aril(C₁₋₄) alcóxi (onde o grupo arila é opcionalmente substituído), C₃₋₇ cicloalquilóxi (onde o grupo cicloalquila é opcionalmente substituído com C₁₋₆ alquila ou halogênio), C₂₋₁₀ alquenilóxi, C₂₋₁₀ alquinilóxi, mercapto, C₁₋₁₀ alquiltio, C₁₋₁₀ haloalquiltio, aril(C₁₋₄)alquiltio (onde o grupo arila é opcionalmente substituído), C₃₋₇ cicloalquiltio (onde o grupo cicloalquila é opcionalmente substituído com C₁₋₆ alquila ou halogênio), tri(C₁₋₄)alquilsilil(C₁₋₆)alquiltio, ariltio (onde o grupo arila é opcionalmente substituído), C₁₋₆ alquilsulfonila, C₁₋₆ haloalquilsulfonila, C₁₋₆ alquilsulfinila, C₁₋₆ haloalquilsulfinila, arilsulfonila (onde o grupo arila pode ser opcionalmente substituído), tri(C₁₋₄)alquilsilila, arildi(C₁₋₄) alquilsilila, (C₁₋₄)alquildiarilsilila, triarilsilila, aril(C₁₋₄)alquiltio(C₁₋₄)alquila, arilóxi(C₁₋₄)alquila, formila, C₁₋₁₀ alquilcarbonila, hidroxicarbonila, C₁₋₁₀ alcóxicarbonila, aminocarbonila, C₁₋₆ alquilaminocarbonila, di(C₁₋₆alquil) aminocarbonila, N-(C₁₋₃ alquil)-N-(C₁₋₃ alcóxi)aminocarbonila, C₁₋₆ alquilcarbonilóxi, arilcarbonilóxi (onde o grupo arila é opcionalmente substituído), C₁₋₆ alquilaminocarbonilóxi, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonilóxi, oximas e oximéteres tal como =NO-C₁₋₆ alquila, =NO-C₁₋₆ haloalquila e =NO-C₁₋₂alquil-arila (ela própria opcionalmente substituída), arila (ela própria opcionalmente substituída), heteroarila (ela própria opcionalmente substituída), heterociclila (ela própria opcionalmente substituída com C₁₋₆ alquila ou halogênio), arilóxi (onde o grupo arila é opcionalmente substituído), heteroarilóxi, (onde o grupo heteroarila é opcionalmente substituído), heterociclíloxi (onde o grupo heterociclila é opcionalmente substituído com C₁₋₆ alquila ou halogênio), amino, C₁₋₆ alquilamino, di(C₁₋₆)alquilamino, C₁₋₆ alquilcarbonilamino, (C₁₋₆)alquilcarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, C₂₋₆ alquenilcarbonila, C₂₋₆ alquinilcarbonila, C₃₋₆ alqueniloxicarbonila, C₃₋₆ alquiniloxicarbonila, ariloxicarbonila (onde o grupo arila é opcionalmente substituído) e arilcarbonila (onde o grupo arila é opcionalmente substituído).

Porções alquenila e alqunila podem estar na forma de cadeias lineares ou ramificadas, e as porções alquenila, onde apropriado, podem ser

de qualquer uma das configurações (E)- ou (Z). Exemplos são vinila, alila e propargila. Porções alquenila e alquinila podem conter uma ou mais ligações duplas e/ou triplas em qualquer combinação. É entendido, que alenila e alquilinilalquenila são inclusos nestes termos.

5 Quando presente, os substituintes opcionais em alquenila ou alquinila incluem aqueles substituintes opcionais fornecidos acima para uma porção alquila.

No contexto desta especificação acila é C₁₋₆ alquilcarbonila opcionalmente substituída (por exemplo, acetila), C₂₋₆ alquenilcarbonila opcionalmente substituída, C₃₋₆ cicloalquilcarbonila opcionalmente substituída (por exemplo, ciclopropilcarbonila, C₂₋₆ alquinilcarbonila opcionalmente substituída, arilcarbonila opcionalmente substituída (por exemplo, benzoila) ou heteroarilcarbonila opcionalmente substituída (por exemplo, nicotinoila ou isonicotinoila).

15 Halogênio é flúor, cloro, bromo ou iodo.

Grupos haloalquila são grupos alquila que são substituídos com um ou mais dos mesmos ou diferentes átomos de halogênio e são, por exemplo, CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, CH₂F, CH₂Cl, CH₂Br, CH₃CHF, (CH₃)₂CF, CF₃CH₂ ou CHF₂CH₂.

20 No contexto da presente especificação, os termos "arila", "anel aromático" e "sistema de anel aromático" referem-se aos sistemas de anel que podem ser mono-, bi- ou tricíclico. Exemplos de tais anéis incluem fenila, naftalenila, antracena, indenila ou fenantrenila. Um grupo arila preferido é fenila. Em adição, os termos "heteroarila", "anel heteroaromático" ou "sistema de anel heteroaromático" referem-se a um sistema de anel aromático contendo pelo menos um heteroátomo e consistindo em um anel simples ou em dois ou mais anéis fundidos. Preferivelmente, anéis simples conterão até três e sistemas bicíclicos até quatro heteroátomos que preferivelmente serão escolhidos de nitrogênio, oxigênio e enxofre. Exemplos de tais grupos incluem furila, tienila, pirrolila, pirazolila, imidazolila, 1,2,3-triazolila, 1,2,4-triazolila, oxazolila, isoxazolila, tiazolila, isotiazolila, 1,2,3-oxadiazolila, 1,2,4-oxadiazolila, 1,3,4-oxadiazolila, 1,2,5-oxadiazolila, 1,2,3-tiadiazolila, 1,2,4-tiadiazolila,

lila, 1,3,4-tiadiazolila, 1,2,5-tiadiazolila, piridila, pirimidinila, piridazinila, pirazinila, 1,2,3-triazinila, 1,2,4-triazinila, 1,3,5-triazinila, benzofurila, benzisofurila, benzotienila, benzisotienila, indolila, isoindolila, indazolila, benzotiazolila, benzisotiazolila, benzoxazolila, benzisoxazolila, benzimidazolila, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinila, isoquinolinila, cinolinila, ftalazinila, quinazolinila, quinoxalinila, naftiridinila, benzotriazinila, purinila, pteridinila e indolizinila. Exemplos preferidos de radicais heteroaromáticos incluem piridila, pirimidila, triazinila, tienila, furila, oxazolila, isoxazolila, 2,1,3-benzoxadiazol e tiazolila.

Os termos heterociclo e heterociclila referem-se a um sistemas de anel não-aromático preferivelmente monocíclico ou bicíclico contendo até 10 átomos incluindo um ou mais (preferivelmente um ou dois) heteroátomos selecionados de O, S e N. Exemplos de tais anéis incluem 1,3-dioxolano, oxetano, tetra-hidrofurano, morfolina, tiomorfolina e piperazina.

Quando presente, os substituintes opcionais em heterociclila incluem C_{1-6} alquila e C_{1-6} haloalquila, um grupo oxo (deixando um dos átomos de carbono no anel para estar na forma de um grupo ceto), bem como aqueles substituintes opcionais fornecidos acima para uma porção alquila.

Cicloalquila inclui ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e ciclohexila. Cicloalquilalquila é preferencialmente ciclopropilmetila. Cicloalquenila inclui ciclopentenila e ciclo-hexenila.

Quando presente, os substituintes opcionais em cicloalquila ou cicloalquenila incluem C_{1-3} alquila bem como aqueles substituintes opcionais fornecidos acima para uma porção alquila.

Anéis carbocíclicos incluem grupos arila, cicloalquila e cicloalquenila.

Quando presente, os substituintes opcionais em arila ou heteroarila são selecionados independentemente, de halogênio, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, C_{1-6} alquila, C_{1-6} haloalquila, C_{1-6} alcóxi-(C_{1-6})alquila, C_{2-6} alquenila, C_{2-6} haloalquenila, C_{2-6} alquinila, C_{3-7} cicloalquila (ela própria opcionalmente substituída com C_{1-6} alquila ou halogênio), C_{5-7} cicloalquenila (ela própria opcionalmente substituída com C_{1-6} alquila ou halogênio), hidróxi, C_{1-10} alcóxi, C_{1-10} alcóxi(C_{1-10})alcóxi, tri(C_{1-4})alquil-silil(C_{1-6})alcóxi, C_{1-6} al-

coxicarbonil(C₁₋₁₀)alcóxi, C₁₋₁₀ haloalcóxi, aril(C₁₋₄)alcóxi (onde o grupo arila é
 opcionalmente substituído com halogênio ou C₁₋₆ alquila), C₃₋₇ cicloalquilóxi
 (onde o grupo cicloalquila é opcionalmente substituído com C₁₋₆ alquila ou
 halogênio), C₂₋₁₀ alquenilóxi, C₂₋₁₀ alquinilóxi, mercapto, C₁₋₁₀ alquiltio, C₁₋₁₀
 5 haloalquiltio, aril(C₁₋₄)alquiltio, C₃₋₇ cicloalquiltio (onde o grupo cicloalquila é
 opcionalmente substituído com C₁₋₆ alquila ou halogênio), tri(C₁₋₄)-alquilsilil
 (C₁₋₆)alquiltio, ariltio, C₁₋₆ alquilsulfonila, C₁₋₆ haloalquilsulfonila, C₁₋₆ alquilsul-
 finila, C₁₋₆ haloalquilsulfonila, arilsulfonila, C₁₋₁₀ alquilcarbonila, hidroxicarboni-
 la, C₁₋₁₀ alcóxicarbonila, aminocarbonila, C₁₋₆ alquilaminocarbonila, di(C₁₋₆
 10 alquil)-aminocarbonila, N-(C₁₋₃ alquil)-N-(C₁₋₃ alcóxi)aminocarbonila, C₁₋₆ al-
 quilcarbonilóxi, arilcarbonilóxi, C₁₋₆alquilaminocarbonilóxi, di(C₁₋₆) alquilami-
 nocarbonilóxi, arila (ela própria opcionalmente substituída com C₁₋₆ alquila
 ou halogênio), heteroarila (ela própria opcionalmente substituída com C₁₋₆
 alquila ou halogênio), heterociclila (ela própria opcionalmente substituída
 15 com C₁₋₆ alquila ou halogênio), arilóxi (onde o grupo arila é opcionalmente
 substituído com C₁₋₆ alquila ou halogênio), heteroarilóxi (onde o grupo hete-
 roarila é opcionalmente substituído com C₁₋₆ alquila ou halogênio), heteroci-
 clilóxi (onde o grupo heterociclila é opcionalmente substituído com C₁₋₆ alqui-
 la ou halogênio), amino, C₁₋₆ alquilamino, di(C₁₋₆)alquilamino, C₁₋₆ alquilcar-
 20 bonilamino, C₁₋₆alquilcarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, arilcarbonila (onde o grupo
 arila é ele próprio opcionalmente substituído com halogênio ou C₁₋₆ alquila),
 ou duas posições adjacentes em um sistema arila ou heteroarila podem ser
 ciclizadas para formar um anel carbocíclico ou heterocíclico de 4, 5, 6 ou 7
 membros, ele próprio opcionalmente substituído com halogênio ou C₁₋₆ alqui-
 25 la. Mais substituintes para arila ou heteroarila incluem arilcarbonilamino (on-
 de o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), C₁₋₆ alcóxicarbo-
 nilamino, C₁₋₆alcóxicarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, ariloxicarbonilamino (onde o
 grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), ariloxicarbonil-N-
 (C₁₋₆)alquilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogê-
 30 nio), arilsulfonilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou
 halogênio), arilsulfonil-N-(C₁₋₆)alquilamino (onde o grupo arila é substituído
 por C₁₋₆ alquila ou halogênio), aril-N-(C₁₋₆)alquilamino (onde o grupo arila é

substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), arilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), heteroaril amino (onde o grupo heteroarila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), heterociclicilamino (onde o grupo heterociclicila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), amino-

5 carbonilamino, C₁₋₆ alquilaminocarbonilamino, di(C₁₋₆) alquilaminocarbonilamino, arilaminocarbonilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), aril-N-(C₁₋₆)alquilaminocarbonilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio), C₁₋₆ alquilaminocarbonil-N-(C₁₋₆) alquilamino, di(C₁₋₆)alquilaminocarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino, arilaminocarbo-

10 nil-N-(C₁₋₆)alquilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio) e aril-N-(C₁₋₆)alquilaminocarbonil-N-(C₁₋₆)alquilamino (onde o grupo arila é substituído por C₁₋₆ alquila ou halogênio).

Para porções fenila substituídas, grupos heterociclicila e heteroarila, é preferido que um ou mais substituintes são independentemente selecionados de halogênio, C₁₋₆ alquila, C₁₋₆ haloalquila, C₁₋₆ alcóxi(C₁₋₆)alquila, C₁₋₆ alcóxi, C₁₋₆ haloalcóxi, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ haloalquiltio, C₁₋₆ alquilsulfinila, C₁₋₆ haloalquilsulfinila, C₁₋₆ alquilsulfonila, C₁₋₆ haloalquilsulfonila, C₂₋₆ alquena-

15 nila, C₂₋₆ haloalquena, C₂₋₆ alquinila, C₃₋₇ cicloalquila, nitro, ciano, hidroxicarbonila, C₁₋₆ alquilcarbonila, C₁₋₆ alcoxicarbonila, arila, heteroarila, C₁₋₆ alquilamino, di(C₁₋₆ alquil)amino, C₁₋₆ alquilaminocarbonila, ou di(C₁₋₆ alquil) aminocarbonila.

20

Grupos haloalquena são grupos alquena que são substituídos com um ou mais dos mesmos ou diferentes átomos de halogênio.

Deve ser entendido que substituintes de dialquilamino incluem aqueles onde os grupos dialquila juntos com o átomo N ao qual eles são ligados formam um anel heterocíclico de cinco, seis ou sete membros que podem conter um ou dois heteroátomos adicionais selecionados de O, N ou S e que são opcionalmente substituídos por um ou dois grupos (C₁₋₆)alquila independentemente selecionados. Quando anéis heterocíclicos são formados juntando dois grupos em um átomo N, os anéis resultantes são adequadamente pirrolidina, piperidina, N-metilpiperazina, tiomorfolina e morfolina

25

30 cada um dos quais pode ser substituído por um ou dois grupos (C₁₋₆) alquila

independentemente selecionados.

Preferivelmente os substituintes opcionais em uma porção alquila incluem um ou mais de halogênio, nitro, ciano, hidroxicarbonila, C₁₋₁₀ alcóxi (ele próprio opcionalmente substituído por C₁₋₁₀ alcóxi), aril(C₁₋₄)alcóxi, C₁₋₁₀ alquiltio, C₁₋₁₀ alquilcarbonila, C₃₋₅ cicloalquilcarbonila, C₁₋₁₀ alcoxicarbonila, C₁₋₆ alquilaminocarbonila, di-(C₁₋₆ alquil)-aminocarbonila, C₁₋₆ alquilcarbonilóxi, fenila opcionalmente substituída, heteroarila, arilóxi, arilcarbonilóxi, heteroarilóxi, heterociclila, heterociclíloxi, C₃₋₇ cicloalquila (ela própria opcionalmente substituída com (C₁₋₆)alquila ou halogênio), C₃₋₇ cicloalquilóxi, C₅₋₇ cicloalquenila, C₁₋₆ alquilsulfonila, C₁₋₆ alquilsulfinila, tri(C₁₋₄)alquilsilila, tri(C₁₋₄)alquilsilil(C₁₋₆)alcóxi, arildi(C₁₋₄)alquilsilila, (C₁₋₄)alquildiarilsilila e triarilsilila.

Preferivelmente os substituintes opcionais em alquenila ou alquinila incluem um ou mais de halogênio, arila e C₃₋₇ cicloalquila.

Um substituinte opcional preferido para heterociclila é C₁₋₃ alquila.

Preferivelmente os substituintes opcionais para cicloalquila incluem halogênio, ciano e C₁₋₆ alquila.

Os substituintes opcionais para cicloalquenila preferivelmente incluem C₁₋₃ alquila, halogênio e ciano.

Em modalidades particularmente preferidas da invenção, os grupos preferidos para R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, e Z em qualquer combinação dos mesmos são como mencionados abaixo.

Em certas modalidades, R¹ é uma C₁-C₆-alquila de cadeia linear ou ramificada. Em modalidades preferidas, R¹ é metila, etila, n-propila, i-propila, n-butila, s-butila, i-butila, n-pentila, 2-metilbutila, 3-metilbutila, 4-metilbutila, 2,3-dimetil-propila, n-hexila, 2-metil-pentila, 3-metilpentila, 4-metilpentila, 2,4-dimetilbutila ou 5-metil-hexila. Em modalidades mais preferidas, R¹ é metila, etila, n-propila, n-butila ou n-pentila. Nas modalidades mais preferidas, R¹ é etila ou n-propila.

