

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

(21) **PI0610817-2 A2**

(22) Data de Depósito: 19/05/2006
(43) Data da Publicação: 27/07/2010
(RPI 2064)



(51) *Int.Cl.:*
A01N 43/14
A61K 31/445

(54) Título: **DERIVADOS HETEROCÍCLICOS E HETEROARILA COM SUBSTITUIÇÃO BENZILAMINO INSETICIDAS**

(30) Prioridade Unionista: 19/05/2005 US 60/682,460

(73) Titular(es): BAYER CROPSCIENCE AG

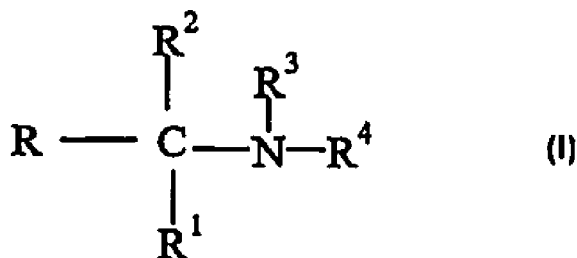
(72) Inventor(es): Benjamin J. Dugan, Edward J. Barron, George Theodoridis, John A. Dixon, Manorama M. Patel, Stephen F. Donovan, Zeinab M. Elshenawy

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

(86) Pedido Internacional: PCT US2006019365 de 19/05/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2006/127426 de 30/11/2006

(57) Resumo: DERIVADOS HETEROCÍCLICOS E HETEROARILA COM SUBSTITUIÇÃO BENZILAMINO INSETICIDAS. A presente invenção refere-se a alguns derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino tem fornecido atividade inseticida e acaricida inesperada. Estes compostos são representados pela fórmula (I): em que R, R¹, R², R³ e R⁴ são completamente aqui descritos. Além disso, as composições compreendendo uma quantidade inseticidamente eficaz de, pelo menos, um composto de fórmula (1) e, opcionalmente, uma quantidade eficaz de pelo menos um composto adicional, são também descritos; junto com métodos de controle de insetos compreendendo aplicar referidas composições a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.



Pet 020080008368
PI 0610817-2

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**DERIVADOS HETEROCÍCLICOS E HETEROARILA COM SUBSTITUIÇÃO BENZILAMINO INSETICIDAS**".

Este pedido reivindica o benefício de pedido provisório US
5 Nº 60/682,460 depositado em 19 de maio de 2005.

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção geralmente refere-se a compostos compostos pesticidas e seu uso no controle de insetos e ácaros. Em particular, ela pertence às composições de derivados inseticidas de heteroarila e heterocíclicos benzilamino substituídos e seus sais agriculturalmente aceitáveis, e
10 métodos para seu uso no controle de insetos e ácaros.

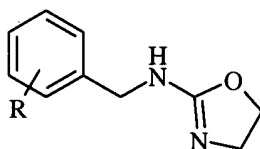
ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

Sabe-se bem que os insetos em geral podem causar dano significativo, não somente às culturas cultivadas em agricultura, mas também, por exemplo, em estruturas e gramados onde o dano é causado por insetos de
15 origem no solo, como térmitas e lagartas brancas. Este dano pode resultar na perda de milhões de dólares de valor associado com uma dada cultura, gramado ou estrutura. Apesar de existirem muitas ordens de insetos que podem causar dano significativo às culturas, insetos, por exemplo, da ordem de "Homoptera" são de importância principal. A ordem Homoptera inclui, por exemplo, afídeos, gafanhotos das folhas, cigarras, moscas brancas, e besouros da farinha. Os Homoptera tem partes da boca perfuradoras/sugadoras, permitindo ao mesmos se alimentar por retirada de seiva das plantas vasculares. O dano pelos insetos de Homoptera é manifestado em
20 vários modos diferentes, diferentes do dano causado por alimentação direta. Por exemplo, muitas espécies excretam substâncias doces, um produto de refugo pegajoso, que adere às plantas sobre as quais os insetos se alimentam e vivem. A substância doce sozinha causa dano cosmético às plantas de cultura. Os mofos fuliginosos com frequência crescem sobre a substância doce, tornando os produtos alimentícios ou plantas ornamentais de aparência desagradável, assim reduzindo seu valor cosmético e econômico. Alguns
30 Homoptera tem saliva tóxica que é injetada nas plantas enquanto eles estão

se alimentando. A saliva pode causar dano às plantas através da desfiguração e em alguns casos morte das plantas. Homoptera também podem ser um vetor para patógenos provocando doenças. Diferente do dano direto, não é necessário um grande número de insetos vetores de doenças para causar dano considerável às plantas de cultura.

Assim, existe uma demanda contínua para novos inseticidas e para novos acaricidas que sejam mais seguros, mais efetivos e menos onerosos. Os inseticidas e acaricidas são utilizáveis para controlar insetos e ácaros que podem, de outra forma, provocar dano significativo tanto acima como abaixo do nível do solo a culturas como trigo, milho, soja, batata, e algodão, para mencionar apenas algumas. Para proteção da cultura, os inseticidas e acaricidas são desejados, os quais podem controlar os insetos e ácaros sem danificar as culturas, e que não tem efeitos deletérios aos mamíferos e outros organismos vivos.

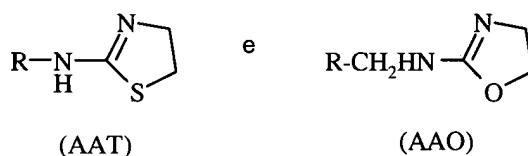
Vários artigos e patentes descrevem alguns compostos heteroarila e heterocíclicos de benzilamino substituídos que são relatados como tendo usos pesticidas. Por exemplo, o Journal of Inset Science, 3:4 (disponível online: inetscience.org/3,4) relata a eficácia de alguns agonistas de octopamina para suprir o comportamento de chamada da traça da farinha da índia, *Plodia interpunctella*. Estão incluídos nos estudos, os compostos da seguinte estrutura:



em que

R é alquila ou dois átomos de halogênio.

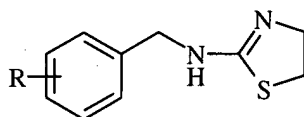
Pesticide Science, 55:119-128 (1999), descreve os estudos de estrutura - atividade quantitativa de ligandos octopaminérgicos contra o gafanhoto peregrino, *Locusta migratoria* e a barata americana, *Periplaneta Americana*. Estão incluídos nos estudos os compostos das fórmulas:



em que

R para fórmula (AAT) inclui benzila, e benzila substituída com metila, trifluorometila ou um a dois átomos de halogênio, e R para fórmula (AAO) inclui fenila substituída com trifluorometila ou um a dois átomos de halogênio.

Pesticide Science, 1995, 43 311-315 descreve estudos de estrutura - atividade quantitativa de alguns agonistas octopaminérgicos contra *Periplaneta Americana*. Estão incluídos no estudo os compostos da fórmula:



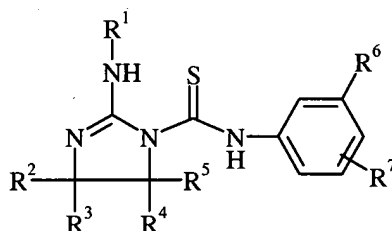
em que

10 R é hidrogênio, metila, trifluorometila, metóxi ou um a dois átomos de halogênio.

Bioscience, Biotechnology, and Biochemistry (1992), 56(7), 1062-5 descrevem a síntese e atividade octopaminérgica de 2-(substituído benzilamino)-2-tiazolinas.

15 European Journal of Medicinal Chemistry (1980), 15(1), 41-53,
descreve a síntese de novos derivados de derivados de "benzil"-tiouréia e
seus análogos cíclicos com atividade diurética e salurética.

Patente US 4.195.092 descreve 2-(amino substituído)-N-(3-fenil substituído)-2-imidazolina-1-carbotioamidas, utilizáveis como inseticidas, da
20 seguinte fórmula:



em que

R¹ inclui fenilquila, não contendo mais do que cerca de 18 átomos de carbono, em que a porção fenila é opcionalmente substituída com de um a três

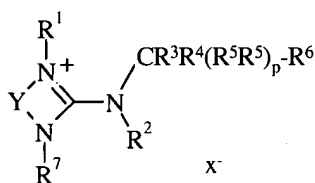
grupos selecionados dentre C₁-C₆ alquila, C₁-C₆ alcóxi, C₁-C₆ alquiltio, trifluorometila, halo, e ciano;

R², R³, R⁴, e R⁵ independentemente são selecionados dentre hidrogênio, C₁-C₃ alquila, e fenila;

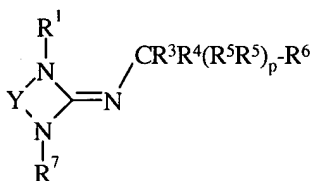
5 R⁶ representa halo, trifluorometila, ciano, ou 1,1,2,2-tetrafluoroetóxi;

R⁷ representa hidrogênio, C₁-C₃ alquila, ou halo.