Em certas modalidades, incluindo qualquer uma daquelas descritas anteriormente, R² é metila ou halogênio; mais preferivelmente R² é

fluorometila, difluorometila, trifluorometila, metila, flúor ou cloro; mais preferivelmente R^2 é metila, flúor ou cloro.

Em certas modalidades, incluindo qualquer uma daquelas descritas anteriormente, R^3 é hidrogênio, metila, halometila ou halogênio; mais preferivelmente R^3 é metila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, flúor ou cloro.

Em certas modalidades, incluindo qualquer uma daquelas descritas anteriormente, R^4 é hidrogênio ou metila; entretanto, mais preferivelmente R^4 é hidrogênio. Em certas modalidades, incluindo qualquer uma daquelas descritas anteriormente, R^5 e R^6 são cada independentemente hidrogênio, metila ou halogênio; mais preferivelmente hidrogênio ou flúor.

Em certas modalidades preferidas, R^4 é hidrogênio, R^2 é metila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, cloro, ou flúor, e um ou mais dos grupos R^3 , R^5 e R^6 são diferentes para hidrogênio.

Em outras modalidades preferidas, R^2 é diferente para hidrogênio e R^3 é metila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, flúor ou cloro.

Em mais modalidades preferidas, incluindo quaisquer modalidades descritas anteriormente, pelo menos um de R^2 , R^3 , R^5 e R^6 é flúor.

Em certas modalidades, incluindo qualquer uma daquelas descritas anteriormente, Z é hidrogênio, ciano, formila, C_{1-6} alquila [opcionalmente substituída por 1-7 átomos de flúor, 1-3 átomos de cloro, 1-3 átomos de bromo, um grupo ciano, 1-2 grupos C_{1-3} alcóxi, um grupo C_{1-3} haloalcóxi, um grupo C_{1-3} alquiltio, um grupo C_{1-3} haloalquiltio, um grupo alilóxi, um grupo propargilóxi, um grupo C_{3-6} cicloalquila, fenila (ela própria opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C_{1-3} alquila, C_{1-3} alcóxi), um grupo C_{1-3} alquilcarbonilóxi, um grupo C_{1-3} alcoxycarbonila, um grupo C_{1-3} alquilcarbonila, benzoíla (ele próprio opcionalmente substituído por halogênio, nitro, C_{1-3} alquila, C_{1-3} alcóxi, ou um grupo ciano)], C_{3-6} alquenila, C_{3-6} haloalquenila, C_{3-6} alquinila, C_{1-6} alquiltio, C_{1-6} haloalquiltio, C_{1-6} cianoalquiltio, feniltio (opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C_{1-3} alquila, ou C_{1-3} alcóxi), C_{1-6} alquilditio, di(C_{1-4} alquil)aminotio, C_{1-6} alquilcarbonila (opcionalmente substituída por halogênio, ciano, ou C_{1-3} alcóxi), C_{2-6} alquenilcarbonila, C_{3-6}

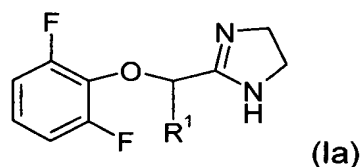
cicloalquilcarbonila, fenilcarbonila (opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), heteroarilcarbonila (opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₆ alcoxycarbonila, C₁₋₆ alquiltio-carbonila, feniltio-carbonila (opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), N,N-di C₁₋₃ alquilaminocarbonila, C₁₋₃ alquilaminocarbonila, C₃₋₅ alquenilaminocarbonila, C₃₋₅ alquinilaminocarbonila, fenilaminocarbonila (em que o grupo fenila pode ser opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), N-fenil-N-metil aminocarbonila (em que o grupo fenila pode ser opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₆ alcoxitionocarbonila, C₁₋₆ alquiltiotionocarbonila, feniltiotionocarbonila (opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), N,N-di C₁₋₃ alquilaminotionocarbonila, C₁₋₃ alquilaminotionocarbonila, fenilaminotionocarbonila (em que o grupo fenila pode ser opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), N-fenil-N-metil aminotionocarbonila (em que o grupo fenila pode ser opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₃ alquil-sulfonila, C₁₋₃ haloalquilsulfonila, C₁₋₃ alquenilsulfonila, fenilsulfonila (opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), N,N-di C₁₋₃ alquilaminossulfonila, di C₁₋₃ alcóxi-P(=O)-, diC₁₋₃ alquiltio-P(=O)-, di C₁₋₃ alcóxi-P(=S)-, di C₁₋₃ alquiltio-P(=S)-, (C₁₋₃ alcóxi)(fenil)P(=O)-, (C₁₋₃ alcóxi)(fenil)P(=S)-, C₁₋₃ alquil-N=CH-, C₁₋₃ alcóxi-N=CH-, ciano-N=CH-, fenil-N=CH- (em que a fenila é opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi), 2-piridil-N=CH-, 3-piridil-N=CH-, 2-tiazolil-N=CH-, ou um composto de fórmula (II) em que B é S-, ou CH₂-.

Mais preferivelmente Z é hidrogênio, ciano, formila, C₁₋₃ alquila, C₁₋₃ haloalquila, C₁₋₃ cianoalquila, C₁₋₃ alcóxi-C₁₋₃ alquila, C₁₋₃ benzilóxi-C₁₋₃ alquila, alila, propargila, C₁₋₆ alquiltio, C₁₋₆ haloalquiltio, feniltio (opcionalmente substituído por halogênio, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₆ alquilcarbonila, fenilcarbonila (opcionalmente substituída por halogênio, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₆ alcoxycarbonila, C₁₋₃ alquilaminocarbonila, fenilaminocarbonila (em que o grupo fenila pode ser opcionalmente substituído por halogênio,

C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₃ alquilaminotionocarbonila, fenilaminotionocarbonila (em que o grupo fenila pode ser opcionalmente substituído por halogênio, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi), C₁₋₃ alquilsulfonila, C₁₋₃ haloalquilsulfonila, di C₁₋₃ alcóxi-P(=O)-, C₁₋₃ alcóxi-N=CH-, ciano-N=CH-, 2-piridil-N=CH-.

5 Mais preferivelmente Z é hidrogênio.

Os compostos descritos abaixo são ilustrativos de novos compostos da invenção. Tabela I fornece 30 compostos de fórmula Ia



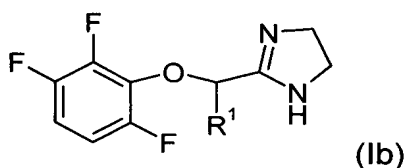
em que os valores de R¹ são fornecidos na Tabela 1.

Tabela 1: Valores de R¹

Composto N°	R ¹
I-1	CH ₃
I-2	CH ₂ CH ₃
I-3	CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-4	CH(CH ₃) ₂
I-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-6	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
I-7	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
I-8	C(CH ₃) ₃
I-9	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-10	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-11	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
I-12	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
I-13	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
I-14	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
I-15	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
I-16	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-17	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-18	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃

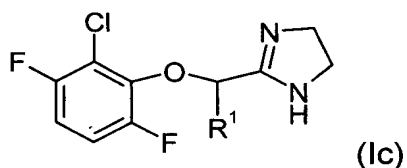
Composto N°	R ¹
I-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
I-20	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
I-21	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
I-22	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
I-23	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-24	CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
I-25	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CH ₃) ₂
I-26	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-27	CH ₂ CH(CH ₂ CH ₃) ₂
I-28	CH ₂ CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
I-29	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
I-30	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃

30 Compostos de fórmula Ib



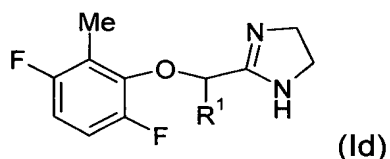
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N°s II-1 a II-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Ic



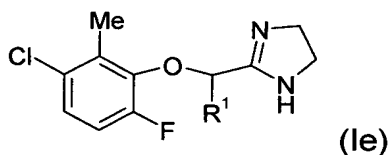
5 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N°s III-1 a III-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Id



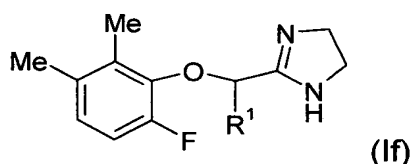
em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os IV-1 a IV-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Ie



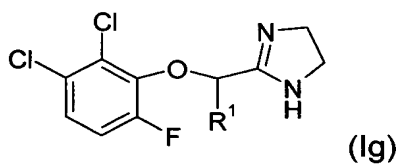
5 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os V-1 a V-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula If



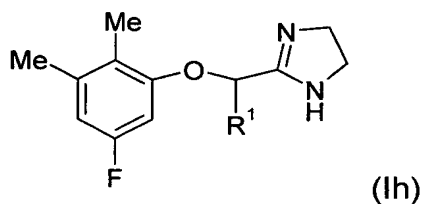
10 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os VI-1 a VI-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Ig



15 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os VII-1 a VII-30, respectivamente.

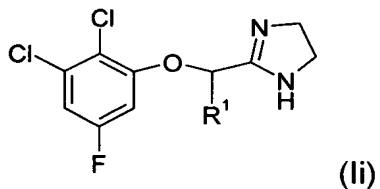
30 Compostos de fórmula Ih



em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os VIII-1 a VIII-30, respectivamente.

mente.

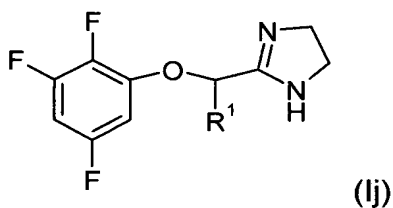
30 Compostos de fórmula li



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os IX-1 a IX-30, respectivamente.

5

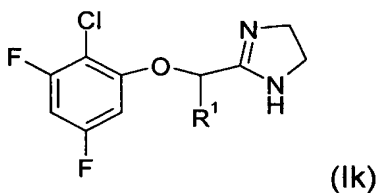
30 Compostos de fórmula lj



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os X-1 a X-30, respectivamente.

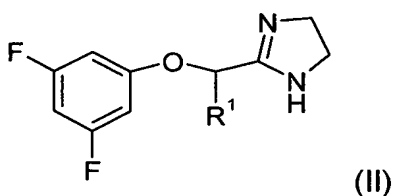
10

30 Compostos de fórmula lk



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XI-1 a XI-30, respectivamente.

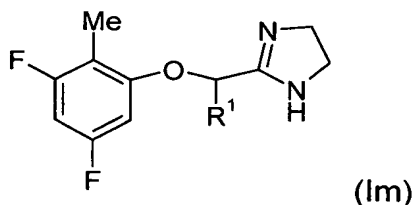
30 Compostos de fórmula ll



15 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos

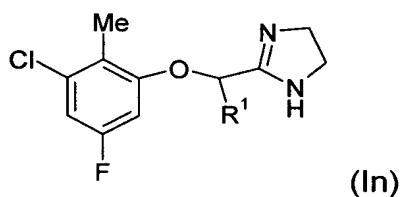
I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXVIII-1 a XXVIII-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Im



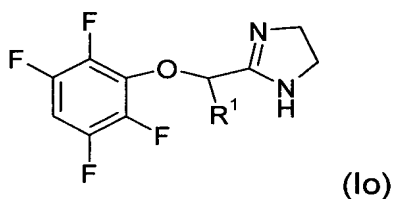
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XII-1 a XII-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula In



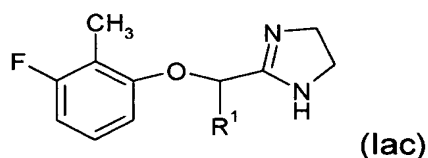
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XIII-1 a XIII-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Io



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XIV-1 a XIV-30, respectivamente.

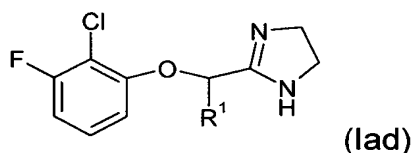
15 30 Compostos de fórmula Iac



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos

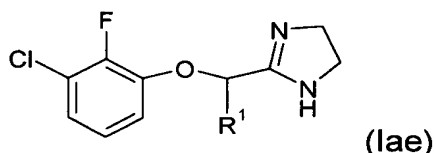
I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXIX-1 a XXIX -30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Iad



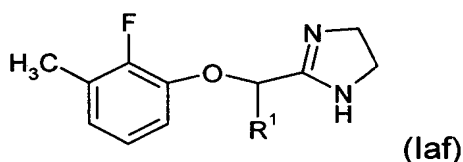
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXX-1 a XXX-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Iae



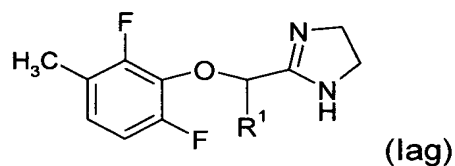
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXI-1 a XXXI-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Iaf



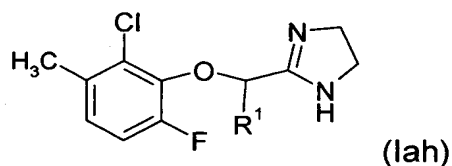
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXII-1 a XXXII-30, respectivamente.

15 30 Compostos de fórmula Iag



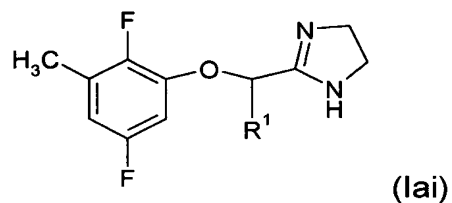
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXIII-1 a XXXIII-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula lah



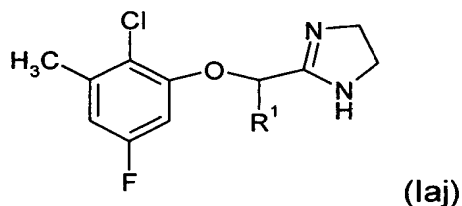
em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXIV-1 a XXXIV-30, respectivamente.

5 30 Compostos de fórmula lai



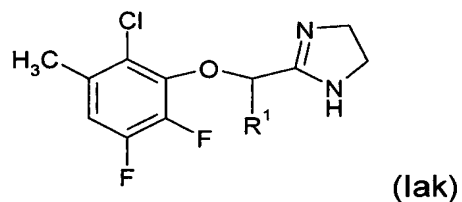
em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXV-1 a XXXV-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula laj



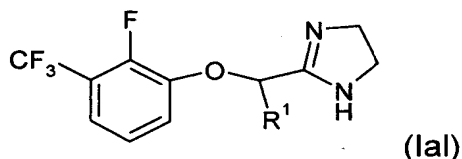
10 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXVI-1 a XXXVI-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula lak



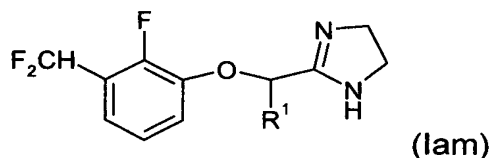
15 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXVII-1 a XXXVII-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Ial



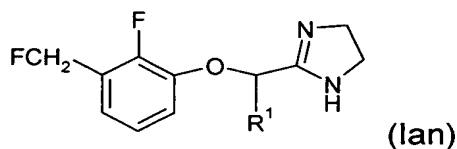
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXVIII-1 a XXXVIII-30, respectivamente.

5 30 Compostos de fórmula lam



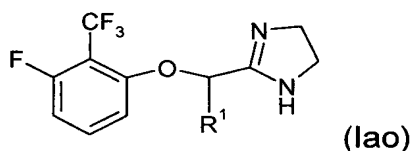
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XXXIX-1 a XXXIX-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula lan



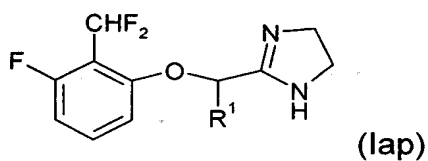
10 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XL-1 a XL-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula lao



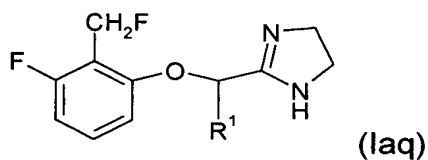
15 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XLI-1 a XLI-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula lap



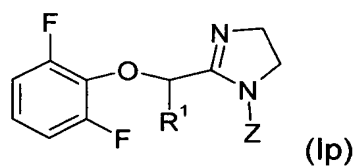
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XLII-1 a XLII-30, respectivamente.

30 Compostos de fórmula Iaq



5 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos I-1 a I-30, são designados como compostos N^os XLIII-1 a XLIII-30, respectivamente.

Tabela 2 fornece 194 compostos de fórmula Ip.



em que os valores de R¹ e Z são fornecidos na Tabela 2 abaixo.

10 Tabela 2:

Composto N ^o	R ¹	Z
XV-1	Et	-CN
XV-2	Et	-NO ₂
XV-3	Et	Me
XV-4	Et	Et
XV-5	Et	Pr
XV-6	Et	Bu
XV-7	Et	Alila
XV-8	Et	Isopropenila
XV-9	Et	Vinila
XV-10	Et	Propargila
XV-11	Et	but-2-en1-ila

Composto N°	R ¹	Z
XV-12	Et	but-1-en-1-ila
XV-13	Et	but-3-en1-ila
XV-14	Et	but-1-en2-ila
XV-15	Et	but-2-en2-ila
XV-16	Et	but-3-en2-ila
XV-17	Et	Metoximetila
XV-18	Et	Etoximetila
XV-19	Et	Propoximetila
XV-20	Et	Benziloximetila
XV-21	Et	1-metoxietila
XV-22	Et	2-metoxietila
XV-23	Et	-CH ₂ OCOMe
XV-24	Et	-CH ₂ OCOEt
XV-25	Et	-CH ₂ OCOiPr
XV-26	Et	-CH ₂ OCOtBu
XV-27	Et	-CH ₂ OCOPh
XV-28	Et	-CH ₂ OCOOEt
XV-29	Et	-CH=N-OMe
XV-30	Et	-CH=N-OEt
XV-31	Et	-CH=N-Me
XV-32	Et	-CH=N-Et
XV-33	Et	-CH=N-Ph
XV-34	Et	-CH=N-(2-piridila)
XV-35	Et	-CH=N-C□N
XV-36	Et	-P(O)(OEt) ₂
XV-37	Et	-P(S)(OEt) ₂
XV-38	Et	-P(O)(OMe) ₂
XV-39	Et	-P(S)(OMe) ₂
XV-40	Et	-P(O)(OPh) ₂
XV-41	Et	-P(S)(OPh) ₂

Composto N°	R ¹	Z
XV-42	Et	-P(O)(OBn) ₂
XV-43	Et	-P(S)(OBn) ₂
XV-44	Et	-P(O)(NMe ₂) ₂
XV-45	Et	-P(S)(NMe ₂) ₂
XV-46	Et	-P(O)(NEt ₂) ₂
XV-47	Et	-P(S)(NEt ₂) ₂
XV-48	Et	-OH
XV-49	Et	-OMe
XV-50	Et	-OAc
XV-51	Et	-OBz
XV-52	Et	SMe
XV-53	Et	SCCl ₃
XV-54	Et	SPh
XV-55	Et	S(O)Ph
XV-56	Et	S(O) ₂ Me
XV-57	Et	S(O) ₂ CF ₃
XV-58	Et	S(O) ₂ Ph
XV-59	Et	C(O)Me
XV-60	Et	C(O)Et
XV-61	Et	C(O)iPr
XV-62	Et	C(O)tBu
XV-63	Et	C(O)CH ₂ OMe
XV-64	Et	C(O)CH ₂ Cl
XV-65	Et	C(O)CHCl ₂
XV-66	Et	C(O)CCl ₃
XV-67	Et	C(O)Ph
XV-68	Et	C(O)(4-fluorofenila)
XV-69	Et	C(O)(4-clorofenila)
XV-70	Et	C(O)(4-metoxifenila)
XV-71	Et	C(O)(2,4-diclorofenila)

Composto N°	R ¹	Z
XV-72	Et	C(O)(2,6-diclorofenila)
XV-73	Et	C(O)(2,6-difluorofenila)
XV-74	Et	C(O)OMe
XV-75	Et	C(O)OEt
XV-76	Et	C(O)OiPr
XV-77	Et	C(O)OtBu
XV-78	Et	C(O)OPh
XV-79	Et	C(O)O(4-fluorofenila)
XV-80	Et	C(O)O(4-clorofenila)
XV-81	Et	C(O)O(4-metoxifenila)
XV-82	Et	C(O)O(2,4-diclorofenila)
XV-83	Et	C(O)O(2,6-diclorofenila)
XV-84	Et	C(O)O(2,6-difluorofenila)
XV-85	Et	C(O)NHMe
XV-86	Et	C(O)NMe ₂
XV-87	Et	C(O)NH ₂ Et
XV-88	Et	C(O)NEt ₂
XV-89	Et	C(O)NHiPr
XV-90	Et	C(O)NHtBu
XV-91	Et	C(O)NHPh
XV-92	Et	C(O)NH(4-fluorofenila)
XV-93	Et	C(O)NH(4-clorofenila)
XV-94	Et	C(O)NH(4-metoxifenila)
XV-95	Et	C(O)NH(2,4-diclorofenila)
XV-96	Et	C(O)NH(2,6-diclorofenila)
XV-97	Et	C(O)NH(2,6-difluorofenila)
XV-98	nPr	-CN
XV-99	nPr	-NO ₂
XV-100	nPr	Me
XV-101	nPr	Et

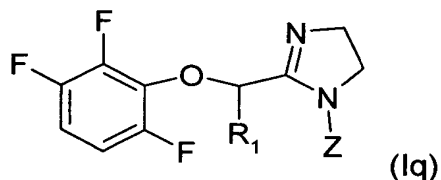
Composto N°	R ¹	Z
XV-102	nPr	Pr
XV-103	nPr	Bu
XV-104	nPr	Alila
XV-105	nPr	Isopropenila
XV-106	nPr	Vinila
XV-107	nPr	Propargila
XV-108	nPr	but-2-en1-ila
XV-109	nPr	but-1-en-1-ila
XV-110	nPr	but-3-en1-ila
XV-111	nPr	but-1-en2-ila
XV-112	nPr	but-2-en2-ila
XV-113	nPr	but-3-en2-ila
XV-114	nPr	Metoximetila
XV-115	nPr	etoximetila
XV-116	nPr	Propoximetila
XV-117	nPr	Benziloximetila
XV-118	nPr	1-metoxietila
XV-119	nPr	2-metoxietila
XV-120	nPr	-CH ₂ OCOMe
XV-121	nPr	-CH ₂ OCOEt
XV-122	nPr	-CH ₂ OCOiPr
XV-123	nPr	-CH ₂ OCOtBu
XV-124	nPr	-CH ₂ OCOPh
XV-125	nPr	-CH ₂ OCOOEt
XV-126	nPr	-CH=N-OMe
XV-127	nPr	-CH=N-OEt
XV-128	nPr	-CH=N-Me
XV-129	nPr	-CH=N-Et
XV-130	nPr	-CH=N-Ph
XV-131	nPr	-CH=N-(2-piridila)

Composto Nº	R ¹	Z
XV-132	nPr	-CH=N-C□N
XV-133	nPr	-P(O)(OEt) ₂
XV-134	nPr	-P(S)(OEt) ₂
XV-135	nPr	-P(O)(OMe) ₂
XV-136	nPr	-P(S)(OMe) ₂
XV-137	nPr	-P(O)(OPh) ₂
XV-138	nPr	-P(S)(OPh) ₂
XV-139	nPr	-P(O)(OBn) ₂
XV-140	nPr	-P(S)(OBn) ₂
XV-141	nPr	-P(O)(NMe ₂) ₂
XV-142	nPr	-P(S)(NMe ₂) ₂
XV-143	nPr	-P(O)(NEt ₂) ₂
XV-144	nPr	-P(S)(NEt ₂) ₂
XV-145	nPr	-OH
XV-146	nPr	-OMe
XV-147	nPr	-OAc
XV-148	nPr	-OBz
XV-149	nPr	SMe
XV-150	nPr	SCCl ₃
XV-151	nPr	SPh
XV-152	nPr	S(O)Ph
XV-153	nPr	S(O) ₂ Me
XV-154	nPr	S(O) ₂ CF ₃
XV-155	nPr	S(O) ₂ Ph
XV-156	nPr	C(O)Me
XV-157	nPr	C(O)Et
XV-158	nPr	C(O)iPr
XV-159	nPr	C(O)tBu
XV-160	nPr	C(O)CH ₂ OMe
XV-161	nPr	C(O)CH ₂ Cl

Composto Nº	R ¹	Z
XV-162	nPr	C(O)CHCl ₂
XV-163	nPr	C(O)CCl ₃
XV-164	nPr	C(O)Ph
XV-165	nPr	C(O)(4-fluorofenila)
XV-166	nPr	C(O)(4-clorofenila)
XV-167	nPr	C(O)(4-metoxifenila)
XV-168	nPr	C(O)(2,4-diclorofenila)
XV-169	nPr	C(O)(2,6-diclorofenila)
XV-170	nPr	C(O)(2,6-difluorofenila)
XV-171	nPr	C(O)OMe
XV-172	nPr	C(O)OEt
XV-173	nPr	C(O)OiPr
XV-174	nPr	C(O)OtBu
XV-175	nPr	C(O)OPh
XV-176	nPr	C(O)O(4-fluorofenila)
XV-177	nPr	C(O)O(4-clorofenila)
XV-178	nPr	C(O)O(4-metoxifenila)
XV-179	nPr	C(O)O(2,4-diclorofenila)
XV-180	nPr	C(O)O(2,6-diclorofenila)
XV-181	nPr	C(O)O(2,6-difluorofenila)
XV-182	nPr	C(O)NHMe
XV-183	nPr	C(O)NMe ₂
XV-184	nPr	C(O)NH ₂ Et
XV-185	nPr	C(O)NEt ₂
XV-186	nPr	C(O)NHiPr
XV-187	nPr	C(O)NHtBu
XV-188	nPr	C(O)NHPh
XV-189	nPr	C(O)NH(4-fluorofenila)
XV-190	nPr	C(O)NH(4-clorofenila)
XV-191	nPr	C(O)NH(4-metoxifenila)

Composto Nº	R ¹	Z
XV-192	nPr	C(O)NH(2,4-diclorofenila)
XV-193	nPr	C(O)NH(2,6-diclorofenila)
XV-194	nPr	C(O)NH(2,6-difluorofenila)

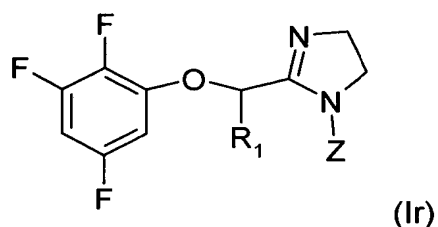
194 Compostos de fórmula Iq



em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos Nºs XVI-1 a XVI-194, respectivamente.

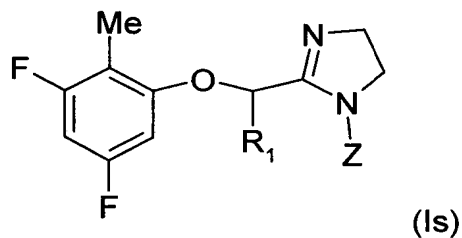
5

194 Compostos de fórmula Ir



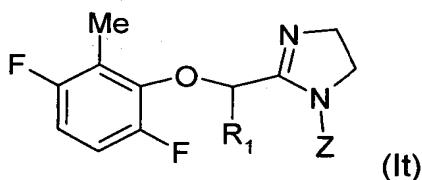
em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos Nºs XVII-1 a XVII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Is



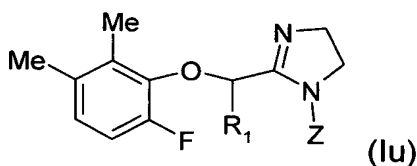
10 em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos Nºs XVIII-1 a XVIII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula It



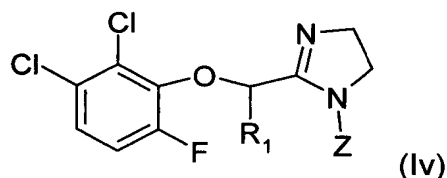
em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XIX-1 a XIX-194, respectivamente.

5 194 Compostos de fórmula Iu



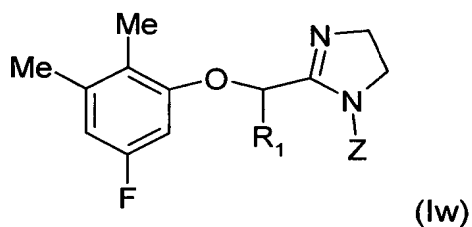
em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XX-1 a XX-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Iv



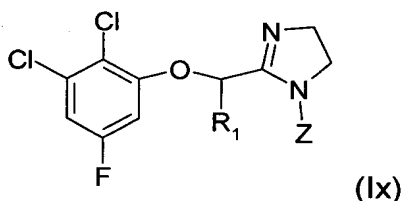
10 em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XXI-1 a XXI-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Iw



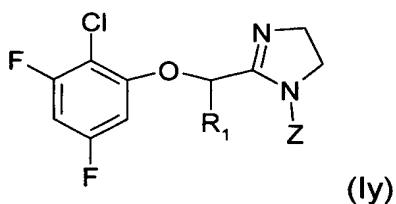
15 em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XXII-1 a XXII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Ix



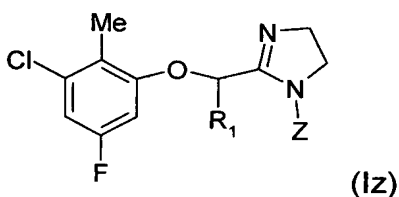
em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-192, são designados como compostos N^os XXIII-1 a XXIII-192, respectivamente.

5 194 Compostos de fórmula Iy



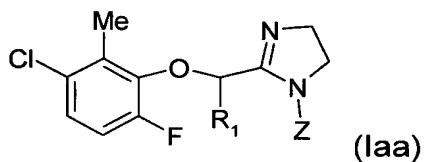
em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XXIV-1 a XXIV-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Iz



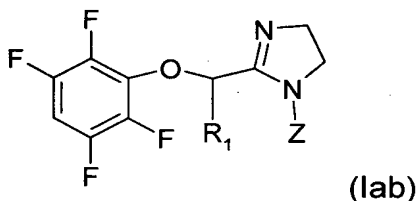
10 em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XXV-1 a XXV-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Iaa



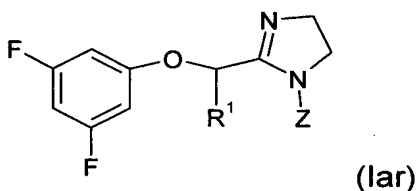
15 em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XXVI-1 a XXVI-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lab



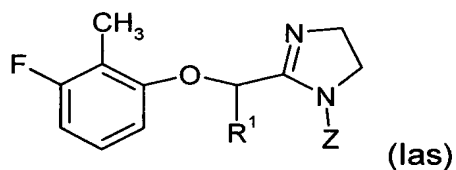
em que os valores de R¹ e Z são como fornecidos na Tabela 2 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XXVII-1 a XXVII-194, respectivamente.

5 194 Compostos de fórmula lar



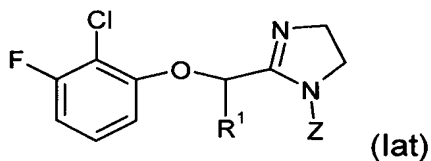
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XLIV-1 a XLIV-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula las



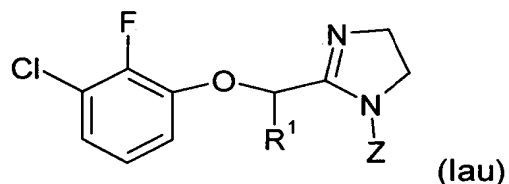
10 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XLV-1 a XLV-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lat



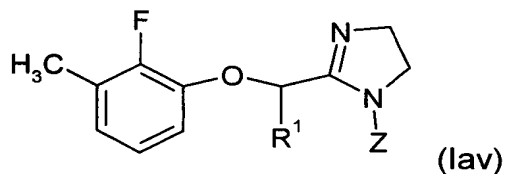
15 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XLVI-1 a XLVI-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lau



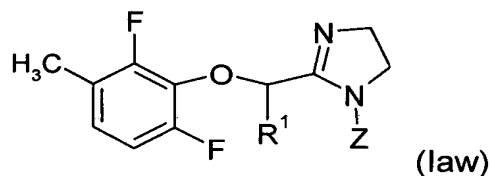
em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XLVII-1 a XLVII-194, respectivamente.