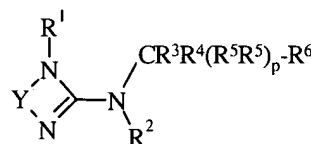
Publicação Internacional número WO 91/05473 descreve composições fungicidas, compostos, e sua produção e uso das seguintes fórmulas:



I-A



I-B



I-C

10 em que

R¹ e R⁷ são cada independentemente hidrogênio ou C₁-C₃ alquila, R² é hidrogênio ou C₁-C₆ alquila, R³ e R⁴ independentemente, e cada R⁵ independentemente são hidrogênio ou C₁-C₄ alquila, R⁶ é um grupo ciclohexila ou um grupo aromático monocíclico ou bicíclico, substituído com de 1 a 5 grupos da fórmula R⁸, em que R⁸ é halogênio, um grupo C₁-C₁₀ alquila, um grupo C₁-C₁₀ alcóxi, um grupo tri- C₁-C₄-alquilsilila, ou um grupo fenóxi, fenila, fenil-C₁-C₂-alquilenio, ou fenil-C₂-alquenienio, cada um opcionalmente substituído no grupo fenila ou fenóxi com um ou mais de átomos de halogênio, grupos C₁-C₆ alquila ou C₁-C₆ alcóxi, grupos trihalometila, grupos fenila ou grupos fenóxi. p é 0, 1, ou 2, Y é um grupo da fórmula -C(R⁹R⁹)_n-, em que n é 2, 3, ou 4, cada R⁹ independentemente é hidrogênio ou C₁-C₄ alquila e X é um contra-íon apropriado, junto com veículo ou diluente agriculturalmente aceitável.

15 grupos fenóxi. p é 0, 1, ou 2, Y é um grupo da fórmula -C(R⁹R⁹)_n-, em que n é 2, 3, ou 4, cada R⁹ independentemente é hidrogênio ou C₁-C₄ alquila e X é um contra-íon apropriado, junto com veículo ou diluente agriculturalmente aceitável.

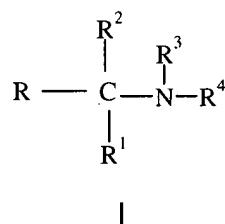
20 grupos fenóxi. p é 0, 1, ou 2, Y é um grupo da fórmula -C(R⁹R⁹)_n-, em que n é 2, 3, ou 4, cada R⁹ independentemente é hidrogênio ou C₁-C₄ alquila e X é um contra-íon apropriado, junto com veículo ou diluente agriculturalmente aceitável.

Não se encontra descrição ou sugestão em qualquer uma das patentes ou publicações de referência acima da atividade inseticida dos compostos da presente invenção contra membros da ordem de "Homoptera". Além disso, não se encontra descrição ou sugestão em qualquer uma das patentes ou publicações de referência acima sobre as estruturas dos com-

postos novos da presente invenção.

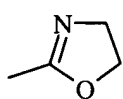
SUMÁRIO DA INVENÇÃO

A presente invenção geralmente refere-se a composições inseticidas e acaricidas de derivados heteroarila e heterocíclicos de benzilamino e a alguns compostos novos e utilizáveis, ou seja, alguns derivados heteroarila e heterocíclicos de benzilamino substituídos que são surpreendentemente ativos no controle de insetos e ácaros quando usados nas composições inseticidas e acaricidas e métodos desta invenção. As composições inseticidas e acaricidas da presente invenção são compreendidas por, pelo menos, um dentre uma quantidade inseticidamente efetiva de um composto de fórmula I e pelo menos um veículo inseticidamente compatível com o mesmo, em que o composto de fórmula I é:

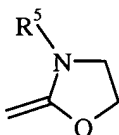


em que

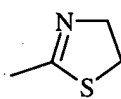
R, R¹, R² e R⁵ são descritos em detalhes abaixo;
R⁴ é selecionado dentre:



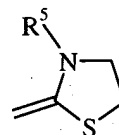
(A),



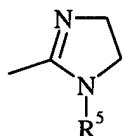
(B),



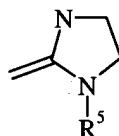
(C),



(D),



(E) e



(F);

R³ é descrito em detalhes abaixo ou é tomado junto com o átomo de conexão em R⁴ para formar uma ligação dupla como na fórmula (B), fórmula (D) e fórmula (F); e

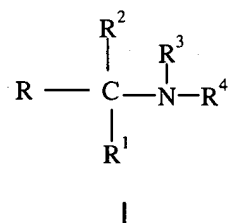
seus sais agriculturalmente aceitáveis.

A presente invenção também inclui composições contendo uma quantidade pesticidamente efetiva de pelo menos um composto de fórmula I, e opcionalmente, uma quantidade efetiva de pelo menos um composto adicional, com pelo menos um veículo pesticidamente compatível.

- 5 A presente invenção também inclui métodos de controlar insetos em uma área onde o controle é desejado, que compreende a aplicação de uma quantidade pesticidamente efetiva da composição acima ao local das culturas, construções, solo ou outras áreas onde os insetos estão presentes ou se espera estejam presentes.

10 DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

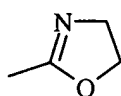
- A presente invenção geralmente refere-se a composições inseticidas e acaricidas de derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino e alguns novos e utilizáveis compostos, ou seja alguns derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino que são surpreendentemente ativos no controle de insetos e ácaros quando usados nas composições inseticidas e acaricidas e métodos da invenção. As composições inseticidas e acaricidas da presente invenção são compreendidas por pelo menos um dentre uma quantidade inseticidamente efetiva de um composto de fórmula I e pelo menos um veículo inseticidamente compatível para
- 20 o mesmo, em que o composto de fórmula I é:



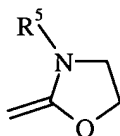
em que

R, R¹, R² e R⁵ são descritos em detalhes abaixo;

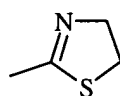
R⁴ é selecionado dentre:



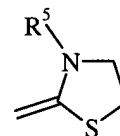
(A),



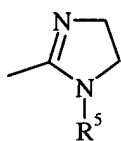
(B),



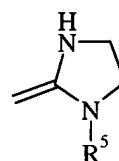
(C),



(D),



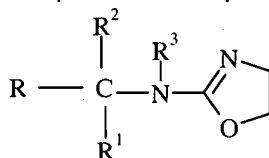
(E) e



(F);

R^3 é descrito em detalhes abaixo ou é tomado junto com o átomo de conexão em R^4 para formar uma ligação dupla como na fórmula (B), fórmula (D) e fórmula (F); e seus sais agriculturalmente aceitáveis.

- 5 Mais especificamente, espécies preferidas desta invenção são as composições inseticidas compreendidas por compostos de fórmula IA:



IA

em que

- R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C_1-C_2) alquila, (C_1-C_2) alcóxi, 10 (C_1-C_2) haloalquila e fenila;

R^1 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_2) alquila, (C_1-C_2) hidroxialquila e (C_1-C_2) haloalquila;

R^2 é selecionado dentre hidrogênio e (C_1-C_2) alquila; e

- 15 R^3 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_2) alquila,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi;

R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

- 20 R^{14} é hidrogênio;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é hidrogênio, (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

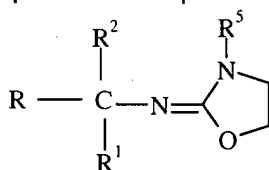
desde que

- 5 quando R é 1-naftila e R^3 é hidrogênio, então R^1 e R^2 são diferentes de (C_1-C_2) alquila.

Espécies mais preferidas neste aspecto da invenção são as composições inseticidas compreendidas por compostos de fórmula Ia onde R é 2,3-diclorofenila ou 2,3-dimetilfenila;

- 10 R^1 é hidrogênio ou metila; e
 R^2 e R^3 são hidrogênio.

Em outro aspecto desta invenção, espécies preferidas são as composições inseticidas compreendidas pela fórmula IB:



IB

- 15 em que

R é 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C_1-C_2) alquila;

R^1 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_4) alquila e (C_1-C_2) haloalquila;

R^2 é hidrogênio;

- 20 R^5 é selecionado dentre ciano, (C_1-C_2) alcóxi, (C_1-C_2) alquila, 4- (C_1-C_2) alcoxibenzila,

(1),	(3),	(5),

$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi ou (C_1-C_2) haloalquila;

R^{10} é hidrogênio;

5 R^{11} é (C_1-C_4) alquila;

R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio ou (C_1-C_2) alquila;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) dialquilamino;

10 R^{16} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

desde que

quando R é 1-naftila e R^5 é fórmula (5) onde X é enxofre, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio, então R^1 é diferente de (C_1-C_2) alquila; e

15 quando R é 3-cloro-2-metilfenila e R^1 é hidrogênio; então R^5 é diferente de fórmula (5) onde X é oxigênio, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio ou fórmula (6) onde a é 2 e R^{15} é metila.

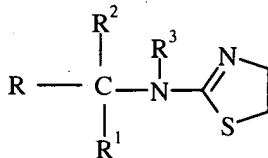
Espécies mais preferidas neste aspecto da invenção são as composições inseticidas compreendidas por compostos de fórmula IB onde

20 R é 2,3-diclorofenila, 2,3-dimetilfenila ou 3-cloro-2-metilfenila;

R^1 é hidrogênio; e

R^5 é ciano, fórmula (1), fórmula (5) ou fórmula (7).

Em outro aspecto desta invenção, espécies preferidas são as composições inseticidas compreendidas pela fórmula IC:



25

IC

onde

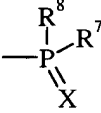
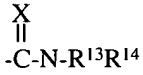
R é selecionado dentre 1-naftila, 2- (C_1-C_2) alcóxifenila, 3- (C_1-C_2) alcóxifenila, 4- (C_1-C_2) alcóxifenila, 2,4- (C_1-C_2) dialcóxifenila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C_1-C_2) alquila

e (C₁-C₂) haloalquila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₃) alquila, fenila ou benzila;

R² é hidrogênio; e

R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

5 onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

10 a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi;

desde que

15 quando R¹ e R³ são hidrogênio, então R é diferente de 2-metilfenila, 2,4-dimetilfenila ou 2-cloro-6-metilfenila;

quando R é fenila, R¹ e R³ são metila, então o composto é diferente de isômero ((1S)-1-feniletil)metil-1,3-tiazolin-2-ilamina;

20 quando R é fenila, R¹ é metila e R³ é hidrogênio, então o composto é diferente do isômero ((1R)-1-feniletil)-1,3-tiazolin-2-ilamina; e

quando R é 2,3-diclorofenila e R¹ é hidrogênio, então R³ é diferente de fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é metóxi.