5 194 Compostos de fórmula lav



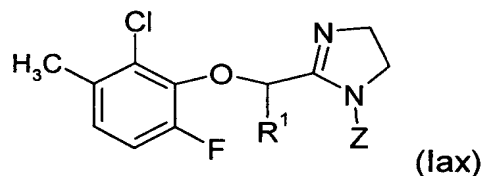
em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XLVIII-1 a XLVIII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula law



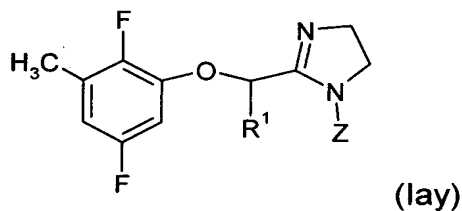
10 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os XLIX-1 a XLIX-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lax



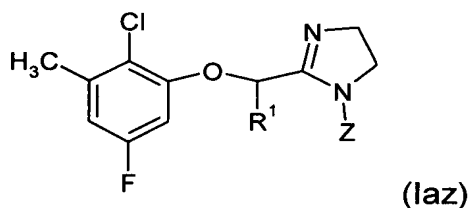
15 em que os valores de R^1 são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os L-1 a L-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lay



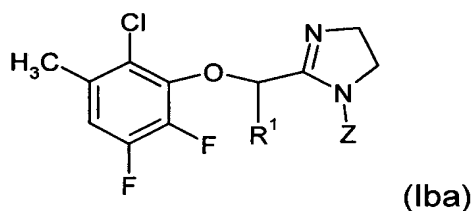
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LI-1 a LI-194, respectivamente.

5 194 Compostos de fórmula laz



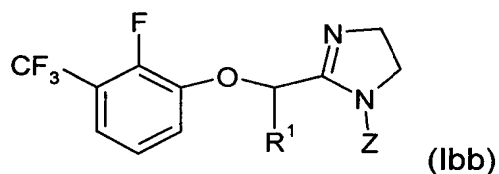
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LII-1 a LII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lba



10 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LIII-1 a LIII-194, respectivamente.

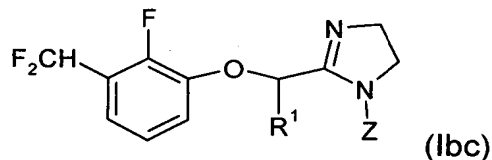
194 Compostos de fórmula lbb



15 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LIV-1 a LIV-194, res-

pectivamente.

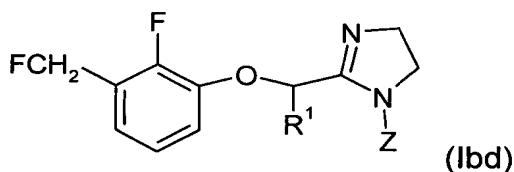
194 Compostos de fórmula lbc



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LV-1 a LV-194, respectivamente.

5

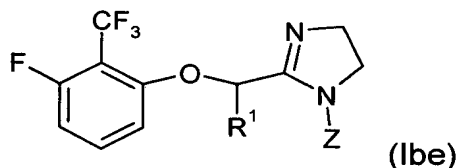
194 Compostos de fórmula lbd



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LVI-1 a LVI-194, respectivamente.

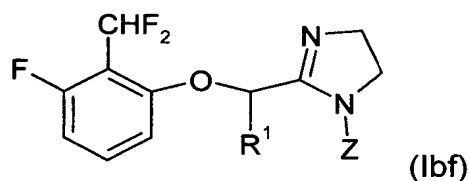
10

194 Compostos de fórmula lbe



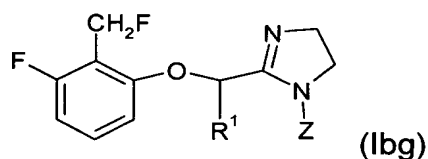
em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LVII-1 a LVII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula lbf



15 em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LVIII-1 a LVIII-194, respectivamente.

194 Compostos de fórmula Ibg



em que os valores de R¹ são como fornecidos na Tabela 1 para compostos XV-1 a XV-194, são designados como compostos N^os LIX-1 a LIX-194, respectivamente.

- 5 Tabela 3 abaixo fornece dados de caracterização para alguns dos compostos descritos acima; outros compostos são somente descritos nesta tabela de dados de caracterização.

Tabela 3: Dados de caracterização para compostos da invenção

Composto N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Z	P.f. [°C]
1.001	Etila	F	H	F	H	H	H	Goma *
1.002	Etila	F	H	H	F	H	H	110-110,5
1.003	Etila	F	F	H	H	H	H	87,5-88
I-2	Etila	F	H	H	H	F	H	115,5-116
1.005	Etila	H	F	H	F	H	H	Sólido *
1.006	Etila	Cl	H	H	F	H	H	86,5-87
XIV-2	Etila	F	F	H	F	F	H	81,5-83
1.008	Etila	F	F	H	F	H	H	117-117,5
1.009	Etila	F	Me	H	H	F	H	75-77
1.010	Etila	Cl	H	H	H	F	H	65-65,5
1.011	Etila	Cl	H	H	H	F	C(O)OC(CH ₃) ₃	Goma *
XI-2	Etila	Cl	F	H	F	H	H	112-112,5
III-2	Etila	Cl	F	H	H	F	H	Sólido *
1.014	Metila	H	F	H	F	H	C(O)OC(CH ₃) ₃	Goma *
1.015	Metila	H	F	H	F	H	H	134-134,5
1.016	Etila	F	F	H	F	F	C(O)OC(CH ₃) ₃	Goma *
1.017	Etila	Me	F	H	H	H	H	94-95
1.018	Etila	F	F	H	H	F	H	106-107
1.019	Etila	F	F	F	H	H	H	92-03
1.020	Etila	F	F	Me	H	H	H	Goma *

Composto N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Z	P.f. [°C]
1.021	Etila	Me	F	H	H	F	H	Goma *
1.022	Etila	Me	F	H	F	F	H	99-101
1.023	Etila	Cl	Me	H	F	H	H	110-111
1.024	Etila	Cl	Cl	H	F	H	H	124-128
1.025	Etila	Cl	Me	F	F	H	H	115-118
1.026	Etila	Cl	Me	H	F	F	H	92-94
1.027	Etila	Me	Me	F	H	H	H	79-83
1.028	Etila	Me	Me	H	H	F	H	83-85
1.029	Etila	Me	F	H	F	H	H	100-102
1.030	Etila	Cl	Cl	H	H	F	H	82-86
1.031	Etila	F	Cl	H	H	H	H	135-136
1.032	Etila	F	Cl	H	H	F	H	88-90
1.033	Etila	F	Me	H	H	Cl	H	84-86
1.034	Etila	F	CF ₃	H	H	H	H	91-92
1.035	Metila	F	CF ₃	H	H	H	H	120-121
1.036	n-propila	F	CF ₃	H	H	H	H	Goma *
1.037	i-propila	F	CF ₃	H	H	H	H	Goma *
1.038	etila	F	Me	H	H	H	H	96-98

* ¹H-RMN (CDCl₃) de compostos selecionados:

- 1.001 6,87, m, 1H; 6,52, m, 1H; 6,33, m, 1H; 4,62, t, 1H; 4,07, m, 2H; 3,74, m, 2H; 2,01, m, 1H; 1,92, m, 1H; 1,11, t, 3H.
- 5 1.005 6,53, m, 2H; 6,43, m, 1H; 4,74, t, 1H; 3,68, b, 2H; 3,56, b, 2H; 1,94, m, 2H; 1,04, t, 3H.
- 1.011 7,12, m, 1H; 6,96, m, 1H; 6,88, m, 1H; 5,71, t, 1H; 3,7-3,9, m, 4H; 2,08, m, 2H; 1,44, s, 9H; 1,13, t, 3H.
- III-2 6,98, m, 1H; 6,87, m, 1H; 4,91, t, 1H; 3,77, m, 2H; 3,52, m, 2H; 2,05, m, 1H; 1,97, m, 1H; 1,05, t, 3H.
- 10 1.014 6,42, m, 2H; 6,39, m, 1H; 6,71, q, 1H; 3,80, m, 4H; 1,64, d, 3H; 1,53, s, 9H.
- 1.016 6,72, m, 1H; 5,77, t, 1H; 3,90 to 3,75, m, 4H; 2,05, m, 2H; 1,48, s, 9H; 1,13, t, 3H.

1.020 6,85 a 6,75, m, 2H; 4,78, t, 1H; 3,68, m, 2H; 3,56, m, 2H; 2,24, s, 3H; 1,99, m, 2H; 1,08, t, 3H.

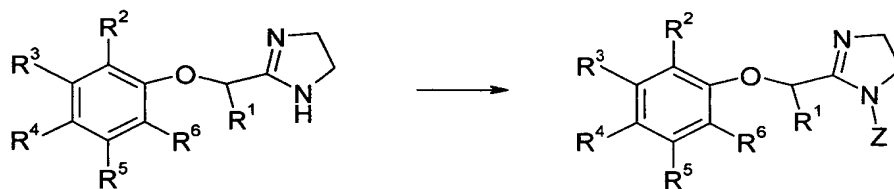
1.021 6,88, m, 1H; a 6,74, m, 1H; 4,77, t, 1H; 3,68, m, 2H; 3,58, m, 2H; 2,22, s, 3H; 1,99, m, 2H; 1,04, t, 3H.

5 1.036 7,32, t, 1H; 7,18, t, 1H; 7,12, t, 1H; 4,89, t, 1H; 3,67, m, 2H; 3,54, m, 2H; 2,01, m, 1H; 1,98, m, 1H; 1,57, m, 1H; 1,49, m, 1H; 0,97, t, 3H.

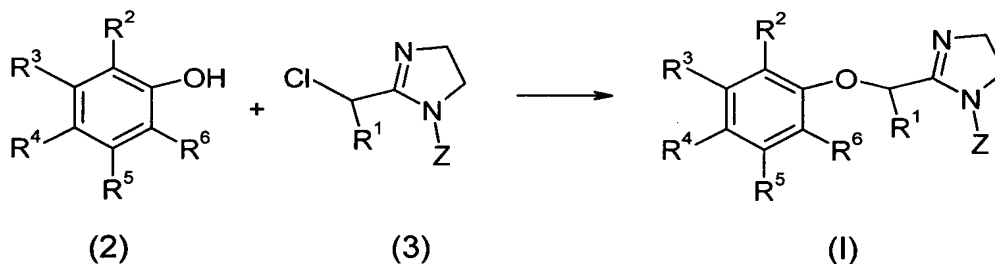
1.037 7,32, dd, 1H; 7,18, dd, 1H; 7,12, t, 1H; 4,60, d, 1H; 3,68, m, 2H; 3,55, m, 2H; 2,23, m, 1H; 1,14, d, 3H; 1,04, d, 3H.

10 Compostos da invenção podem ser preparados por uma variedade de métodos, por exemplo, aqueles descritos abaixo.

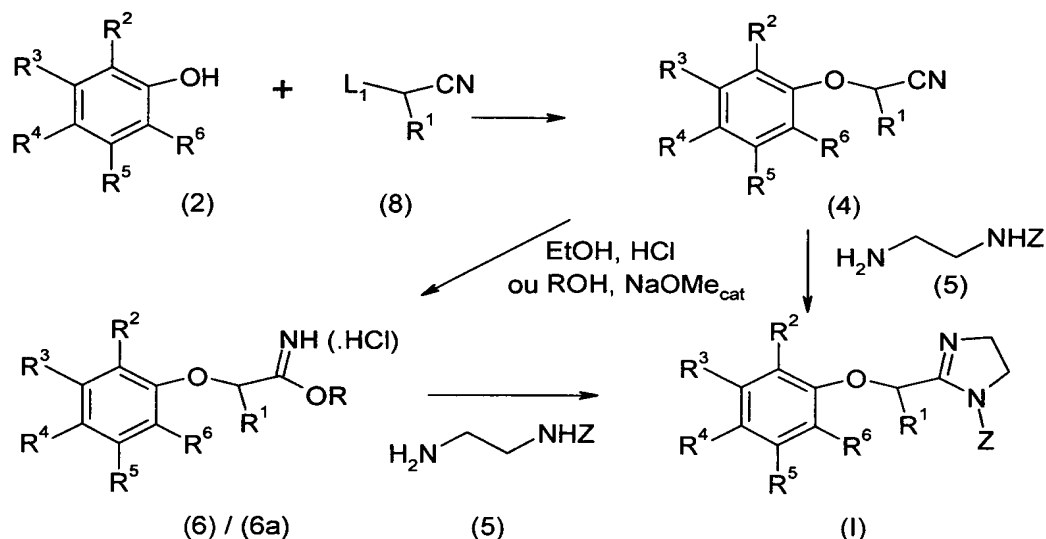
Compostos da fórmula (I) em que Z não é H, podem ser preparados de compostos da fórmula (I) em que Z é H, por tratamento com o reagente apropriado. Dependendo da natureza de Z, este pode ser, por exemplo, um agente de alquilação, um agente de acilação, um agente de carba-
15 moilação, um agente de fosforilação, um agente de sulfenilação ou um agente de oxidação. Estes agentes de derivatização são geralmente eletrófilos. Métodos para a conversão de grupos NH em grupos NZ podem ser encontrados, por exemplo, em T.W. Greene e P.G.M. Wuts "Protecting Groups in Organic Synthesis" 3ª edição, Wiley, NY 1999.



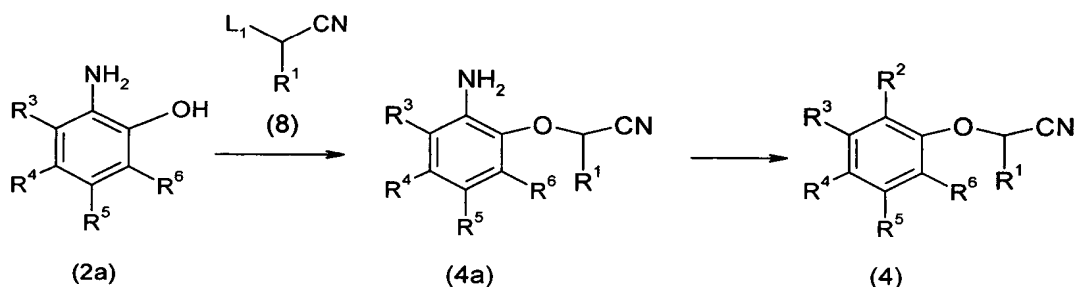
20 Compostos da fórmula (I) podem ser preparados por alquilação de um fenol da fórmula (2), com uma 2-haloalquilimidazolina da fórmula 3 (J. Am. Chem. Soc. 1947, 69, 1688).



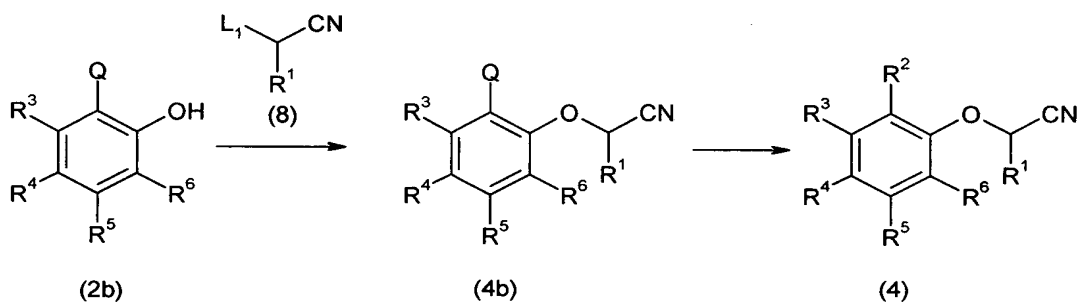
Compostos da fórmula (I) podem ser preparados de nitrilas da fórmula (4), por tratamento com uma diamina da fórmula (5). Isto é vantajosamente realizado na presença de um catalisador tal como CS₂, P₂S₅ (J. of Med. Chem., 2003 46, 1962) ou Na₂S₄ (DE 2512513). A nitrila (4) pode ser convertida em imidatos da fórmula (6) usando um álcool tal como metanol e uma quantidade catalítica de base tal como NaOH, ou em sais de imidato de fórmula (6) usando um álcool tal como metanol ou etanol e um ácido tal como HCl. Imidatos da fórmula (6) podem ser convertidos em compostos da fórmula (I) em tratamento com diaminas da fórmula (5) (J. of Med. Chem., 2004,47, 6160; J. Am. Chem. Soc. 1947, 69, 1688). Nitrilas da fórmula (4) podem ser preparadas por fenóis de alquilação da fórmula (2) com uma nitrila da fórmula (8), transportando um grupo de saída L₁ (J. Am. Chem. Soc. 1947, 69, 1688).



Em uma variante, anilinas de fórmula (2a) podem ser reagidas com nitrilas de fórmula (8) para formar compostos da fórmula (4a). As aminas de fórmula (4a) podem ser convertidas em seguida em nitrilas de fórmula (4), em que R² é flúor, cloro, bromo ou iodo por diazotização e outra conversão no haleto correspondente (H. Zollinger, "Diazo Chemistry 1, Aromatic e heteroaromatic Compounds" VCH, Weinheim, 1994).



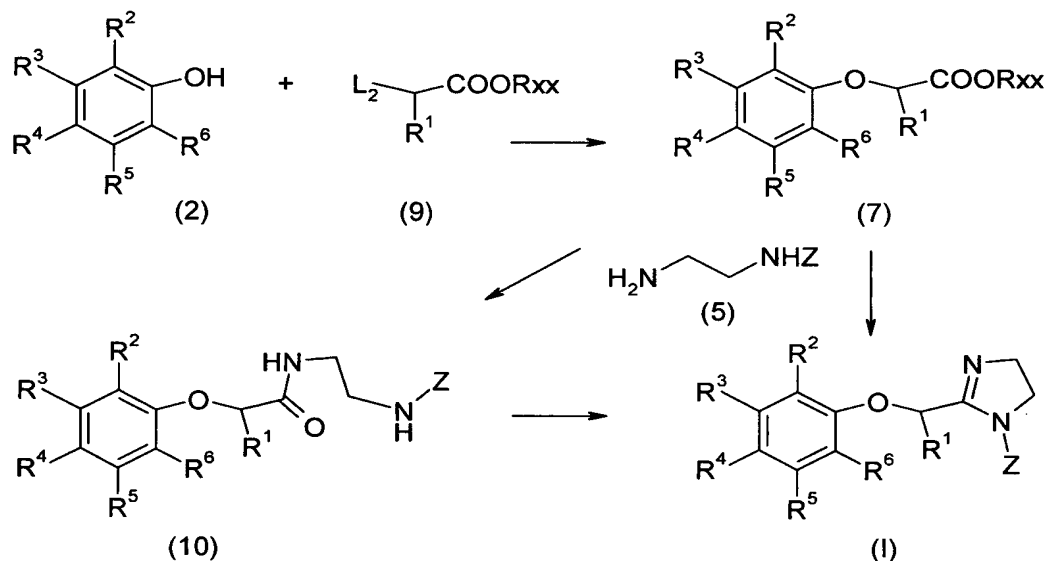
Em outra variante, fenóis de fórmula (2b), em que Q é um grupo aldeído, ácido ou éster, podem ser reagidos com nitrilas de fórmula (8) para compostos de fórmula (4b). Compostos de fórmula (4b) podem em seguida ser convertidos nos compostos correspondentes de fórmula (4), em que R² é C₁₋₂ haloalquila, em particular difluorometila, fluorometila ou trifluorometila, conversões de grupo funcional bem-conhecidos.



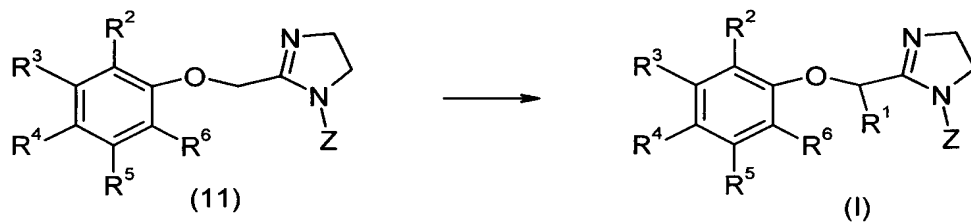
Ao homem versado na técnica, é entendido, que nestas variantes quaisquer dos grupos R², R³, R⁴, R⁵ e R⁶ pode ser um grupo amino ou um grupo Q para tais outras transformações.

Ésteres da fórmula (7) podem ser convertidos em imidazolininas da fórmula (I) por tratamento com diaminas da fórmula (5) (J. Am. Chem. Soc. 1950, 72, 4443-5). Reagentes de alquilalumínio podem ser usados com vantagem para facilitar esta reação. Esta conversão ocorre em duas etapas formando primeiro a monoamida (10), que pode servir como um precursor para imidazolininas da fórmula (I). Ésteres da fórmula (7) podem ser preparados por alquilação de fenóis da fórmula (2) com ésteres da fórmula (9), em que L₂ é um grupo de saída, e R_{xx} é um grupo alquila ou arila opcionalmente substituída (tipicamente C₁-C₆ alquila, fenila ou benzila). Os grupos de saída L₁ e L₂ são tipicamente aqueles usados para reações S_N2. L₁ e L₂ tornam-se ânions de ácidos orgânicos ou inorgânicos na ausência de seus substratos (9) e (10). Grupos de saída típicos são, por exemplo, haleto tal

como cloro ou bromo, alquilsulfonatos tal como mesilato, e arilsulfonatos tal como tosilato.



Compostos da fórmula (I) podem ser preparados de imidazolin-
 5 nas da fórmula (11) por introdução de um grupo R^1 . Isto pode ser feito por
 tratamento (11) com uma base e em seguida subsequentemente com um
 eletrófilo capaz de introduzir o grupo R^1 . Um eletrófilo típico pode ser um ha-
 leto tal como R^1-Cl , R^1-Br , ou R^1-I . Uma base típica pode ser n-butil-lítio ou
 mesitil-lítio. O grupo Z pode ser um grupo de proteção tal como tBuOCO ou
 $(CH_3)_3Si$, que pode ser removido se desejado, e um grupo Z diferente pode
 10 ser ligado como descrito acima se desse modo desejado. Este processo é
 exemplificado no exemplo 3.

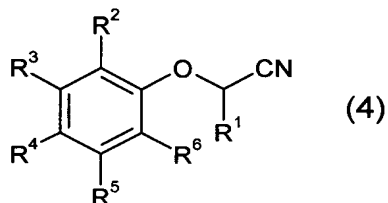


Compostos de fórmulas (2), (3), (5), (7), (8), (9) e (11) são com-
 postos conhecidos ou podem ser obtidos facilmente de compostos conheci-
 dos usando processos que são rotina na técnica e com os quais o homem
 15 versado será familiar.

Os compostos da fórmula (4), incluindo aqueles de fórmula (4a)

e fórmula (4b), em que R¹, R², R³, R⁴, R⁵ e R⁶ são como definidos anteriormente, foram especificamente designados como intermediários para a síntese dos compostos da fórmula (I) e como tais formam ainda um outro aspecto da invenção.

5 Tabela 4. Dados caracterizantes para compostos intermediários da invenção



Composto N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Dados físicos*
4.004	etila	F	H	H	H	F	Óleo
4.007	etila	F	F	H	F	F	Óleo
4.012	etila	Cl	F	H	F	H	Óleo
4.017	etila	Me	F	H	H	H	Óleo
4.018	etila	F	F	H	H	F	Óleo
4.019	etila	F	F	F	H	H	Óleo
4.020	etila	F	F	Me	H	H	Óleo
4.021	etila	Me	F	H	H	F	Óleo
4.022	etila	Me	F	H	F	F	Óleo
4.023	etila	Cl	Me	H	F	H	Óleo
4.024	etila	Cl	Cl	H	F	H	Óleo
4.025	etila	Cl	Me	F	F	H	Óleo
4.026	etila	Cl	Me	H	F	F	Óleo
4.027	etila	Me	Me	F	H	H	Óleo
4.028	etila	Me	Me	H	H	F	Óleo
4.029	etila	Me	F	H	F	H	Óleo
4.030	etila	Cl	Cl	H	H	F	Óleo
4.031	etila	F	Cl	H	H	H	Óleo
4.032	etila	F	Cl	H	H	F	Óleo
4.033	etila	F	Me	H	H	Cl	Óleo
4.034	etila	F	CF ₃	H	H	H	Óleo
4.035	metila	F	CF ₃	H	H	H	Óleo

Composto N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Dados físicos*
4.036	n-propila	F	CF ₃	H	H	H	Óleo
4.037	i-propila	F	CF ₃	H	H	H	Óleo
4.038	etila	F	Me	H	H	H	Óleo

*) ¹H-RMN (CDCl₃) de compostos selecionados:

- 4.004 7,09, m, 1H; 6,94, m, 2H; 4,82, t, 1H; 2,12, m, 2H; 1,23, t, 3H.
- 4.007 6,94, m, 1H; 4,91, t, 1H; 2,16, m, 2H; 1,24, t, 3H.
- 4.012 6,75 a 6,68, 2H; 4,75, t, 1H; 2,18, m, 2H; 1,24, t, 3H.
- 5 4.017 7,14, dxd, 1H; 6,79, dxd, 1H; 6,77, d, 1H; 4,73, t, 1H; 2,16, d pequeno, 3H; 2,14, m, 2H; 1,23, t, 3H.
- 4.018 6,98, m, 1H; 6,92, m, 1H; 4,87, t, 1H; 2,14, m, 2H; 1,24, t, 3H.
- 4.019 7,00 a 6,90, 2H; 4,71, t, 1H; 2,14, m, 2H; 1,22, t, 3H.
- 4.020 6,90, m, 1H; 6,83, m, 1H; 4,72, t, 1H; 2,27, d pequeno, 3H; 2,13, m, 2H; 1,22, t, 3H.
- 10 4.021 6,93, m, 1H; 6,81, m, 1H; 4,86, t, 1H; 2,28, d pequeno, 3H; 2,14, m, 2H; 1,23, t, 3H.
- 4.022 6,62, m, 1H; 4,66, t, 1H; 2,12, d pequeno, 3H; 2,04, m, 2H; 1,14, t, 3H.
- 15 4.029 6,58 a 6,50, 2H; 4,69, t, 1H; 2,10, d pequeno, 3H; 2,10, m, 2H; 1,22, t, 3H.
- 4.031 7,14, m, 1H; 7,07, m, 2H; 4,74, t, 1H; 2,14, m, 2H; 1,23, t, 3H.
- 4.032 7,19, m, 1H; 6,94, m, 1H; 4,84, t, 1H; 2,04, m, 2H; 1,24, t, 3H.
- 4.033 7,08, dxd, 1H; 6,94, m, 1H; 4,88, t, 1H; 2,28, d pequeno, 3H; 2,15, m, 2H; 1,24, t, 3H.
- 20 4.034 7,38, m, 2H; 7,23, m, 1H; 4,78, t, 1H; 2,07, m, 2H; 1,24, t, 3H.
- 4.035 7,38, m, 2H; 7,23, m, 1H; 4,94, q, 1H; 1,85, d, 3H.
- 4.036 7,42 a 7,20, 3H; 4,82, t, 1H; 2,11, m, 2H; 1,48, m, 2H; 1,05, t, 3H.
- 4.037 7,42 a 7,20, 3H; 4,61, d, 1H; 2,38, m, 2H; 1,26, d, 3H; 1,22, d, 3H.
- 25 4.038 7,02 a 6,88, 3H; 4,73, t, 1H; 2,13, m, 2H; 1,22, t, 3H.

Em um outro aspecto da invenção, os compostos de fórmula (I) podem ser usados para combater e controlar infestações de pestes de insetos tais como Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dict-

yoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera e também outras pestes de invertebrados, por exemplo, pestes de acarídeo, nematódeo e molusco. Insetos, acarídeos, nematódeos e moluscos são posteriormente coletivamente referidos como pestes. As pestes que podem ser combatidas e controladas pelo uso dos compostos da invenção incluem aquelas pestes associadas à agricultura (cujo termo inclui o desenvolvimento de colheitas para produtos alimentares e de fibra), à horticultura e ao cultivo agrícola para animal, animais de companhia, silvicultura e a armazenagem de produtos de origem vegetal (tal como fruto, grão e madeira); aquelas pestes associadas ao dano de estruturas feitas pelo homem e a transmissão de doenças de homem e animais; e também pestes de praga (tal como moscas).

Exemplos de espécies de peste que podem ser controladas pelos compostos de fórmula (I) incluem: *Myzus persicae* (afídio), *Aphis gossypii* (afídio), *Aphis fabae* (afídio), *Lygus* spp. (capsídeos), *Dysdercus* spp. (capsídeos), *Nilaparvata lugens* (gafanhoto), *Nephotettix inciticeps* (gafanhoto), *Nezara* spp. (percevejo fedorento), *Euschistus* spp. (percevejo fedorento), *Leptocorisa* spp. (percevejo fedorento), *Frankliniella occidentalis* (tripe), *Trips* spp. (tripes), *Leptinotarsa decemlineata* (Besouro de batata do Colorado), *Anthonomus grandis* (gorgulho do algodão), *Aonidiella* spp. (insetos de escama), *Trialeurodes* spp. (moscas brancas), *Bemisia tabaci* (mosca branca), *Ostrinia nubilalis* (broca do milho Europeu), *Spodoptera littoralis* (lagarta da folha de algodão), *Heliotis virescens* (lagarta do broto do tabaco), *Helicoverpa armigera* (lagarta do algodoeiro), *Helicoverpa zea* (lagarta do algodoeiro), *Silepta derogata* (enrolador de folhas de algodão), *Pieris brassicae* (borboleta branca), *Plutella xilostella* (mariposa das costas de diamante), *Agrotis* spp. (lagartas), *Chilo suppressalis* (broca do caule do arroz), *Locusta migratoria* (alfarrobeira), *Chortiocetes terminifera* (alfarrobeira), *Diabrotica* spp. (lagartas da raiz), *Panonychus ulmi* (ácaro vermelho Europeu), *Panonychus citri* (ácaro vermelho das plantas cítricas), *Tetranychus urticae* (ácaro aranha com duas manchas), *Tetranychus cinnabarinus* (ácaro aranha carmesim), *Phyllocoptura oleivora* (ácaro da ferrugem das plantas cítricas), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro largo), *Brevipalpus* spp. (ácaros chatos), *Boophilus*

microplus (carrapato de gado), *Dermacentor variabilis* (carrapato de cão Americano), *Ctenocephalides felis* (pulga de gato), *Liriomyza* spp. (bicho mineiro da folha), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex* spp. (mosquitos), *Lucillia* spp. (moscas varejeiras), *Blattella germanica* (barata), *Periplaneta americana* (barata), *Blatta orientalis* (barata), cupins da *Mastotermitidae* (por exemplo, *Mastotermes* spp.), uma *Kalotermitidae* (por exemplo, *Neotermes* spp.), uma *Rhinotermitidae* (por exemplo, *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus*, e *R. santonensis*) e uma *Termitidae* (por exemplo, *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (formiga do fogo), *Monomorium pharaonis* (formiga do faraó), *Damalinea* spp. e *Linognathus* spp. (piolhos picadores e sugadores), e *Deroceras reticulatum* (lesma).

A invenção portanto fornece um método de combater e controlar insetos, acarídeos, ou moluscos que compreende aplicar uma quantidade inseticidamente, acaricidamente, nematocidamente ou moluscicidamente eficaz de um composto de fórmula (I), ou uma composição contendo um composto de fórmula (I), a uma peste, um loco de peste, ou a uma planta suscetível ao ataque por uma peste. Os compostos de fórmula (I) são preferivelmente usados contra insetos ou acarinos.

O termo "planta" como usado aqui inclui sementes, mudas, arbustos e árvores.

Em modalidades particularmente preferidas, compostos de fórmula (I) e composições contendo tais compostos são usados em métodos de controle e combate de insetos nas ordens Hemiptera, Lepidoptera, Coleoptera, Thysanoptera, Diptera, Blattodea, Isoptera, Siphonaptera, Hymenoptera, e/ou Orthoptera. Em certas modalidades, tais compostos e composições são particularmente úteis no controle e combate de Hemiptera, Lepidoptera, Coleoptera, Thysanoptera, ou Diptera. Em outras modalidades, tais compostos e composições são particularmente úteis no controle e no combate de Lepidoptera, Thysanoptera, Isoptera, Siphonaptera, Hymenoptera, ou Orthoptera. É particularmente preferido que compostos de fórmula (I), e composições

contendo estes compostos sejam usados contra insetos hemípteros.

A fim de aplicar um composto de fórmula (I) como um inseticida, acaricida, nematicida ou moluscicida a uma peste, um loco de peste, ou a uma planta suscetível ao ataque por uma peste, um composto de fórmula (I) é habitualmente formulado em uma composição que inclui, em adição ao composto de fórmula (I), um veículo ou diluente inerte adequado e, opcionalmente, um agente ativo de superfície (SFA). Veículos ou diluentes inertes adequados são descritos aqui, por exemplo, com respeito a certos tipos de formulação, e desse modo o termo inclui diluentes sólidos, sais solúveis em água inorgânicos, sólidos orgânicos solúveis em água e os similares bem como diluentes simples tais como, por exemplo, água e/ou óleos. SFAs são produtos químicos que são capazes de modificar as propriedades de uma interface (por exemplo, interfaces líquido/sólido, líquido/ar ou líquido/líquido) por redução da tensão interfacial e desse modo resultando em mudanças em outras propriedades (por exemplo, dispersão, emulsificação e umectação). É preferido que todas as composições (tanto formulações sólidas quanto líquidas) compreendam, em peso, 0,0001 a 95%, mais preferivelmente 1 a 85%, por exemplo, 5 a 60%, de um composto de fórmula (I). A composição é geralmente usada para o controle de pestes de modo que um composto de fórmula (I) seja aplicado em uma taxa de 0,1 g a 10 kg por hectare, preferivelmente de 1 g a 6 kg por hectare, mais preferivelmente de 1 g a 1 kg por hectare.