Espécies mais preferidas neste aspecto da invenção são as composições inseticidas compreendidas por compostos de fórmula Ic onde

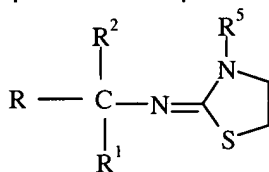
25 R é 2,3-diclorofenila ou 2,3-dimetilfenila;

R¹ é hidrogênio ou metila; e

R³ é hidrogênio ou fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é (C₁-C₂) alcóxi.

Em outro aspecto desta invenção, espécies preferidas são as

composições inseticidas compreendidas pela fórmula ID:



ID

onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

R¹ e R² são hidrogênio; e

R⁵ é selecionado dentre

$\begin{array}{c} \text{R}^8 \\ \\ -\text{P}-\text{R}^7 \\ \\ \text{X} \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{N}-\text{R}^{13}\text{R}^{14} \end{array}$	$-\text{S}(\text{O})_a-\text{R}^{15}$	$\begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{R}^{16} \end{array}$	$-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

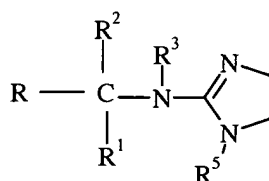
R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi.

Espécies mais preferidas neste aspecto da invenção são as composições inseticidas compreendidas por compostos de fórmula ID onde

R é 2,3-diclorofenila, 2,3-dimetilfenila;

R⁵ é fórmula (1) onde X é enxofre ou fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é (C₁-C₂) alcóxi.

Em outro aspecto desta invenção, espécies preferidas são as composições inseticidas compreendidas pela fórmula IE:



IE

onde

R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila e (C₁-C₂) haloalquila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₃) alquila, fenila ou benzila;

R² é hidrogênio; e

R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

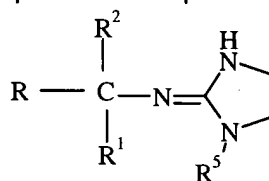
onde

- 10 X é oxigênio ou enxofre;
 R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;
 R¹³ é (C₁-C₂) alquila;
 R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

a é 2;

- 15 R¹⁵ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) dialquilamino;
 R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e
 R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi.

Em outro aspecto desta invenção, espécies preferidas são as composições inseticidas compreendidas pela fórmula IF:



IF

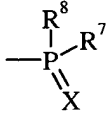
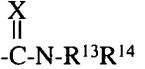
20

onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

R¹ e R² são hidrogênio; e

R⁵ é selecionado dentre ciano,

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

5 onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

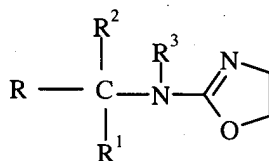
10 a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi.

15 Alguns dos derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino, utilizáveis nas composições da presente invenção, são compostos novos. Muitos destes compostos são representados pela fórmula IG:



IG

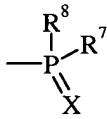
em que

20 R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila, (C₁-C₂) alcóxi, (C₁-C₂) haloalquila e fenila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila, (C₁-C₂) hidroalquila e (C₁-C₂) haloalquila;

25 R² é selecionado dentre hidrogênio e (C₁-C₂) alquila; e

R^3 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_2) alquila,

		$-S(O)_a-R^{15}$		$-CH=N-R^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi;

5 R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é hidrogênio, (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

10 R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

seus sais agriculturalmente aceitáveis;

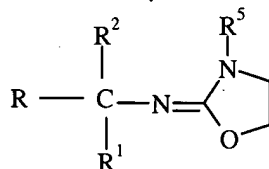
desde que

quando R^1 é metila e R^2 e R^3 são hidrogênio, então R é diferente de fenila;

15 quando R é 1-naftila e R^3 é hidrogênio, então R^1 e R^2 são diferentes de (C_1-C_2) alquila; e

quando R^1 , R^2 e R^3 são hidrogênio, então R é diferente de 2-clorofenila, 2-fluorofenila, 2-metilfenila, 4-clorofenila, 3-trifluorometilfenila, 3,4-diclorofenila e 3,5-diclorofenila.

20 Outros derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino, utilizáveis nas composições da presente invenção, são compostos novos. Estes compostos são representados pela fórmula IH:



IH

em que

25 R é 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C_1-C_2) alquila;

R^1 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_4) alquila e (C_1-C_2) haloalquila;

R^2 é hidrogênio;

R^5 é selecionado dentre ciano, (C_1-C_2) alcóxi, (C_1-C_2) alquila, 4-
5 (C_1-C_2) alcoxibenzila,

$\begin{array}{c} R^8 \\ \\ -P-R^7 \\ \\ X \end{array}$	$\begin{array}{c} R^{10} \quad O \\ \quad \\ -CH-O-C-R^{11} \end{array}$	$\begin{array}{c} X \\ \\ -C-N-R^{13}R^{14} \end{array}$
(1),	(3),	(5),

$-S(O)_a-R^{15}$	$\begin{array}{c} X \\ \\ -C-R^{16} \end{array}$	$-CH=N-R^{19}$
(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi ou (C_1-C_2) haloalquila;

R^{10} é hidrogênio;

10 R^{11} é (C_1-C_4) alquila;

R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio ou (C_1-C_2) alquila;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) dialquilamino;

15 R^{16} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

seus sais agriculturalmente aceitáveis;

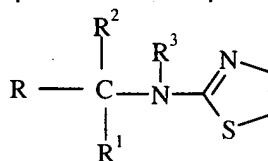
desde que

quando R é 1-naftila e R^5 é fórmula (5) onde X é enxofre, R^{13} é metila e R^{14} é
20 hidrogênio, então R^1 é diferente de (C_1-C_4) alquila; e

quando R é 3-cloro-2-metilfenila e R^1 é hidrogênio, então R^5 é diferente de
fórmula (5) onde X é oxigênio, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio ou fórmula (6)
onde R^{15} é metila.

Ainda outros derivados heterocíclicos e heteroarila com substitu-
25 ição benzilamino, utilizáveis nas composições da presente invenção, são

compostos novos. Estes compostos são representados pela fórmula IJ:



IJ

onde

5 R é selecionado dentre 1-naftila, 2-(C₁-C₂) alcóxifenila, 3-(C₁-C₂) alcóxifenila, 4-(C₁-C₂) alcóxifenila, 2,4-(C₁-C₂) dialcóxifenila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila e (C₁-C₂) haloalquila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₃) alquila, fenila ou benzila;

10 R² é hidrogênio; e

R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,

$\begin{array}{c} \text{R}^8 \\ \\ -\text{P}-\text{R}^7 \\ \\ \text{X} \end{array}$	$\begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{N}-\text{R}^{13}\text{R}^{14} \end{array}$	$-\text{S}(\text{O})_a-\text{R}^{15}$	$\begin{array}{c} \text{X} \\ \\ -\text{C}-\text{R}^{16} \end{array}$	$-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

15 R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi;

20 R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

seus sais agriculturalmente aceitáveis;

desde que

quando R é diferente de 2,3-dimetilfenila, então pelo menos um dentre R¹ ou R³ é diferente de hidrogênio;

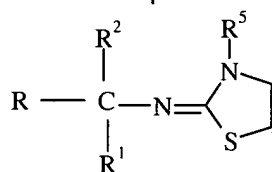
25 quando R é fenila, R¹ e R³ são metila, então o composto é dife-

rente de isômero ((1S)-1-feniletil)metil-1,3-tiazolin-2-ilamina;

quando R é fenila, R¹ é metila R³ é hidrogênio, então o composto é diferente de isômero ((1R)-1-feniletil)-1,3-tiazolin-2-ilamina; e

quando R é 2,3-diclorofenila e R¹ é hidrogênio, então R³ é diferente de fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é metóxi.

Outros derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino, utilizáveis nas composições da presente invenção, são compostos novos. Estes compostos são representados pela fórmula IK:



IK

10 onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

R¹ e R² são hidrogênio; e

R⁵ é selecionado dentre

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

15 onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

20 a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi;

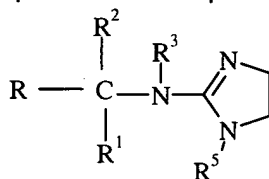
R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

seus sais agriculturalmente aceitáveis.

25

Ainda outros derivados heterocíclicos e heteroarila com substitui-

ção benzilamino, utilizáveis nas composições da presente invenção, são compostos novos. Estes compostos são representados pela fórmula IL:



IL

onde

5 R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila e (C₁-C₂) haloalquila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₃) alquila, fenila ou benzila;

10 R² é hidrogênio; e

R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,

		$-\text{S}(\text{O})_a-\text{R}^{15}$		$-\text{CH}=\text{N}-\text{R}^{19}$
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

15 R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

a é 2;

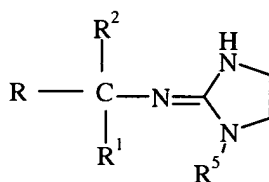
R¹⁵ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

20 R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

seus sais agriculturalmente aceitáveis.