Quando usado em um adubo de semente, um composto de fórmula (I) é usado em uma taxa de 0,0001 g a 10 g (por exemplo, 0,001 g ou 0,05 g), preferivelmente 0,005 g a 10 g, mais preferivelmente 0,005 g a 4 g, por quilograma de semente.

Em outro aspecto, a presente invenção fornece uma composição inseticida, acaricida, nematicida ou moluscicida compreendendo uma quantidade inseticidamente, acaricidamente, nematicidamente ou moluscicidamente eficaz de um composto de fórmula (I) e um diluente ou veículo adequado para este. A composição é preferivelmente uma composição inseticida, acaricida, nematicida ou moluscicida.

Em ainda outro aspecto, a invenção fornece um método de combater e controlar pestes em um loco que compreende tratar as pestes ou o loco das pestes com uma quantidade inseticidamente, acaricidamente, nematocidamente ou moluscicidamente eficaz de uma composição compreendendo um composto de fórmula (I). Tais composições são preferivelmente usadas contra insetos, acarídeos ou nematódeos.

As composições podem ser escolhidas de vários tipos de formulação, incluindo pós pulverizáveis (DP), pós solúveis (SP), grânulos solúveis em água (SG), grânulos dispersíveis em água (WG), pós umectáveis (WP), grânulos (GR) (liberação lenta ou rápida), concentrados solúveis (SL), líquidos miscíveis em óleo (OL), líquidos de volume ultrabaixo (UL), concentrados emulsificáveis (EC), concentrados dispersíveis (DC), emulsões (tanto óleo em água (EW) como água em óleo (EO)), microemulsões (ME), concentrados de suspensão (SC), aerossóis, formulações de névoa/fumaça, suspensões de cápsula (CS) e formulações de tratamento de semente. O tipo de formulação escolhido em qualquer exemplo dependerá do propósito particular considerado e das propriedades física, química e biológica do composto de fórmula (I).

Pós pulverizáveis (DP) podem ser preparados misturando-se um composto de fórmula (I) com um ou mais diluentes sólidos (por exemplo, argilas naturais, caulim, pirofilito, bentonita, alumina, montmorilonita, diatomita, giz, terras diatomáceas, fosfatos de cálcio, carbonatos de cálcio e magnésio, enxofre, cal, farinhas, talco e outros veículos sólidos orgânicos e inorgânicos) e mecanicamente moendo-se a mistura para um pó fino.

Pós solúveis (SP) podem ser preparados misturando-se um composto de fórmula (I) com um ou mais sais inorgânicos solúveis em água (tal como bicarbonato de sódio, carbonato de sódio ou sulfato de magnésio) ou um ou mais sólidos orgânicos solúveis em água (tal como um polissacarídeo) e, opcionalmente, um ou mais agentes umectantes, um ou mais agentes dispersantes ou uma mistura dos referidos agentes para melhorar a dispersibilidade/solubilidade em água. A mistura é em seguida moída para um pó fino. Composições similares podem também ser granuladas para formar

grânulos solúveis em água (SG).

Pós umectáveis (WP) podem ser preparados misturando-se um composto de fórmula (I) com um ou mais diluentes ou veículos sólidos, um ou mais agentes umectantes e, preferivelmente, um ou mais agentes dispersantes e, opcionalmente, um ou mais agentes de suspensão para facilitar a dispersão em líquidos. A mistura é em seguida moída a um pó fino. Composições similares podem também ser granuladas para formar grânulos dispersíveis em água (WG).

Grânulos (GR) podem ser formados por granulação de uma mistura de um composto de fórmula (I) e um ou mais diluentes ou veículos sólidos em pó, ou de grânulos vazios pré-formados por absorção de um composto de fórmula (I) (ou uma solução do mesmo, em um agente adequado) em um material granular poroso (tal como pedra pomes, argilas de atapulgita, greda de pisoeiro, diatomita, terras diatomáceas ou sabugos de milho moídos) ou por adsorção de um composto de fórmula (I) (ou uma solução do mesmo, em um agente adequado) em um material de núcleo duro (tais como areias, silicatos, carbonatos, sulfatos ou fosfatos minerais) e secagem, se necessário. Agentes que são comumente usados para ajudar a absorção ou adsorção incluem solventes (tais como solventes de petróleo alifáticos e aromáticos, álcoois, éteres, cetonas e ésteres) e agentes de aderência (tais como acetatos de polivinila, álcoois polivinílicos, dextrinas, açúcares e óleos vegetais). Um ou mais outros aditivos podem também ser incluídos em grânulos (por exemplo, um agente emulsificante, agente umectante ou agente dispersante).

Concentrados dispersíveis (DC) podem ser preparados por dissolução de um composto de fórmula (I) em água ou um solvente orgânico, tal como uma cetona, álcool ou glicol éter. Estas soluções podem conter um agente ativo de superfície (por exemplo, para melhorar a diluição de água ou prevenir cristalização em um reservatório de spray).

Concentrados emulsificáveis (EC) ou emulsões óleo-em-água (EW) podem ser preparados por dissolução de um composto de fórmula (I) em um solvente orgânico (opcionalmente contendo um ou mais agentes u-

mectantes, um ou mais agentes emulsificantes ou uma mistura dos referidos agentes). Solventes orgânicos adequados para uso em ECs incluem hidrocarbonetos aromáticos (tais como alquilbenzenos ou alquilnaftalenos, exemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 e SOLVESSO 200; SOLVESSO é uma Marca Registrada), cetonas (tais como ciclo-hexanona ou metilciclo-hexanona) e álcoois (tais como álcool benzílico, álcool furfurílico ou butanol), N-alquilpirrolidonas (tais como N-metilpirrolidona ou N-octilpirrolidona), amidas de dimetila de ácidos graxos (tal como C₈-C₁₀ dimetilamida de ácido graxo) e hidrocarbonetos clorinados. Um produto EC pode espontaneamente emulsificar em adição à água, para produzir uma emulsão com estabilidade suficiente para permitir aplicação por spray através de equipamento apropriado. Preparação de uma EW envolve obter um composto de fórmula (I) como um líquido (se não for um líquido em temperatura ambiente, poderá ser fundido em uma temperatura razoável, tipicamente abaixo de 70°C) ou em solução (dissolvendo-o em um solvente apropriado) e em seguida emulsificando o líquido resultante ou solução em água contendo um ou mais SFAs, sob cisalhamento elevado, para produzir uma emulsão. Solventes adequados para uso em EWs incluem óleos vegetais, hidrocarbonetos clorinados (tais como clorobenzenos), solventes aromáticos (tais como alquilbenzenos ou alquilnaftalenos) e outros solventes orgânicos apropriados que têm uma baixa solubilidade em água. Em modalidades particularmente preferidas, compostos de fórmula I serão formulados como uma formulação de EC ou EW.

Microemulsões (ME) podem ser preparadas misturando-se água com uma mistura de um ou mais solventes com um ou mais SFAs, para produzir espontaneamente uma formulação líquida isotrópica termodinamicamente estável. Um composto de fórmula (I) está presente inicialmente na água ou na mistura de solvente/SFA. Solventes adequados para uso em MEs incluem aqueles anteriormente descritos para uso em ECs ou em EWs. Uma ME pode ser um sistema óleo-em-água ou um sistema água-em-óleo (cujo sistema presente pode ser determinado por medições de condutividade) e pode ser adequada para misturar pesticidas solúveis em água e solú-

veis em óleo na mesma formulação. Uma ME é adequada para diluição em água, permanecendo como uma microemulsão ou formando uma emulsão óleo-em-água convencional.

5 Concentrados de suspensão (SC) podem compreender suspen-
sões aquosas ou não-aquosas de partículas sólidas insolúveis bem divididas
de um composto de fórmula (I). SCs podem ser preparados por moagem de
bola ou conta do composto sólido de fórmula (I) em um meio adequado, op-
cionalmente com um ou mais agentes dispersantes, para produzir uma sus-
pensão de partícula fina do composto. Um ou mais agentes umectantes po-
10 dem ser incluídos na composição e um agente de suspensão pode ser inclu-
ído para reduzir a taxa na qual as partículas assentam-se. Alternativamente,
um composto de fórmula (I) pode ser moído seco e adicionado à água, con-
tendo agentes anteriormente descritos, para produzir o produto final deseja-
do.

15 Formulações de aerossol compreendem um composto de fórmu-
la (I) e um propelente adequado (por exemplo, *n*-butano). Um composto de
fórmula (I) pode também ser dissolvido ou disperso em um meio adequado
(por exemplo, água ou um líquido miscível em água, tal como *n*-propanol)
para fornecer composições para uso em bombas de spray acionadas à mão,
20 não-pressurizadas.

Um composto de fórmula (I) pode ser misturado no estado seco
com uma mistura pirotécnica para formar uma composição adequada para
gerar, em um espaço fechado, uma fumaça contendo o composto.

25 Suspensões em cápsula (CS) podem ser preparadas de uma
maneira similar à preparação de formulações de EW porém com um estágio
de polimerização adicional de modo que uma dispersão aquosa de gotículas
de óleo seja obtida, em que cada gotícula de óleo seja encapsulada por uma
casca polimérica e contenha um composto de fórmula (I) e, opcionalmente,
um veículo ou diluente para este. A casca polimérica pode ser produzida
30 por uma reação de policondensação interfacial ou por um procedimento de
coacervação. As composições podem prover liberação controlada do com-
posto de fórmula (I) e elas podem ser usadas para tratamento de semente.

Um composto de fórmula (I) pode também ser formulado em uma matriz polimérica biodegradável para fornecer uma liberação controlada, lenta do composto.

5 Uma composição pode incluir um ou mais aditivos para melhorar o desempenho biológico da composição (por exemplo, para melhorar umectação, retenção ou distribuição sobre superfícies; resistência à chuva sobre superfícies tratadas; ou captação ou mobilidade de um composto de fórmula (I)). Tais aditivos incluem agentes ativos de superfície, aditivos de spray com base em óleos, por exemplo, certos óleos minerais ou óleos de planta natural (tais como óleo de semente de colza e soja), e misturas destes com outros adjuvantes de biorrealce (ingredientes que podem ajudar ou modificar a ação de um composto de fórmula (I)).

15 Um composto de fórmula (I) pode também ser formulado para uso como um tratamento de semente, por exemplo, como uma composição em pó, incluindo um pó para tratamento de semente seca (DS), um pó solúvel em água (SS) ou um pó dispersível em água para tratamento de pasta fluida (WS), ou como uma composição líquida, incluindo um concentrado fluível (FS), uma solução (LS) ou uma suspensão em cápsula (CS). As preparações das composições DS, SS, WS, FS e LS são muito similares àsquelas de, respectivamente, composições DP, SP, WP, SC e DC descritas acima. Composições para tratamento de semente podem incluir um agente para assistir a adesão da composição à semente (por exemplo, um óleo mineral ou uma barreira formadora de película).

25 Agentes umectantes, agentes dispersantes e agentes emulsificantes podem ser SFAs de superfície do tipo catiônico, aniônico, anfotérico ou não-iônico.

SFAs adequados do tipo catiônico incluem compostos de amônio quaternário (por exemplo, brometo de cetiltrimetil amônio de), imidazolinas e sais de amina.

30 SFAs aniônicos adequados incluem sais de metais de álcali de ácidos graxos, sais de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por exemplo, laurilasulfato de sódio), sais de compostos aromáticos sulfonados (por

exemplo, dodecilbenzenossulfonato de sódio, dodecilbenzenossulfonato de cálcio, sulfonato de butilnaftaleno e misturas de sulfonatos de di-*isopropil-* e tri-*isopropil-*naftaleno de sódio), sulfatos de éter, sulfatos de éter de álcool (por exemplo, laureth-3-sulfato de sódio), carboxilatos de éter (por exemplo, laureth-3-carboxilato de sódio), ésteres de fosfato (produtos da reação entre um ou mais álcoois graxos e ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) ou pentóxido fosforoso (predominantemente diésteres), por exemplo, a reação entre álcool laurílico e ácido tetrafosfórico; adicionalmente estes produtos podem ser etoxilados), sulfossuccinamatos, parafina ou sulfonatos de olefina, tauratos e lignossulfonatos.

SFAs adequados do tipo anfotérico incluem betaínas, propionatos e glicinatos.

SFAs adequados do tipo não-iônico incluem produtos de condensação de óxidos de alquilenos, tais como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno ou misturas dos mesmos, com álcoois graxos (tais como álcool oleílico ou álcool cetílico) ou com alquilfenóis (tais como octilfenol, nonilfenol ou octilcresol); ésteres parciais derivados de ácidos graxos de cadeia longa ou anidridos de hexitol; produtos de condensação dos referidos ésteres parciais com óxido de etileno; polímeros em bloco (compreendendo óxido de etileno e óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por exemplo, ésteres de polietileno glicol de ácido graxo); óxidos de amina (por exemplo, óxido de lauril dimetil amina); e lecitinas.

Agentes de suspensão adequados incluem coloides hidrofílicos (tais como polissacarídeos, polivinilpirrolidona ou carboximetilcelulose de sódio) e argilas de dilatação (tais como bentonita ou atapulgita).

Um composto de fórmula (I) pode ser aplicado por qualquer um dos métodos conhecidos de aplicação de compostos pesticidas. Por exemplo, pode ser aplicado, formulado ou não-formulado, às pestes ou a um local das pestes (tais como um habitat das pestes, ou uma planta em desenvolvimento sujeita à infestação pelas pestes) ou a qualquer parte da planta, incluindo a folhagem, troncos, galhos ou raízes, à semente antes dela ser plantada ou a outros meios nos quais as plantas são desenvolvidas ou devem ser

plantadas (tais como solo circunjacente às raízes, o solo de modo geral, sistemas de cultura hidropônica ou água de alagado), diretamente ou pode ser vaporizado em, polvilhado em, aplicado por imersão, aplicado como uma formulação em creme ou pasta, aplicado como um vapor ou aplicado através de distribuição ou incorporação de uma composição (tal como uma composição granular ou uma composição empacotada em uma bolsa solúvel em água) em solo ou um ambiente aquoso.

Um composto de fórmula (I) pode também ser injetado em plantas ou vaporizado sobre a vegetação usando técnicas de vaporização eletrodinâmicas ou outros métodos de baixo volume, ou aplicado por sistemas de irrigação terrestre ou aéreo.

Composições para uso como preparações aquosas (dispersões ou soluções aquosas) são geralmente fornecidas na forma de um concentrado contendo uma proporção elevada do ingrediente ativo, o concentrado sendo adicionado à água antes do uso. Estes concentrados, que podem incluir DCs, SCs, ECs, EWs, MEs SGs, SPs, WPs, WGs e CSs, são frequentemente requeridos para suportar a armazenagem por períodos prolongados e, após tal armazenagem, ser capazes de adição à água para formar preparações aquosas que permanecem homogêneas durante um tempo suficiente para possibilitá-las ser aplicadas por equipamento de spray convencional. Tais preparações aquosas podem conter quantidades variáveis de um composto de fórmula (I) (por exemplo, 0,0001 a 10% em peso) dependendo do propósito para o qual elas devem ser usadas.

Um composto de fórmula (I) pode ser usado em misturas com fertilizantes (por exemplo, fertilizantes contendo nitrogênio, potássio ou fósforo). Tipos adequados de formulação incluem grânulos de fertilizante. As misturas adequadamente contêm até 25% em peso do composto de fórmula (I).

A invenção portanto também fornece uma composição fertilizante compreendendo um fertilizante e um composto de fórmula (I).

As composições desta invenção podem conter outros compostos tendo atividade biológica, por exemplo, micronutrientes ou compostos

tendo atividade fungicida ou que possuem atividade reguladora de crescimento de planta, herbicida, inseticida, nematicida ou acaricida.

O composto de fórmula (I) pode ser o único ingrediente ativo da composição ou pode ser misturado com um ou mais ingredientes ativos adicionais tais como uma pesticida, fungicida, sinergista, herbicida ou regulador de crescimento de planta onde apropriado. Um ingrediente ativo adicional pode: fornecer uma composição tendo um espectro mais amplo de atividade ou persistência aumentada em um loco; sinergizar a atividade ou complementar a atividade (por exemplo, aumentando a velocidade do efeito ou superando a repelência) do composto de fórmula (I); ou ajudar a superar ou prevenir o desenvolvimento de resistência aos componentes individuais. O ingrediente ativo adicional particular dependerá da utilidade pretendida da composição. Exemplos de pesticidas adequados incluem os seguintes:

a) Piretroides, tais como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (em particular lambda-cihalotrina), bifentrina, fempropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides de proteção de peixe (por exemplo, etofenprox), piretrina natural, tetrametrina, s-bioaletrina, fenflutrina, praletrina ou carboxilato de 5-benzil-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropano;

b) Organofosfatos, tais como, profenofos, sulprofos, acefato, metil paration, azinfos-metila, demeton-s-metila, heptenofos, tiometon, fenamifos, monocrotofos, profenofos, triazofos, metamidofos, dimetoato, fosfamidon, malation, clorpirifos, fosalona, terbufos, fensulfotion, fonofos, forato, foxim, pirimifos-metila, pirimifos-etila, fenitrothion, fostiazato ou diazinon;

c) Carbamatos (incluindo carbamatos de arila), tais como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofurano, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbossulfan, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomila ou oxamila;

d) benzoil ureias, tais como diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron, flufenoxuron ou clorfluazuron;

e) Compostos de estanho orgânicos, tal como cihexatin, óxido de fenbutatin ou azociclotin;

- f) Pirazóis, tais como tebufenpirad e fempiroximato;
- g) Macrolídeos, tais como avermectinas ou milbemicinas, por exemplo, abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, spinosad ou azadiractina;
- 5 h) Hormônios ou feromônios;
- i) Compostos organocloro tais como endossulfan, hexacloreto de benzeno, DDT, clordano ou dieldrin;
- j) Amidinas, tais como clordimeform ou amitraz;
- k) Agentes fumigantes, tais como cloropicrin, dicloropropano, brometo de metila ou metam;
- 10 l) Compostos de cloronicotínica tais como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, nitempiram ou tiametoxam;
- m) Diacil-hidrazinas, tais como tebufenozida, cromafenozida ou metoxifenozida;
- 15 n) Éteres difenílicos, tais como diofenolan ou piriproxifeno;
- o) Indoxacarb;
- p) Clorfenapir; ou
- q) Pimetrozina, em particular di-hidrato de pimetrozina.
- Além das classes químicas maiores de pesticida listado acima,
- 20 outros pesticidas tendo alvos particulares podem ser empregados na composição, se apropriados para a utilidade pretendida da composição. Por exemplo, inseticidas seletivos para colheitas particulares, por exemplo, inseticidas específicos de broca do caule (tal como cartap) ou inseticidas específicos de saltador (tal como buprofezin) para uso em arroz podem ser empregados. Alternativamente, inseticidas ou acaricidas específicos para espécies/estágios de inseto particulares podem também ser incluídos nas composições (por exemplo, ovo-larvicidas de acaricida, tais como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox ou tetradifon; motilicidas de acaricida, tais como dicofol ou propargita; acaricidas, tais como bromopropilato ou clorobenzilato;
- 25 ou reguladores de crescimento, tais como hidrametilnon, ciromazina, metopreno, clorfluazuron ou diflubenzuron).
- 30

Exemplos de compostos fungicidas que podem ser incluídos na

composição da invenção são (*E*)-*N*-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metóxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-*N,N*-dimetil-6-trifluorometil-benzimidazol-1-sulfonamida, 97 \f "Symbol" \s 12-[*N*-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metóxi-acetamido]-□-butirolactona, 4-cloro-2-ciano-*N,N*-dimetil-5-*p*-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazossulfamida), 3-5-dicloro-*N*-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), *N*-alil-4,5,-dimetil-2-trimetilsililtiofeno-3-carboxamida (MON65500), *N*-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenóxi)-propionamida (AC382042), carboxamida de *N*-(2-metóxi-5-piridil)-ciclopropano, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azoxistrobin, benalaxila, benomila, biloxazol, bitertanol, blastidicidín S, bromuconazol, bupirimato, captafol, captan, carbendazim, cloridrato de carbendazim, carboxin, carpropamid, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonila, clorozolinato, clozilacon, compostos contendo cobre tais como oxicloreto de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre e mistura Bordeaux, cimoxanila, ciproconazol, ciprodinila, debacarb, 1,1'-dióxido de dissulfeto de di-2-piridila, diclofluanid, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de *O,O*-di-*isopropil-S*-benzila, dimefluazol, dimetconazol, dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditianon, cloreto de dodecil dimetil amônio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfos, epoxiconazol, etirimol, (*Z*)-*N*-benzil-*N*[(metil(metil-tioetilidenoamino-oxicarbonil)amino)tio]-β-alaninato de etila, etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fembuconazol, fenfuram, fenhexamida (KBR2738), fempiclonila, fempropidina, fempropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferinzona, fluazinam, fludioxonila, flumetover, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanila, flutriafol, folpet, fuberidazol, furalaxila, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidróxi-isoxazol, himexazol, imazalila, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), carbamato de isopropanil butila, isoprotiolano, casugamicina, cresoxim-metila, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronila, metalaxila, metconazol, metiram, metiram-zinco, metominostrobin, miclobutanila, neasozin, dimetilditio-

carbamato de níquel, nitrotal-isopropila, nuarimol, ofurace, compostos de organomercúrio, oxadixila, oxassulfuron, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato, penconazol, pencicuron, óxido de fenazina, fosetil-Al, ácidos fosforosos, ftaletto, picoxistrobin (ZA1963), polioxin D, poliram, probe-
5 nazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiônico, pirazofos, pirifenox, pirimetanila, piroquilon, piroxifur, pirrolnitrina, compostos de amônio quaternário, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, sipconazol (F-155), pentaclorofenato de sódio, espiroxamina, estreptomina, enxofre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tiflu-
10 zamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metila, tiram, timibenconazol, tolclfos-metila, tolilfluanida, triadimefon, triadimenol, triazbutila, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobin (CGA279202), triforina, triflumizol, triti-conazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb e ziram.

Os compostos de fórmula (I) podem ser misturados com terra,
15 turfa ou outros meios de enraizamento para a proteção de plantas contra doenças fúngicas transportadas por semente, transportada por terra ou foliares.

Exemplos de sinergistas adequados para uso nas composições incluem butóxido de piperonila, sesamex, safroxan e dodecil imidazol.

20 Herbicidas adequados e reguladores de crescimento de planta para inclusão nas composições dependerão do alvo pretendido e do efeito requerido.

Um exemplo de um herbicida seletivo de arroz que pode ser incluído é propanila. Um exemplo de um regulador de crescimento de planta
25 para uso em algodão é PIX®.

Algumas misturas podem compreender ingredientes ativos que têm propriedades físicas, químicas ou biológicas significativamente diferentes de modo que elas não se proporcionem facilmente para o mesmo tipo de formulação convencional. Nestas circunstâncias outros tipos de formulação
30 podem ser preparados. Por exemplo, onde um ingrediente ativo é um sólido insolúvel em água e o outro um líquido insolúvel em água, pode no entanto ser possível dispersar cada ingrediente ativo na mesma fase aquosa contí-

nua, dispersando-se o ingrediente ativo sólido como uma suspensão (usando uma preparação análoga àquela de um SC), porém dispersando-se o ingrediente ativo líquido como uma emulsão (usando uma preparação análoga àquela de um EW). A composição resultante é uma formulação de suspensão (SE).

Vários aspectos e modalidades da presente invenção serão agora ilustrados em mais detalhes por meio de exemplo. Será apreciado que modificação de detalhe pode ser feita sem afastar-se do escopo da invenção.

Para evitar dúvida, onde uma referência literária, pedido de patente, ou patente, é citado no texto deste pedido, o texto completo da referida citação é incorporado aqui por referência.

EXEMPLOS

Exemplo 1: 2-[1-(2,5-difluór-fenóxi)-propil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol

0,20 g (1,5 mmol) de 2,5-difluorofenol e 0,28 g (1,5 mmol) de 2-(1-cloro-propil)-4,5-di-hidro-1H-imidazol (preparado seguindo Klarer e Urech 1944, Helv. 27:1762) na presença de 0,83 g (4,6 mmols) de carbonato de potássio e quantidades catalíticas de 18-coroa-6 e iodeto de potássio em 1 ml de dimetiléter de resorcinol a 155°C. Após duas horas, a mistura foi acidificada em temperatura ambiente com ácido clorídrico a 2M para pH 3 e extraída duas vezes com acetato de etila. A fase aquosa foi neutralizada com solução de hidróxido de sódio a 2M e extraída duas vezes em pH 9 com acetato de etila fresco, secada e evaporada. O resíduo obtido foi purificado por cromatografia de sílica-gel (eluente: acetato de etila/metanol/trietilamina 80:15:5). Após cristalização de acetato de etila e n-hexano, 2-[1-(2,5-difluór-fenóxi)-propil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol puro (tabela 3, exemplo 1.009) foi obtido; P.F.: 110-110,5°C; ¹H-RMN (CDCl₃): 7,02, m, 1H; 6,84, m, 1H; 6,62, m, 1H; 4,76, t, 1H; 3,67, bm, 2H; 3,56, bm, 2H; 1,9-2,1, m, 2H; 1,06, t, 3H.

Exemplo 2: 2-[1-(2,6-difluór-3-metil-fenóxi)-propil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol

A: 0,50 g (3,5 mmols) de 2,6-difluór-3-metilfenol e 0,72 g (3,7 mmols) de éster etílico de ácido 2-bromo-butírico foram aquecidos durante uma hora na presença de 0,73 g (5,3 mmols) de carbonato de potássio e

uma quantidade catalítica de 18-coroa-6 em 8 ml de acetonitrila para temperatura de refluxo. O produto foi extraído com água e acetato de etila, secado e evaporado até a secura.

B: A 0,8 ml de uma solução a 2M de trimetilalumínio em tolueno
5 (0,11 g, 1,6 mmol) foi adicionada a -10°C em gotas uma solução de 95 mg (1,6 mmol) de etileno diamina dissolvida em 6 ml de tolueno seco. Após 15 minutos de agitação a $0 - 5^{\circ}\text{C}$, 0,39 g (1,5 mmol) de éster etílico de ácido 2-(2,6-difluór-3-metil-fenóxi)-butírico obtido pela etapa A dissolvido em 2 ml de tolueno foi adicionado. A mistura foi lentamente aquecida para temperatura
10 de refluxo e mantida durante quatro horas. Em seguida, à mistura resfriada para temperatura ambiente um excesso de gelo e água foi cuidadosamente adicionado e extraído duas vezes em pH 3-4 com acetato de etila que foi descartado. A fase aquosa foi basificada com solução de hidróxido de sódio a 2M para pH 9 e extraída duas vezes com acetato de etila fresco, secada e
15 evaporada até a secura, onde 2-[1-(2,6-difluór-3-metil-fenóxi)-propil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol cristalino foi obtido; P.F. $70,5-71^{\circ}\text{C}$; $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3): 6,74-6,87, m, 2H; 4,74, t, 1H; 3,67, bm, 2H; 3,52, bm, 2H; 2,22, s, 3H; 2,01, m, 1H, 1,92, m, 1H, 1,09, t, 3H.

Exemplo 3: 2-[1-(3,5-difluór-fenóxi)-etil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol

20 A: 9,76 g (7,5 mmols) de 3,5-difluorfenol e 5,96 g (7,9 mmols) de cloroacetonitrila foram aquecidos na presença de 20,7 g (0,15 Mol) de carbonato de potássio e uma quantidade catalítica de iodeto de potássio durante 2 horas em refluxo de acetonitrila. A mistura foi filtrada com uma mistura de acetato de etila e n-heptano (1:4) através de uma almofada pequena de
25 sílica-gel e evaporada até a secura. (3,5-difluór-fenóxi)-acetonitrila foi obtida como líquido: $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3): 6,57, m, 1H; 6,52, m, 2H; 4,75, s, 2H.

B: 12,7 g (7,5 Mol) do produto obtido sob A foram adicionados a 85°C em gotas durante 20 minutos a uma mistura de 18 g (0,3 Mol) de etileno diamina contendo 0,65 g (3,8 mmols) de tetrassulfeto de dissódio. Agitação
30 contínua durante mais 10 minutos a 90°C até a evolução de amônia cessar. A mistura reacional resfriada foi transferida para água gelada, e o 2-(3,5-difluór-fenoximetil)-4,5-di-hidro-1H-imidazol cristalino puro foi filtrado,

lavado com água e secado a 60°C; P.F.: 116-116,5°C.

C: 2,12 g (10 mmols) de 2-(3,5-difluór-fenoximetil)-4,5-di-hidro-1H-imidazol (B) e 1,28 g (11 mmols) de tetrametil etileno diamina dissolvido em 25 ml de dietiléter foram tratados com 2,33 g (10,5 mmols) de trimetilsilil-triflato. Após 30 minutos, a mistura reacional foi resfriada para -75°C, onde
5 mais 2,56 g (22 mmols) de tetrametil etileno diamina foram adicionados seguidos por adição em gotas durante 20 minutos de 13,75 ml (22 mmols) de n-butil-lítio como uma solução a 1,6 M em n-hexano. Após agitação continuada durante uma hora, 14 g de iodeto de metila (0,1 Mol) foram adicionados.
10 Agitação foi continuada durante mais uma hora. Em seguida, uma mistura de 10 ml de etanol em 20 ml de hidróxido de sódio a 2M foram adicionados e sob agitação a mistura reacional foi deixada atingir a temperatura ambiente. A mistura reacional foi acidificada e extraída três vezes com dietiléter que foi descartado. A fase aquosa foi tratada com solução de hidróxido de sódio
15 para pH 9 novamente e extraída duas vezes com acetato de etila. 2-[1-(3,5-difluór-fenóxi)-etil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol bruto foi obtido como um produto cristalino.

D: 0,9 g (4,2 mmols) do produto obtido sob C foi dissolvido em diclorometano e tratado na presença de 0,49 g (4,8 mmols) de trietilamina com 0,96 g (4,4 mmols) de anidrido de ácido bis-terc-butoxicarbônico. Após
20 30 minutos de agitação em temperatura ambiente, a mistura foi lavada com água, evaporada até a secura e cromatografada sobre sílica-gel (eluente: 30% de acetato de etila em n-heptano). Éster terc-butílico de ácido 2-[1-(3,5-difluór-fenóxi)-etil]-4,5-di-hidro-imidazol-1-carboxílico puro: ¹H-RMN (CDCl₃): 6,42, m, 2H; 6,39, m, 1H; 6,71, q, 1H; 3,80, m, 4H; 1,64, d, 3H; 1,53, s, 9H.

E: 0,17 g (0,52 mmol) do produto puro obtido em D foi aquecido na presença de 0,59 g (0,52 mmol) de ácido trifluoroacético em refluxo de diclorometano. Após uma hora, solução de hidróxido de sódio diluída foi agi-
30 tada e a mistura extraída duas vezes em pH 9 com diclorometano. Desta maneira, 2-[1-(3,5-difluór-fenóxi)-etil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol puro (tabela 3, exemplo 1.015) foi obtido; P.F.: 134-134,5°C.

Exemplo 4: 2-[1-(2,3,5-trifluór-6-metil-fenóxi)-propil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol

A: 0,63 g (3,62 mmols) de 1,2,5-trifluór-3-metoximetóxi-benzeno (obtido seguindo Synthesis 2004(10), 1609, por tratamento com 1,2,5-trifluorofenol com clorometil-metiléter e base de Hunig em diclorometano) foi dissolvido em tetra-hidrofurano seco (3 ml) e tratado primeiro a -78°C com uma solução a 1,6 N de n-butil-lítio em n-hexano (3,2 ml, 5,1 mmols). A mistura foi agitada durante cerca de 30 minutos e tratada em seguida com excesso de iodeto de metila (3,1 g, 21,7 mmols) dissolvido em 2 ml de tetra-hidrofurano. Quando sob agitação 0°C foi atingido, a mistura foi extraída com acetato de etila juntamente com água e salmoura. O produto evaporado foi purificado em sílica-gel (eluente: ciclo-hexano/acetato de etila 4:1) para fornecer como um óleo 1,2,5-trifluór-3-metoximetóxi-4-metil-benzeno; ¹H-RMN (CDCl₃): 6,61, m, 1H; 5,04, s, 2H; 3,38, s, 3H; 2,02, s, 3H.

B: 0,54 g (2,62 mmols) do produto obtido em A foi aquecido em uma mistura de HCl concentrado (5 ml) e isopropanol (5 ml) durante meia hora a 75°C. A mistura resfriada foi alcalinizada com NaOH e extraída em >pH 12 com terc-butilmetiléter, que foi descartado. A fase aquosa básica foi acidificada novamente e extraída com diclorometano, secada e evaporada a 50 kPa (500 mbar) a 40°C, para deixar como um óleo 2,3,5-tetrafluór-6-metilfenol.

C: 0,84 g (5,2 mmols) do produto obtido em B e 0,93 g (5,7 mmols) de éster 1-ciano-propílico de ácido metanossulfônico foram aquecidos em seguida em temperatura de refluxo durante 4 horas na presença de 0,89 g (6,4 mmols) de carbonato de potássio em 10 ml de acetonitrila. O produto foi extraído com terc-butilmetiléter e água em pH 12, secado e evaporado até a secura. O material bruto foi purificado em sílica-gel (eluente: ciclo-hexano/acetato de etila 9:1) para fornecer como um óleo 2-(2,3,5-trifluór-6-metil-fenóxi)-butironitrila; ¹H-RMN (CDCl₃): 6,62, m, 1H; 4,66, t, 1H; 2,01, s, 3H; 2,05, m, 2H; 1,13, t, 3H.