Outros derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino, utilizáveis nas composições da presente invenção, são compostos novos. Estes compostos são representados pela fórmula IM:



IM

onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

5 R¹ e R² são hidrogênio; e

R⁵ é selecionado dentre ciano,

		-S(O) _a -R ¹⁵		-CH=N-R ¹⁹
(1),	(5),	(6),	(7) e	(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

10 R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

15 R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

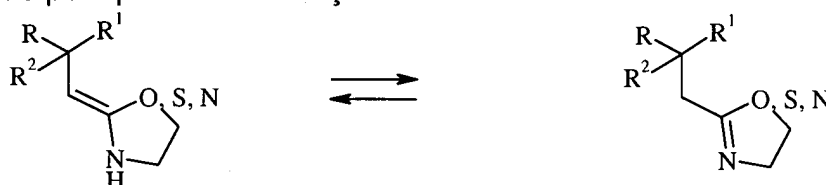
seus sais agriculturalmente aceitáveis.

Além disso, em alguns casos, os compostos da presente invenção podem possuir centros assimétricos que podem dar lugar a enantiômeros e diastereômeros ópticos. Os compostos podem existir em duas ou mais formas, isto é, polimorfos que são significativamente diferentes em propriedades físicas e químicas.

Os compostos da presente invenção podem existir como tautômeros, em que a migração de um átomo de hidrogênio dentro da molécula resulta em duas ou mais estruturas, que estão em equilíbrio. Por exemplo, compostos de fórmula I em que R⁴ é selecionado dentre (A) e (B), (C) e (D)

ou (E) e (F) podem existir em formas tautoméricas como mostrado nas fórmulas abaixo. Este tautomerismo é bem conhecido como é descrito em S. Patay (The Chemistry of Functional Groups: Amidines e Imidates, Vol 2, 1991, pags 259-262). Será entendido que estas formas tautoméricas são

5 englobadas pela presente invenção.



Esta invenção inclui o uso destes enantiomorfos, polimorfos, tautômeros, sais e complexos de metal. Os sais agriculturalmente aceitável e complexos de metal incluem, sem limitação, por exemplo, sais de amônio, os sais de ácidos orgânicos e inorgânicos, como ácido clorídrico, ácido sulfônico, ácido etanossulfônico, ácido trifluoroacético, ácido metilbenzenossulfônico, ácido fosfórico, ácido glucônico, ácido pamoico, e outros sais de ácidos, e os complexos de metal alcalino e alcalino terroso com por exemplo, sódio, potássio, lítio, magnésio, cálcio, e outros metais.

Os métodos da presente invenção são previstos para obter uma quantidade inseticidamente efetiva de um composto de fórmula I a estar presente em insetos a fim de matar ou controlar os insetos. As quantidades inseticidamente efetivas preferidas são as que são suficientes para matar os insetos. Está dentro do escopo da presente invenção levar um composto de fórmula I a estar presente dentro dos insetos por seu contato com um derivado deste composto, cujo derivado é convertido dentro do inseto em um composto de fórmula I. Esta invenção inclui o uso de tais compostos, que podem ser referidos como pro-inseticidas.

Outro aspecto da presente invenção refere-se a composições contendo uma quantidade inseticidamente efetiva de pelo menos um composto de fórmula I com pelo menos um veículo inseticidamente compatível para o mesmo.

Outro aspecto da presente invenção refere-se a composições contendo uma quantidade inseticidamente efetiva de pelo menos um composto de fórmula I, e uma quantidade efetiva de pelo menos um composto

adicional, com pelo menos um veículo inseticidamente compatível para o mesmo.

Outro aspecto da presente invenção refere-se a métodos de controlar insetos por aplicação de uma quantidade inseticidamente efetiva de uma composição especificada acima a um local de culturas como, sem limitação, cereais, algodão, vegetais e frutas ou outras áreas onde os insetos estão presentes ou são esperados estarem presentes.

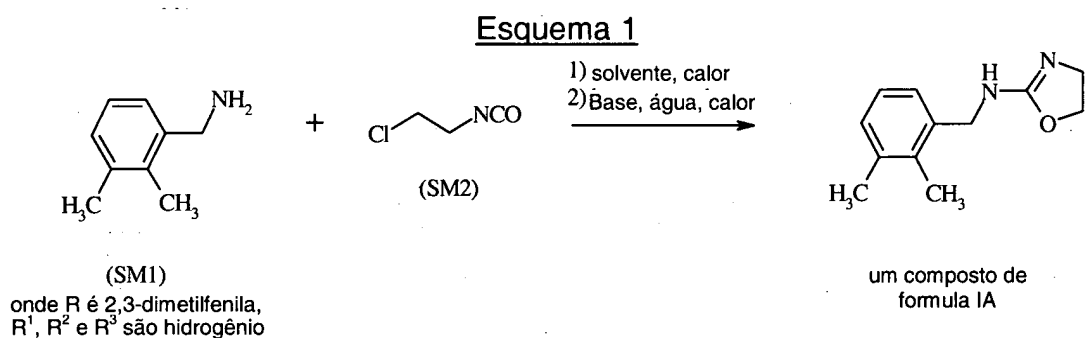
A presente invenção também inclui o uso dos compostos e composições especificados aqui para controle de espécies de insetos não agrícolas, por exemplo, térmitas de madeira seca, térmitas subterrâneas; assim como para uso como agentes farmacêuticos e suas composições. No campo de medicina veterinária, os compostos da presente invenção são esperados como sendo efetivos contra alguns *endo*- e *ecto*-parasitas, como insetos e lagartas, que parasitam e atacam os animais. Exemplos destes parasites de animais incluem, sem limitação, *Gastrophilus* spp., *Stomoxys* spp., *Trichodectes* spp., *Rhodnius* spp., *Ctenocephalides canis*, e outras espécies.

Como usado no relatório e salvo especificado em contrário, os termos de substituintes “alquila” e “alcóxi”, usados sozinhos ou como parte de uma porção maior, inclui cadeias retas ou ramificadas de menos um ou dois átomos de carbono, como apropriado para o substituinte, e preferivelmente até 12 átomos de carbono, mais preferivelmente até dez átomos de carbono, o mais preferivelmente até sete átomos de carbono. O termo “alquenila” e “alquinila” usado sozinho ou como parte de uma porção maior, inclui cadeias retas ou ramificadas de pelo menos dois átomos de carbono contendo pelo menos uma ligação dupla ou tripla carbono-carbono, e preferivelmente até 12 átomos de carbono, mais preferivelmente até dez átomos de carbono, o mais preferivelmente até sete átomos de carbono. O termo “heterocíclico” refere-se a uma estrutura de anel não aromático de quatro a oito átomos consistindo de carbono e nitrogênio, e podem incluir oxigênio ou enxofre. Anéis de cinco membros incluem, sem limitação, por exemplo, oxazolidina e tiazolina. Os anéis de seis membros incluem, sem limitação, por exemplo, piperazina, piperidina, morfolina e tiomorfolina. O termo “arila” refe-

re-se a uma estrutura de anel aromático, incluindo anéis fundidos tendo quatro a dez átomos de carbono, por exemplo, fenila ou naftila e 5,6,7,8-tetrahidronaftila. O termo "heteroarila" refere-se a uma estrutura de anel aromático, incluindo anéis fundidos, em que pelo menos um dentre os átomos é diferente de carbono, por exemplo, sem limitação, enxofre, oxigênio, ou nitrogênio. O termo "salmoura" refere-se a uma solução de cloreto de sódio aquosa saturada. O termo "TEA" refere-se a trietilamina. O termo "THF" refere-se a tetrahidrofurano. O termo "halogênio" ou "halo" refere-se a flúor, bromo, iodo ou cloro. O termo "temperatura ambiente", por exemplo, com referência a uma temperatura de mistura de reação química, refere-se a uma temperatura na faixa de 20 °C a 30 °C. O termo "inseticida" ou "acaricida", "inseticida" ou "acaricida" refere-se a um composto da presente invenção, ou sozinho ou em mistura com pelo menos um dentre um Segundo composto ou com pelo menos um veículo compatível que causa a destruição ou a inibição de ação de insetos ou ácaros.

Os compostos da presente invenção foram preparados por métodos geralmente bem conhecidos dos versados na técnica. Vários compostos da presente invenção foram preparados no modo mostrado no Esquema 1.

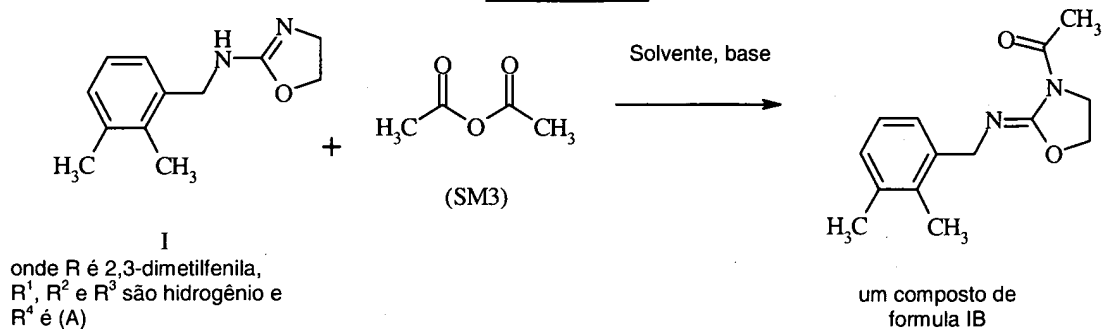
20



25

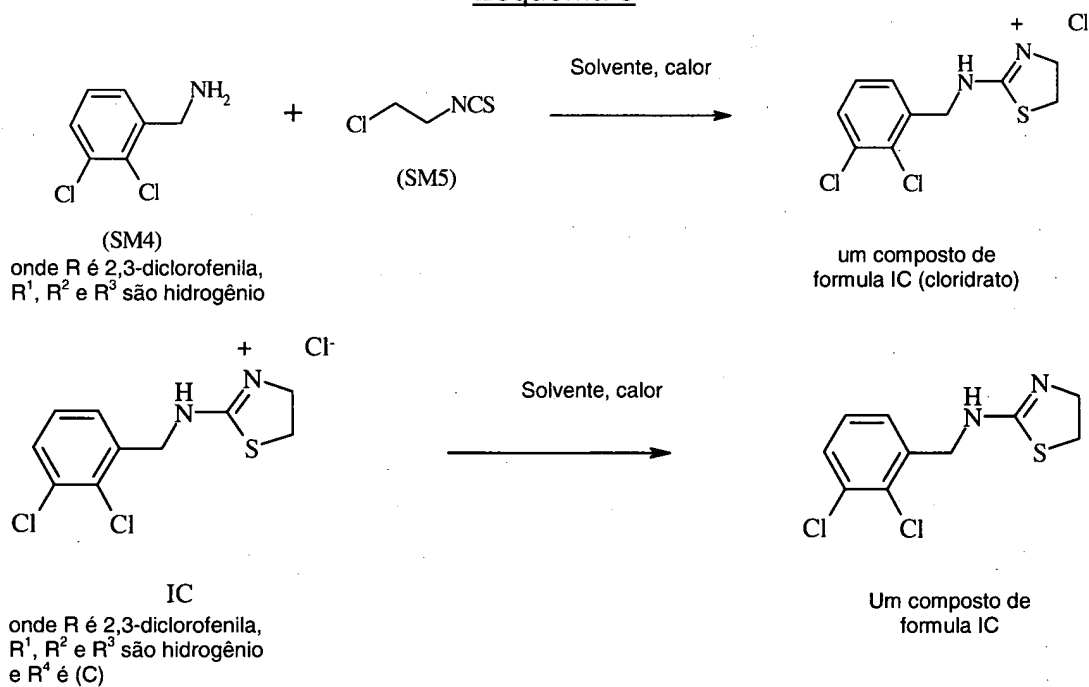
Como mostrado no Esquema 1, a reação de uma benzilamina apropriadamente substituída (SM1) e isocianato de 2-cloroetila (SM2) deram a benzila 1,3-oxazolinila amina apropriadamente substituída, por exemplo, ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-oxazolin-2-ilamina, um composto de fórmula IA descrito em detalhes em Exemplo 1 especificado abaixo.

Esquema 2 provê um método geral para a preparação de compostos de fórmula I em que o substituinte R⁵ é diferente de hidrogênio.

Esquema 2

Como mostrado no Esquema 2, a reação de uma benzila 1,3-oxazolinila amina apropriadamente substituída (um composto de fórmula IA) com anidrido acético (SM3) sob condições básicas, em um solvente apropriado deram as correspondentes 3-acetil-2-metilamino substituído -1,3-oxazolidina, por exemplo, 3-acetil-(1-aza-2-(2,3-dimetilfenil)etilideno)-1,3-oxazolidina, um composto de fórmula IB descrito em detalhes em Exemplo 2 especificado abaixo.

Esquema 3 provê método para a preparação de compostos de fórmula 1C.

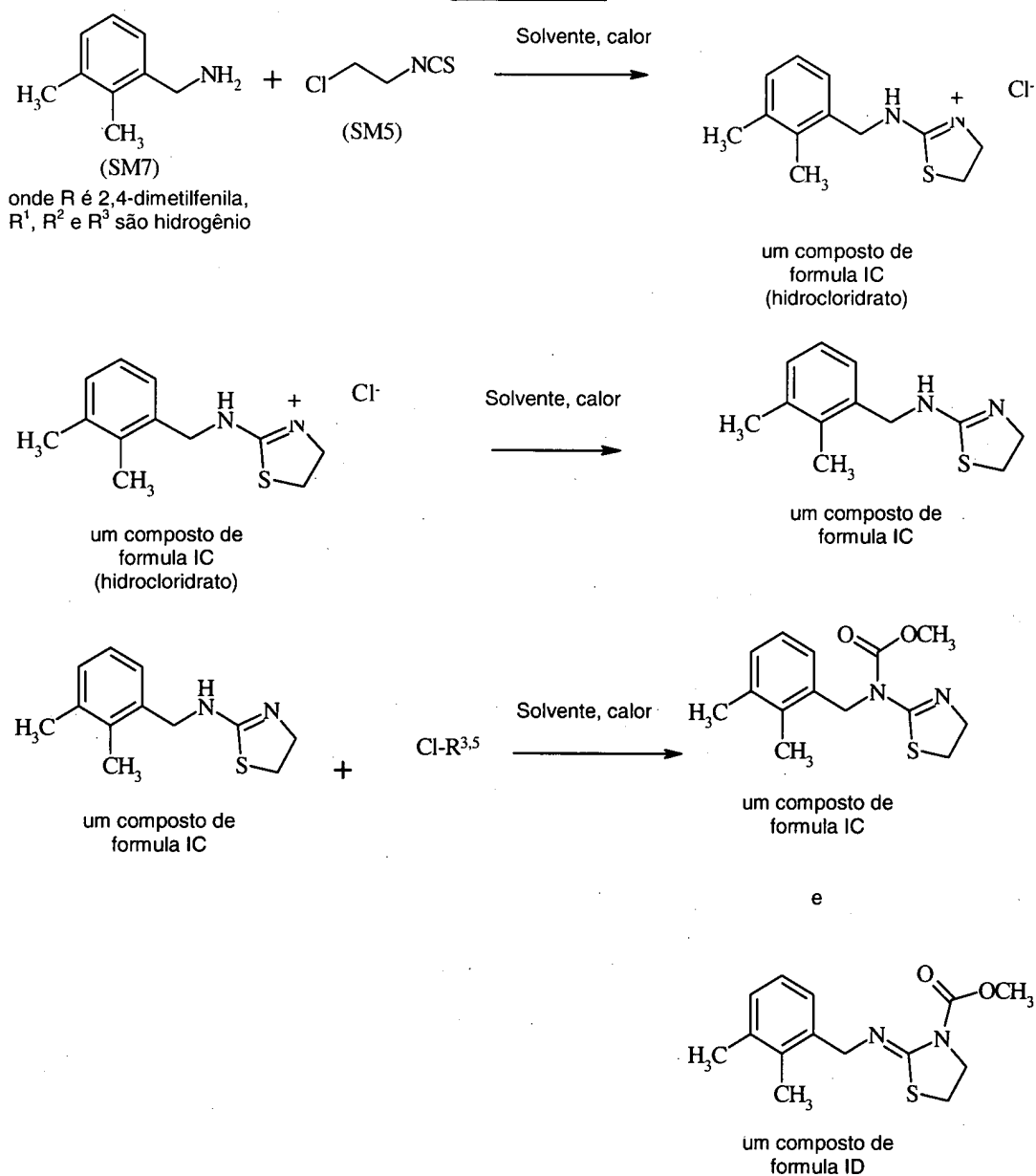
Esquema 3

Como mostrado no Esquema 3, a reação de uma benzilamina substituída (SM4) e isotiocianato de 2-cloroetila (SM5) deram o cloridrato de benzila 1,3-tiazolinila amina apropriadamente substituído, por exemplo, clori-

drato de ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina, um composto de fórmula IC descrito em detalhes em Exemplo 3, Etapa A especificado abaixo. O tratamento do cloridrato de um composto de fórmula IC com uma base em um solvente apropriado produzir a correspondente benzila 1,3-tiazolinila amina substituída, por exemplo ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina, um composto de fórmula IC descrito em detalhes em Exemplo 3, Etapa B especificado abaixo.

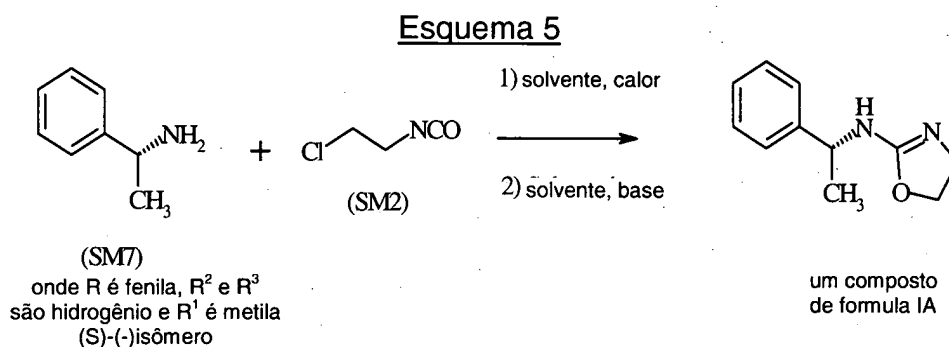
Esquema 4 provê método para a preparação de compostos de fórmula 1C e fórmula ID.

10

Esquema 4

Como mostrado Esquema 4, a reação de uma benzilamina dis-
 substituída, por exemplo, 2,3-dimetilbenzilamina, e isotiocianato de 2-
 cloroetila (SM5) deram o cloridrato de benzila 1,3-tiazolinila amina apropria-
 damente substituído, por exemplo, cloridrato de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-
 5 tiazolin-2-ilamina, um composto de fórmula IC descrito em detalhes em E-
 xemplo 4, Etapa A especificado abaixo. Tratamento do cloridrato de um
 composto de fórmula IC com uma base em um solvente apropriado produziu
 a benzila 1,3-tiazolinila amina substituída correspondente, por exemplo ((2,3-
 dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina, um composto de fórmula IC descrito
 10 em detalhes em Exemplo 4, Etapa B especificado abaixo. A reação da benzil
 1,3-tiazolinila amina substituída com, por exemplo, cloroformato de metila,
 sob condições básicas deram dois compostos. O primeiro, um composto de
 fórmula IC onde o substituinte R^3 é diferente de hidrogênio, por exemplo, 2-
 (1-aza-2-(2,3-dimetilfenil)etilideno)-1,3-tiazolidina-3-carboxilato de metila, e o
 15 segundo, um composto de fórmula ID onde o substituinte R^5 é diferente de
 hidrogênio, por exemplo, N-((2,3-dimetilfenil)metil)metóxi-N-(1,3-tiazolin-2-
 il)carboxamida, ambos descritos em detalhes em Exemplo 4, Etapa C espe-
 cificado abaixo.