D: 50 mg (0,2 mmol) de produto obtido em C foram aquecidos na presença de 0,52 g (0,86 mmol) de etilendiamina e uma quantidade de espátula de Na₂S₄ em 2 ml de metanol durante 3 horas para temperatura de

refluxo. Em seguida, o produto foi extraído com HCl a 2N e terc-butilmetiléter, e a fase orgânica foi descartada. A fase aquosa foi neutralizada com 30% de NaOH e extraída em pH 12 com diclorometano, secada e evaporada. O material bruto foi purificado por cromatografia rápida (eluyente: 5 ciclo-hexano/acetato de etila/trietilamina 5:5:1), para fornecer 2-[1-(2,3,5-trifluór-6-metil-fenóxi)-propil]-4,5-di-hidro-1H-imidazol puro (tabela 3, exemplo 1.022); P.F. 99-101°C; ¹H-RMN (CDCl₃): 6,64, m, 1H; 4,72, t, 1H; 3,68, m, 2H; 3,55, m, 2H; 2,13, s, 3H; 1,98, m, 2H; 1,04, t, 3H.

Exemplo 5

10 Este exemplo ilustra as propriedades peticidas/inseticidas de compostos de fórmula (I). Os números dos compostos são aqueles das tabelas de dados de caracterização. Testes contra as seguintes pestes *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, e *Tetranychus urticae* foram realizados como descrito abaixo:

15 5.1 *Heliothis virescens* (minhoca do botão do Tabaco):

Ovos (0-24 horas de idade) foram colocados em placa de microtítulo de 24 poços em dieta artificial e tratados com soluções-teste em uma faixa de aplicação de 200 ppm por pipetagem. Após um período de incubação de 4 dias, amostras foram checadas quanto à mortalidade de ovo, mortalidade de larva, e regulação de crescimento.

Os seguintes compostos forneceram pelo menos 80% de controle de *Heliothis virescens*: I-2, 1.017, 1.023, 1.026.

5.2 *Myzus persicae* (Afídeo do pêssago verde):

25 Discos de folha de girasol foram colocados sobre ágar em uma placa de microtítulo de 24 poços e vaporizados com soluções-teste em uma faixa de aplicação de 200 ppm. Após secagem, os discos de folha foram infestados com uma população de afídeo de idades misturadas. Após um período de incubação de 6 DAT, amostras foram checadas quanto a mortalidade.

30 Os seguintes compostos forneceram pelo menos 80% de controle de *Myzus persicae*: 1.002, I-2, 1.005, XIV-2, 1.008, 1.009, 1.010, XI-2, III-2, 1.015, 1.017, 1.021, 1.023, 1.024, 1.026, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031,

1.032, 1.034.

5.3 *Myzus persicae* (Afídeo do pêssego verde):

5 Raízes de mudas de ervilha, infestadas com uma população de afídeo de idades misturadas, foram colocadas diretamente nas soluções-teste de 24 ppm. 6 dias após a introdução, amostras foram checadas quanto à mortalidade.

Os seguintes compostos forneceram pelo menos 80% de controle de *Myzus persicae*: I-2, XIV-2, 1.008, 1.009, 1.017, 1.018, 1.021, 1.023, 1.026, 1.028, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.034.

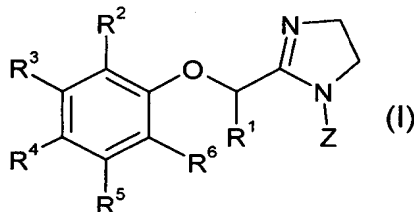
10 5.4 *Tetranychus urticae* (Ácaro aranha de duas manchas):

15 Discos de folha de feijão sobre ágar em placas de microtítulo de 24 poços foram vaporizados com soluções-teste em uma faixa de aplicação de 200 ppm. Após secagem, os discos de folha são infestados com populações de ácaro de idades misturadas. 8 dias depois, discos são checados quanto à mortalidade de ovo, mortalidade de larva, e mortalidade de adulto.

Os seguintes compostos forneceram pelo menos 80% de controle de *Tetranychus urticae*: 1.002, 1.003, I-2, 1.005, XIV-2, 1.008, 1.009, 1.010, XI-2, III-2, 1.017, 1.021, 1.022, 1.023, 1.024, 1.029, 1.030, 1.031, 1.032, 1.034.

REIVINDICAÇÕES

1. Composto de fórmula (I):



ou sais ou N-óxidos dos mesmos, em que:

R¹ é C₁₋₁₀ alquila;

5 R² é hidrogênio, metila, etila, C₁₋₂ haloalquila, ou halogênio;

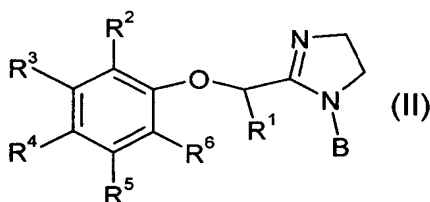
R³ é hidrogênio, metila, etila, C₁₋₂ haloalquila, ou halogênio;

R⁴ é hidrogênio, metila, ou halogênio;

R⁵ é hidrogênio, metila, ou halogênio;

R⁶ é hidrogênio, metila, etila, ou halogênio;

10 Z é hidrogênio, hidróxi, nitro, ciano, rodano, formila, G, G-S-, G-S-S-, G-A-, R⁷R⁸N-, R⁷R⁸N-S-, R⁷R⁸N-A-, G-O-A-, G-S-A-, (R¹⁰O)(R¹¹O)P(X)-, (R¹⁰O)(R¹¹S)P(X)-, (R¹⁰O)(R¹¹)P(X)-, (R¹⁰S)(R¹¹S)P(X)-, (R¹⁰O)(R¹⁴R¹⁵N)P(X)-, (R¹¹)(R¹⁴R¹⁵N)P(X)-, (R¹⁴R¹⁵N)(R¹⁶R¹⁷N)P(X)-, G-N=CH-, G-O-N=CH-, N≡C-N=CH-, ou Z é grupo de fórmula (II)



15 em que B é S-, S-S-, S(O)-, -C(O)-, ou (CH₂)_n-, n é um número inteiro de 1 a 6 inclusive e R¹, R², R³, R⁴, R⁵, e R⁶ são como definidos acima;

G é C₁₋₁₀ alquila opcionalmente substituída, C₂₋₁₀ alquenila opcionalmente substituída, C₂₋₁₀ alquinila opcionalmente substituída, C₃₋₇ cicloalquila opcionalmente substituída, C₃₋₇ cicloalquenila opcionalmente substituída, arila opcionalmente substituída, heteroarila opcionalmente substituída ou heterociclila opcionalmente substituída;

A é S(O), SO₂, C(O) ou C(S);

R⁷, R⁸ e R⁹ são cada independentemente hidrogênio ou G; ou R⁷

e R^8 juntos com o átomo N ao qual eles são ligados formam um grupo $N=CR^{12}R^{13}$; ou R^7 e R^8 juntos com o átomo N ao qual eles são ligados formam um anel heterocíclico de cinco, seis ou sete membros, cujo anel heterocíclico opcionalmente contém um ou dois heteroátomos adicionais selecionados de O, N ou S, e é opcionalmente substituído por um ou dois grupos C_{1-6} alquila;

R^{10} e R^{11} são cada independentemente C_1 - C_6 alquila, benzila, ou fenila em que o grupo fenila é opcionalmente substituído com halogênio, nitro, ciano, C_{1-3} alquila, C_{1-3} haloalquila, C_{1-3} alcóxi, ou C_{1-3} haloalcóxi;

R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} e R^{17} são cada independentemente hidrogênio ou C_1 - C_6 alquila;

e

X é O ou S;

contanto que pelo menos um dos grupos R_2 , R_3 , R_4 , R_5 e R_6 é flúor.

2. Composto ou sal do mesmo de acordo com a reivindicação 1, em que R^2 é metila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, flúor ou cloro, R^4 é hidrogênio, e pelo menos um dos grupos R^3 , R^5 e R^6 é diferente para hidrogênio.

3. Composto ou sal do mesmo de acordo com a reivindicação 1 ou 2, em que R^3 é metila, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, flúor ou cloro, R^4 é hidrogênio, e R^5 e R^6 são cada independentemente hidrogênio ou flúor.

4. Composto ou sal do mesmo de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, em que R^2 é metila, flúor ou cloro, R^3 é flúor, cloro, metila ou trifluorometila, e R^4 , R^5 e R^6 são hidrogênio.

5. Composto ou sal do mesmo de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, em que: R_1 é C_{1-6} alquila; e

Z é hidrogênio; ciano; formila; C_{1-6} alquila opcionalmente substituída; C_{3-6} alquenila; C_{3-6} haloalquenila; C_{3-6} alquinila; C_{1-6} alquiltio; C_{1-6} haloalquiltio; C_{1-6} cianoalquiltio; feniltio opcionalmente substituído, referida substituição sendo selecionada de halogênio, nitro, ciano, C_{1-3} alquila, e C_{1-3} alcó-

xi; C₁₋₆ alquilditio; di(C₁₋₄ alquil)aminotio; C₁₋₆ alquilcarbonila opcionalmente substituída, referida substituição sendo selecionada de halogênio, ciano, e C₁₋₃ alcóxi; C₂₋₆ alquenilcarbonila; C₃₋₆ cicloalquilcarbonila; fenilcarbonila opcionalmente substituída, referida substituição sendo selecionada de halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, e C₁₋₃ alcóxi; heteroarilcarbonila opcionalmente substituída, referida substituição sendo selecionada de halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, e C₁₋₃ alcóxi; C₁₋₆ alcoxicarbonila; C₁₋₆ alquiltio-carbonila; feniltio-carbonila opcionalmente substituída, referida substituição sendo selecionada de halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, e C₁₋₃ alcóxi; N,N-di C₁₋₃ alquilaminocarbonila; C₁₋₃ alquilaminocarbonila; C₃₋₅ alquenilaminocarbonila; C₃₋₅ alquinilaminocarbonila; fenilaminocarbonila, em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi); N-fenil-N-metil aminocarbonila, em que o referido grupo fenila é opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi); C₁₋₆ alcoxitionocarbonila; C₁₋₆ alquiltiotionocarbonila; feniltiotionocarbonila opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi; N,N-di C₁₋₃ alquilaminotionocarbonila; C₁₋₃ alquilaminotionocarbonila; fenilaminotionocarbonila em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi; N-fenil-N-metil aminotionocarbonila em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi; C₁₋₃ alquilsulfonila; C₁₋₃ haloalquilsulfonila; C₁₋₃ alquensulfonila; fenilsulfonila opcionalmente substituída por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi; N,N-di C₁₋₃ alquilaminossulfonila; di C₁₋₃ alcóxi-P(=O)-; di C₁₋₃ alquiltio-P(=O)-; di C₁₋₃ alcóxi-P(=S)-; di C₁₋₃ alquiltio-P(=S)-; (C₁₋₃ alcóxi)(fenil)P(=O)-; (C₁₋₃ alcóxi)(fenil)P(=S)-; C₁₋₃ alquil-N=CH-; C₁₋₃ alcóxi-N=CH-; ciano-N=CH-; fenil-N=CH- em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído por halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi; 2-piridil-N=CH-; 3-piridil-N=CH-; 2-tiazolil-N=CH-; ou um composto de fórmula (II) em que B é S- ou CH₂-; e em que quando Z é um grupo C₁₋₆ alquila opcionalmente substituída referida substituição é selecionada de: 1-7 átomos de flúor; 1-3 átomos de cloro; 1-3 átomos de bromo; um grupo ciano; 1-2 grupos C₁₋₃ alcóxi; um grupo C₁₋₃ ha-

loalcóxi; um grupo C₁₋₃ alquiltio; um grupo C₁₋₃ haloalquiltio; um grupo alilóxi; um grupo propargilóxi; um grupo C₃₋₆ cicloalquila; um grupo fenila, em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído com halogênio, nitro, ciano, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi; um grupo C₁₋₃ alquilcarbonilóxi; um grupo C₁₋₃ alcoxycarbonila; um grupo C₁₋₃ alquilcarbonila; e uma benzoíla opcionalmente substituída, referida substituição sendo selecionada de halogênio, nitro, C₁₋₃ alquila, C₁₋₃ alcóxi, e um grupo ciano.

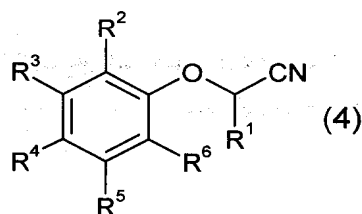
6. Composto ou sal do mesmo de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, em que:

10 R¹ é C₁₋₃ alquila; pelo menos um de R², R³, R⁵ e R⁶ é flúor; e em que Z é selecionado de: hidrogênio; ciano; formila; C₁₋₃ alquila; C₁₋₃ haloalquila; C₁₋₃ cianoalquila; C₁₋₃ alcóxi-C₁₋₃ alquila; C₁₋₃ benzilóxi-C₁₋₃ alquila; alila; propargila; C₁₋₆ alquiltio; C₁₋₆ haloalquiltio; feniltio opcionalmente substituído com halogênio, C₁₋₃ alquila, ou C₁₋₃ alcóxi; C₁₋₆ alquilcarbonila; fenilcarbonila opcionalmente substituída por halogênio, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi; C₁₋₆ alcoxycarbonila; C₁₋₃ alquilaminocarbonila; fenilaminocarbonila em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído com halogênio, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi; C₁₋₃ alquilaminotionocarbonila; fenilaminotionocarbonila em que referido grupo fenila é opcionalmente substituído por halogênio, C₁₋₃ alquila ou C₁₋₃ alcóxi; C₁₋₃ alquilsulfonila; C₁₋₃ haloalquilsulfonila; di C₁₋₃ alcóxi-P(=O)-; C₁₋₃ alcóxi-N=CH-; ciano-N=CH-; e 2-piridil-N=CH-.

7. Composto ou sal do mesmo de acordo com qualquer uma das reivindicações precedentes, em que:

25 R¹ é etila ou n-propila, e
Z é hidrogênio.

8. Processo para a preparação de um composto da fórmula (I) como definido na reivindicação 1, que compreende reagir na presença de um catalisador, um composto da fórmula (4)



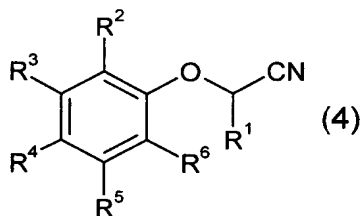
em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 e R^6 são como definidos na reivindicação 1, com uma diamina da fórmula (5)



em que Z é como definido na reivindicação 1.

5

9. Composto da fórmula (4)



em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 e R^6 são como definidos na reivindicação 1.

10. Composição inseticida, acaricida, nematicida ou moluscicida compreendendo um composto como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 7.

10

11. Método de combater e/ou controlar uma peste selecionada do grupo consistindo em insetos, acarídeos, nematódeos e moluscos, que compreende aplicar à referida peste, ou ao loco de referida peste, ou a uma planta suscetível ao ataque pela referida peste, uma quantidade pesticidamente eficaz de um composto ou um sal como definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 7, ou uma quantidade pesticidamente eficaz de uma composição como definida na reivindicação 10.

15

12. Método de acordo com a reivindicação 11, em que referida peste é um inseto da ordem Hemiptera, Lepidoptera, Coleoptera, Thysanoptera, Diptera, Blattodea, Isoptera, Siphonaptera, Hymenoptera, ou Orthoptera.

20

13. Método de acordo com a reivindicação 12, em que referido inseto é da ordem Hemiptera, Lepidoptera, Coleoptera, Thysanoptera ou Diptera.

14. Método de acordo com a reivindicação 12 ou 13, em que referido inseto é da ordem Hemiptera.

15. Método de acordo com a reivindicação 12, em que referido inseto é da ordem Lepidoptera, Thysanoptera, Isoptera, Siphonoptera, Hymenoptera, ou Orthoptera

16. Método de acordo com a reivindicação 11, em que referida peste é um acarídeo.

RESUMO

Patente de Invenção: "**COMPOSTOS QUÍMICOS**".

5 A presente invenção refere-se a derivados de imidazolina e a seu uso como agentes inseticida, acaricida, moluscicida e nematocida. A invenção também estende-se à composições inseticida, acaricida, moluscicida e nematicida compreendendo tais derivados de imidazolina, e aos métodos de uso de tais derivados e/ou composições para combater e controlar pestes de inseto, acarina, molusco e nematódeo. Em particular, a presente invenção refere-se às imidazolininas com substituintes alquila e flúor