Esquema 5 provê um método geral para a preparação de com-
 20 postos de fórmula I onde o substituinte R^1 é diferente de hidrogênio.



Como mostrado no Esquema 5, a reação de um isômero apro-
 priadamente substituído de uma feniletilamina (SM7), por exemplo, (S)-(-)-
 feniletilamina, e isocianato de 2-cloroetila (SM2) deram a feniletila 1,3-
 25 oxazolinila amina apropriadamente substituída, por exemplo, ((1S)-1-
 feniletil)-1,3-oxazolin-2-ilamina, um composto de fórmula IA descrito em de-

talhes em Exemplo 5 especificado abaixo.

Um versado na técnica, como evidente, reconhece que a formulação e modo de aplicação de um agente tóxico pode afetar a atividade do material em uma dada aplicação. Assim, para uso agrícola, os presentes inseticidas compostos podem ser formulados como grânulos de tamanho de partícula relativamente grande (por exemplo, malha US 8/16 ou 4/8), como grânulos solúveis em água ou dispersíveis em água, como pós pulverulentos, como pós umectáveis, como concentrados emulsificáveis, como emulsões aquosas, como soluções, ou como qualquer um de outros tipos de formulações agriculturalmente utilizáveis, dependendo do modo desejado de aplicação. Deve-se entender que as quantidades especificadas no relatório são destinadas a serem aproximadamente apenas, como se a palavra “cerca de” fosse colocada na frente das quantidades especificadas.

Estas composições inseticidas podem ser aplicadas como pulverizações diluídas em água, ou pós, ou grânulos, às áreas onde a supressão dos insetos é desejada. Estas formulações podem conter tão pouco como 0,1%, 0,2% ou 0,5% a tanto como 95% ou mais em peso do ingrediente ativo.

Os pós são misturas de livre escoamento do ingrediente ativo com sólidos finamente divididos como talco, argilas naturais, kieselguhr, farinhas como farinhas de casca de nozes e semente de algodão e outros sólidos orgânicos e inorgânicos que atuam como dispersantes e veículos para o agente tóxico, estes sólidos finamente divididos tem um tamanho médio de partícula de menos do que cerca de 50 microns. A formulação de pó típica utilizável aqui é uma contendo 1,0 parte ou menos do composto inseticida e 99.0 partes de talco.

Os pós umectáveis, também formulações utilizáveis para inseticidas, estão na forma de partículas finamente divididas que dispersam prontamente em água ou outro dispersante. O pó umectável é por fim aplicado ao local onde o controle de insetos é necessário ou como um pó seco ou como uma emulsão em água ou outro líquido. Os veículos típicos para pós umectáveis incluem terra de Fuller, argilas de caulim, sílicas e outros diluen-

tes inorgânicos altamente absorventes e prontamente úmidos. Os pós umectáveis normalmente são preparados para conter 5-80% de ingrediente ativo, dependendo da absorbância do veículo e geralmente também contém uma quantidade pequena de agente umectante, dispersante ou emulsificante para facilitar a dispersão. Por exemplo, uma formulação de pó umectável utilizável contém 80,0 partes de composto inseticida, 17,9 partes de argila Palmetto, e 1,0 parte de lignossulfonato e sódio e 0,3 parte de poliéster alifático sulfonado como agentes umectantes. O agente umectante adicional e/ou óleo com frequência são adicionados a uma mistura de tanque para facilitar a dispersão sobre a folhagem da planta.

Outras formulações utilizáveis para aplicações inseticidas são concentrados emulsificáveis (ECs) que são composições líquidas homogêneas dispersíveis em água ou outro dispersante e podem consistir completamente nos compostos inseticidas e um agente emulsificante líquido ou sólido, ou pode também conter um veículo líquido, como xileno, naftas aromáticas pesadas, isoforona, ou outros solventes orgânicos não voláteis. Para aplicação inseticida, estes concentrados são dispersos em água ou outro veículo líquido e normalmente aplicados como uma pulverização à área a ser tratada. A porcentagem em peso do ingrediente ativo essencial pode variar de acordo com o modo como as composições devem ser aplicadas, mas geralmente compreende 0,5 a 95% de um ingrediente ativo em peso da composição inseticida.

As formulações escoáveis são similares a ECs, exceto que o ingrediente ativo é colocado em suspensão em um veículo líquido, geralmente água.

Os escoáveis, como ECs, podem incluir uma quantidade pequena de um tensoativo, e irão tipicamente conter ingredientes ativos na faixa de 0,5 a 95%, com frequência de 10 a 50%, em peso da composição. Para aplicação, os escoáveis podem ser diluídos em água ou outro veículo líquido, e são normalmente aplicados como uma pulverização à área a ser tratada.

Os agentes umectantes, dispersantes ou emulsificantes típicos,

usados em formulações agrícolas incluem, mas não são limitados a sulfonatos de alquila e alquilarila e sulfatos e seus sais de sódio; álcoois alquilaril poliéter, álcoois superiores sulfatados, óxidos de polietileno, óleos sulfonados animais e vegetais, óleos de petróleo sulfonados, ésteres de ácido graxo de álcoois poliídritos e os produtos de adição de óxido de etileno destes ésteres, e o produto de adição de mercaptanos de cadeia longa e óxido de etileno. Muitos outros tipos de agentes tensoativos utilizáveis são comercialmente disponíveis. Os agentes tensoativos, quando usados normalmente compreendem 1 a 15 % em peso da composição.

10 Outras formulações utilizáveis incluem suspensões do ingrediente ativo em um solvente relativamente não volátil, como água, óleo de milho, querosene, propileno glicol ou outros solventes apropriados.

Ainda outras formulações utilizáveis para aplicações inseticidas incluem soluções simples do ingrediente ativo em um solvente que é completamente solúvel na concentração desejada, como acetona, naftalenos alquilados, xileno ou outros solventes orgânicos. As formulações granulares, em que o agente tóxico é transportado em partículas relativamente grosseiras, são de utilidade particular para a distribuição aérea ou para penetração na canóia da cultura de cobertura. As pulverizações pressurizadas, tipicamente aerossóis em que o ingrediente ativo é disperso em forma finamente dividida com resultado da vaporização de um veículo solvente dispersante de baixo ponto de ebulição também podem ser usadas. Os grânulos solúveis em água ou dispersíveis em água são de livre escoamento, não pulverulentos, e prontamente solúveis ou dispersíveis em água. Em uso pelo fazendeiro no campo, as formulações granulares, concentrados emulsificáveis, concentrados escoáveis, emulsões aquosas, soluções, etc., podem ser diluídos com água para dar uma concentração de ingrediente ativo na faixa de digamos 0,1% ou 0,2% to 1,5% ou 2%.

30 Os compostos inseticidas e acaricidas ativos desta invenção podem ser formulados e/ou aplicados com pelo menos um composto adicional. Estas combinações podem prover algumas vantagens, como, sem limitação, demonstrar efeitos sinérgicos para um maior controle das pragas de inse-

tos, reduzir as taxas de aplicação do inseticida, assim minimizando qualquer impacto ao meio ambiente e à segurança dos trabalhadores, controlar um espectro mais amplo de pragas de insetos, segurança para as plantas de cultura à fitotoxicidade, e melhorar a tolerância por espécies não de pragas, como os mamíferos e peixes.

Os compostos adicionais incluem, sem limitação, outros pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes, condicionadores do solo, ou outros produtos químicos agrícolas. Ao aplicar um composto ativo desta invenção, seja formulado sozinho ou com outros produtos químicos agrícolas, uma quantidade efetiva e a concentração do composto ativo é, como evidente, empregados, a quantidade pode variar na faixa de, por exemplo cerca de 0,001 a cerca de 3 kg/ha, preferivelmente cerca de 0,03 a cerca de 1 kg/ha. Para uso no campo, onde existem perdas de inseticida, maiores taxas de aplicação (por exemplo, quatro vezes as taxas acima mencionadas) podem ser também empregadas.

Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros pesticidas como herbicidas, os herbicidas incluem, sem limitação, por exemplo: N-(fosfonometil)glicina como glifosato; ácidos ariloxi-
alcanóicos como 2,4-D, MCPA, e MCPP; uréias como isoproturon; imidazolinonas como imazapir, imazetapir, e imazaquin; éteres de difenila como acifluorfen, bifenox, e fomasafen; hidroxibenzonitrilas como ioxinil e bromoxinil; sulfoniluréias como clorimuron, aclorenxofreon, benenxofreon, pirazoenxofreon, tifenenxofreon, e triaenxofreon; ácidos 2-(4-ariloxifenóxi)alcanóico como fenoxaprop, fluazifop, quizalofop, e diclofop; benzotiadiazinonas como bentazona; 2-cloroacetanilídeos como butaclor, metolaclor, acetoclor, e dimetenamida; ácidos arenocarboxílicos como dicamba; ácidos piridiloxiacético como fluroxipir; aril triazolinonas como sulfentrazone e carfentrazone-etila; isoxazolidinonas como clomazona; e outros herbicidas.

Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros pesticidas como outros inseticidas, os outros insetici-

das incluem, por exemplo: inseticidas organofosfato, como clorpirifos, diazinon, dimetoato, malation, paration-metil, e terbufos; inseticidas piretróide, como fenvalerato deltametrina, fenpropatrina, ciflutrina, flucitrinato, *alfa*-cipermetrina, *beta*-cipermetrina, *zeta*-cipermetrina bifentrina, cipermetrina, cihalotrina resolvida, etofenprox, esfenvalerato, tralomehtrin, teflutrina, cicloprotrina, betaciflutrina, e acrinatrina; inseticidas carbamato, como aldecarb, carbarila, carbofuran, e metomila; inseticidas organocloro, como endosulfan, endrin, heptaclor, e lindano; inseticidas benzoiluréia, como diflubenuron, triflumuron, teflubenzuron, clorfluazuron, flucicloخورon, hexaflumuron, flufenoxuron, e lufenuron; e outros inseticidas, como amitraz, clofentezina, fenpiroximato, hexitiazox, espinosad, e imidacloprida.

Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros pesticidas como fungicidas, os fungicidas incluem, por exemplo: fungicidas benzimidazol, como benomila, carbendazim, tiabendazol, e tiophanato-metila; fungicidas 1,2,4-triazol, como epoxiconazol, ciproconazol, flusilazol, flutriafol, propiconazol, tebuconazol, triadimefon, e triadimenol; fungicidas anilida substituída, como metalaxila, oxadixila, procimidona, e vinclozolin; fungicidas organofósforo, como fosetila, iprobenfos, pirazofos, edifenfos, e tolclofos-metila; fungicidas morfolina, como fenpropimorf, tridemorf, e dodemorf; outros fungicidas sistêmicos, como fenarimol, imazalil, procloraz, triciclazol, e triforina; fungicidas ditiocarbamato, como mancozeb, maneb, propineb, zineb, e ziram; fungicidas não sistêmicos, como clorotalonil, diclofluanid, ditianon, e iprodiona captan, dinocap, dodina, fluazinam, gluazatina, PCNB, pencicuron, quintozeno tricilamida, e validamicina; fungicidas inorgânicos, como produtos de cobre e enxofre e outros fungicidas.

Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros pesticidas como nematicidas, os nematicidas incluem, por exemplo: carbofuran, carbosulfan, terbufos, aldecarb, etoprop, fenamfos, oxamila, isazofos, cadusafos, e outros nematicidas.

Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção

são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros materiais como reguladores do crescimento de plantas, os reguladores de crescimento de plantas incluem, por exemplo: hidrazida maleica, cloromequat, etefon, giberelina, mepiquat, tidiazon, inabenfida, trifentenol, paclobutrazol, uniconazol, DCPA, prohexadiona, trinexapac-etila, e reguladores de crescimento de plantas.

Os condicionadores do solo são materiais que, quando adicionados ao solo, promovem uma variedade de benefícios para o crescimento eficaz das plantas. Os condicionadores do solo são usados para reduzir a compactação do solo e prover e aumentar a eficácia da drenagem, melhorar a permeabilidade do solo, promover o teor de nutrientes das plantas no solo, e promover uma melhor incorporação do pesticida e fertilizante. Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros materiais como condicionadores do solo, os condicionadores do solo incluem materiais orgânicos, como húmus, que promove a retenção de nutrientes catiônicos das plantas no solo; misturas de nutrientes catiônicos, como complexos de cálcio, magnésio, potassa, sódio, e hidrogênio; ou composições de microorganismos que promovem condições no solo favoráveis ao crescimento das plantas. Estas composições de microorganismos incluem, por exemplo, *bacillus*, *pseudomonas*, *azotobacter*, *azospirillum*, *rhizobium*, e *cianobacteria* de origem no solo.

Os fertilizantes são suplementos alimentícios das plantas que comumente contém nitrogênio, fósforo e potássio. Quando os compostos inseticidas ativos da presente invenção são usados em combinação com pelo menos um composto adicional, por exemplo, com outros materiais como fertilizantes, os fertilizantes incluem fertilizantes de nitrogênio, como sulfato de amônio, nitrato de amônio, e farinha de ossos; fertilizantes de fosfato, como superfosfato, superfosfato triplo, sulfato de amônio, e sulfato de diamônio; e fertilizantes de potássio, como muriato de potassa, sulfato de potássio, e nitrato de potássio, e outros fertilizantes.

Os seguintes exemplos ainda ilustram a presente invenção, mas

não devem ser considerados como em qualquer modo limitando seu escopo. Os exemplos são organizados para apresentar protocolos para a síntese dos compostos de fórmula I da presente invenção, especificados em uma lista das espécies sintetizadas, e especificando ainda alguns dados biológicos indicando a eficácia de tais compostos.

Os compostos da fórmula I podem ser sintetizados por métodos que são individualmente bem conhecidos dos versados na técnica a partir de compostos intermediários prontamente disponíveis no comércio.

EXEMPLO 1

Este exemplo ilustra um protocolo para a preparação de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-oxazolin-2-ilamina (Composto A25)

Uma mistura de 1,0 grama (0,0074 mol) de 2,3-dimetilbenzilamina e 0,69 grama (0,0081 mol) de 2-cloroetilisocianato em 10 mL de 1,4-dioxano foi aquecida em refluxo onde foi agitada por cerca de 18 horas. A mistura de reação foi deixada resfriar e uma solução aquosa de hidróxido de sódio (4,0 mL de uma solução 3,0 molar) foi adicionada. A mistura de reação foi aquecida em refluxo durante cerca de 18 horas então deixada resfriar em temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para deixar um resíduo de óleo viscoso. O resíduo foi colocado em suspensão em 50 mL de acetato de etila e lavado com 20 mL de água. A fase orgânica foi extraída com 20 mL de ácido clorídrico aquoso 3,0 molar. O extrato aquoso foi tornado básico por adição de hidróxido de sódio aquoso 3,0 molar e a mistura básica foi extraída com 50 mL de acetato de etila. O extrato foi secado com sulfato de sódio, filtrado e o filtrado concentrado sob pressão reduzida para dar 0,81 grama do composto titular como um óleo. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

EXEMPLO 2

Este exemplo ilustra um protocolo para a preparação de 3-acetil-(1-aza-2-(2,3-dimetilfenil)etilideno)-1,3-oxazolidina (Composto B2)

Anidrido acético (1.0 grama, 0,002 mols) foi adicionado a uma

mistura fria, agitada, (5°C) de 0,2 grama (0,002 mols) de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-oxazolin-2-ilamina (Composto A25), 0,1 grama (0,0008 mols) de sulfato de magnésio e 0,4 grama (0,006 mols) de carbonato de potássio em 10 mL de éter dietílico. A mistura de reação foi deixada aquecer em temperatura ambiente onde foi agitada por duas horas. A mistura de reação foi filtrada, o bolo de filtro foi enxaguado com éter dietílico, e os filtrados combinados foram concentrados sob pressão reduzida para deixar um resíduo. O resíduo foi agitado com uma mistura de 1 mL de éter dietílico e 4 mL de hexanos. Um precipitado se formou e foi coletado por filtração, enxaguado com hexanos e secado sob pressão reduzida para dar 0,16 grama do composto titular. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

EXEMPLO 3

Este exemplo ilustra um protocolo para a preparação de cloridrato de ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C7) e ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C9)

Etapa A Síntese de cloridrato de ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C7)

Uma mistura de 0,5 grama (0,0028 mols) de 2,3-diclorobenzilamina e 0,27 grama (0,0081 mols) de 2-cloroetilisotiocianato em 10 mL de 1,4-dioxano foi colocada em um frasco de reação vedado. A mistura de reação foi aquecida a 80°C onde foi agitada por cerca de 18 horas. A mistura de reação foi deixada resfriar e um precipitado sólido que tinha se formado foi coletado por filtração. O sólido foi enxaguado com éter dietílico e foi secado sob pressão reduzida para dar 0,68 grama do composto titular. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

Etapa B Síntese de ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C9)

Uma mistura de 0,36 grama (0,0012 mol) de cloridrato de ((2,3-diclorofenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C7) em um mL de água foi adicionada a uma mistura fria, agitada, (banho de água gelada) de 0,05 grama (0,0013 mol) de hidróxido de sódio em 10 mL de água e 10 mL de

éter dietílico. A mistura de reação foi agitada durante 10 minutos, despejada em um funil separador e foi extraída com duas porções de 50 mL de éter dietílico. Os extratos foram combinados, secados com sulfito de sódio e filtrados. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para dar 0,31 grama do composto titular como um sólido branco. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

EXEMPLO 4

Este exemplo ilustra um protocolo para a preparação de cloridrato de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C11), ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C66), 2-(1-aza-2-(2,3-dimetilfenil)etilideno)-1,3-tiazolidina-3-carboxilato de metila (Composto C53) e N-((2,3-dimetilfenil)metil)metóxi-N-(1,3-tiazolin-2-il)carboxamida (Composto D5)

Etapa A Síntese de cloridrato de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C11)

Sob uma atmosfera de nitrogênio, uma mistura agitada de 5,56 gramas (0,041 mol) de 2,3-dimetilbenzilamina e 5,0 gramas (0,041 mol) de 2-cloroetilisotiocianato em 100 mL de 1,4-dioxano foi aquecida a 80°C onde foi agitada por cerca de 18 horas. A mistura de reação foi deixada resfriar e um precipitado sólido que tinha se formado foi coletado por filtração. O sólido foi enxaguado com éter dietílico e foi secado sob pressão reduzida para dar 8,0 gramas do composto titular. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

Etapa B Síntese de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C66)

Uma mistura de 1,4 gramas (0,034 mol) de hidróxido de sódio em 100 mL de água foi adicionada a uma mistura fria agitada, (banho de água gelada) de 8,0 gramas (0,031 mol) de cloridrato de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina (Composto C11) em 100 mL de éter dietílico. A mistura de reação foi deixada aquecer em temperatura ambiente onde foi agitada por duas horas. A mistura de reação foi despejada em um funil de separação e a fase orgânica foi removida e guardada. A fase aquosa foi ex-

traída com 100 mL de éter dietílico. O extrato orgânico foi combinado com a fase orgânica guardada, secado com sulfito de sódio e filtrado. O filtrado foi concentrada sob pressão reduzida para dar 6,8 gramas do composto titular como um sólido branco, ponto de fusão 110-114 °C. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

Etapa C Síntese de 2-(1-aza-2-(2,3-dimetilfenil)etilideno)-1,3-tiazolidina-3-carboxilato de metila (Composto C53) e N-((2,3-dimetilfenil)metil)metóxi-N-(1,3-tiazolin-2-il)carboxamida (Composto D5)

Sob uma atmosfera de nitrogênio seco, a solução de 0,25 gramas (0,0011 mol) de ((2,3-dimetilfenil)metil)-1,3-tiazolin-2-ilamina dissolvida em 10 mL de THF foi adicionada a uma suspensão agitada de 0,08 grama (0,0012 mols) de hidreto de sódio (60% suspensão em óleo). A mistura foi agitada durante 30 minutos, quando então uma solução de 0,11 mL (0,0014 mol) de cloroformato de metila em 5 mL de THF foi adicionada lentamente. A mistura de reação foi agitada a temperatura ambiente durante cerca de 18 horas. A mistura de reação foi aquecida a 60 °C onde foi agitada por uma hora. A mistura de reação foi diluída com 25 mL de salmoura, então extraída com duas porções de 25 mL de acetato de etila. O extratos foram combinados, lavados com 25 mL de água, secados com sulfato de sódio e filtrados. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para deixar um resíduo sólido. A análise do resíduo por TLC indicou que dois compostos estavam presentes. O resíduo foi purificado por cromatografia de coluna em sílica gel, eluindo com hexanos: cloreto de metileno (1:1). As frações apropriadas foram combinadas e concentradas sob pressão reduzida para dar 0,05 gramas de 2-(1-aza-2-(2,3-dimetilfenil)etilideno)-1,3-tiazolidina-3-carboxilato de metila (Composto C53) e 0,14 grama de N-((2,3-dimetilfenil)metil)metóxi-N-(1,3-tiazolin-2-il)carboxamida (Composto D5). Os espectros de RMN foram consistentes com as estruturas propostas.

EXEMPLO 5

Este exemplo ilustra um protocolo para a preparação de ((1S)-1-feniletil)-1,3-oxazolin-2-ilamina (Composto A58)

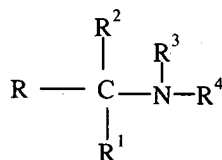
Uma mistura de 0,5 gramas (0,0041 mol) de (S)-(-)-feniletilamina

e 0,44 grama (0,0042 mol) de 2-cloroetilisocianato em 10 mL de 1,4-dioxano foi aquecida em refluxo onde foi agitada por cerca de 18 horas. A mistura de reação foi deixada resfriar e uma solução aquosa de hidróxido de sódio (1,0 mL de uma solução 3.0 molar) foi adicionada. A mistura de reação foi aquecida em refluxo durante três horas então deixada resfriar a temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida para deixar um resíduo de óleo viscoso. O resíduo foi colocado em suspensão em 50 mL de acetato de etila e extraída com 10 mL de ácido clorídrico aquoso 3.0 molar. O extrato aquoso foi tornado básico pela adição de hidróxido de sódio aquoso 3.0 molar. A mistura básica foi extraída com duas porções de acetato de etila de 30 mL. O extratos foram combinados, secados com sulfato de sódio, filtrados e o filtrado concentrado sob pressão reduzida para dar 0,45 gramas do composto titular como um sólido. Os espectros de RMN foram consistentes com a estrutura proposta.

A seguinte tabela especifica alguns exemplos adicionais de compostos de fórmula I utilizáveis na presente invenção:

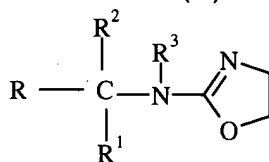
Tabela 1

Derivados inseticidas heterocíclicos de benzilamino substituídos

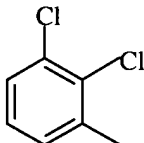


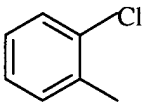
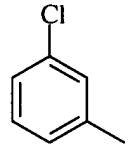
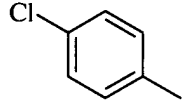
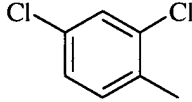
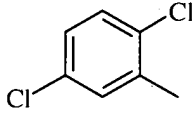
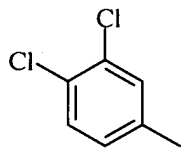
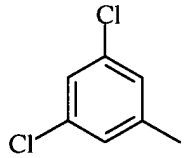
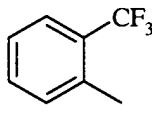
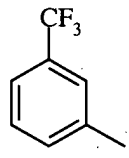
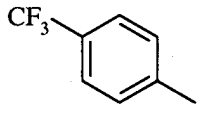
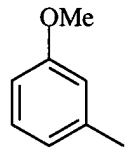
I

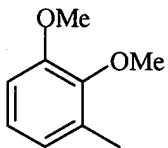
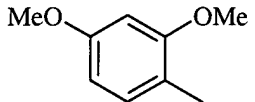
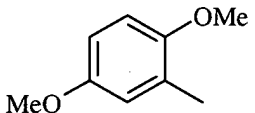
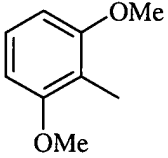
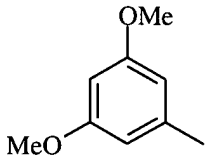
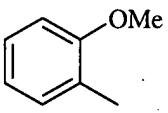
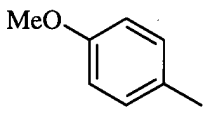
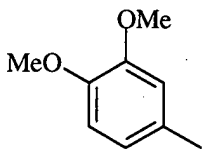
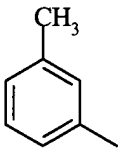
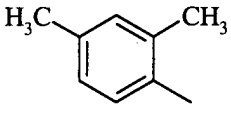
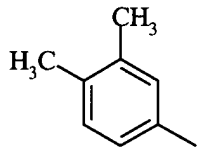
Fórmula I onde R⁴ é fórmula (A):

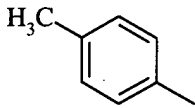
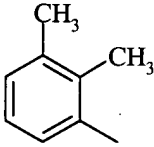
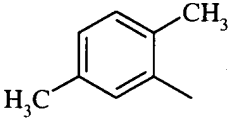
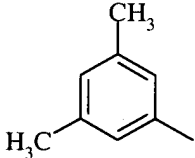
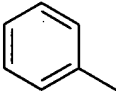
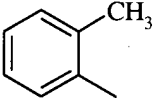
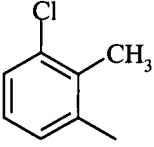
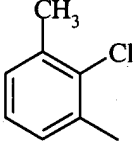
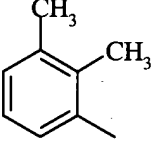
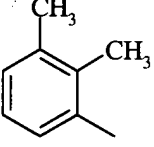


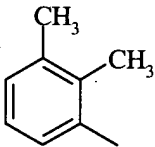
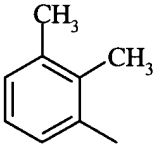
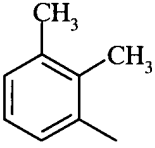
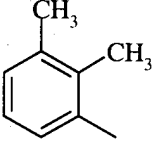
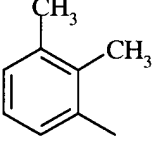
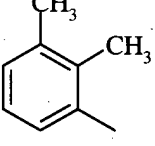
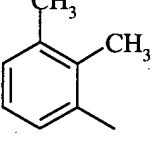
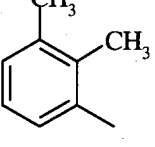
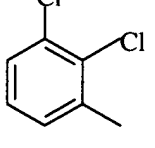
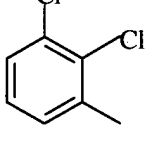
IA

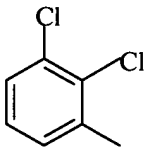
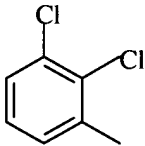
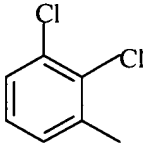
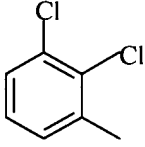
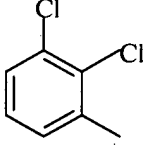
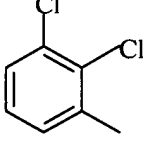
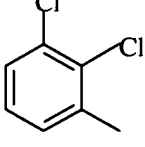
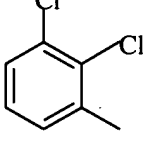
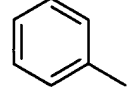
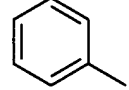
Nº composto	R	R ¹	R ²	R ³
A1		H	H	H

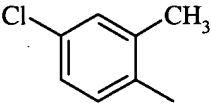
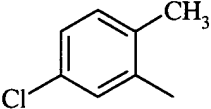
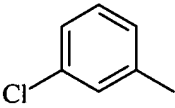
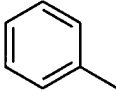
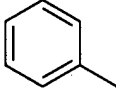
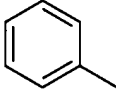
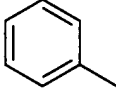
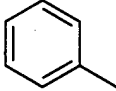
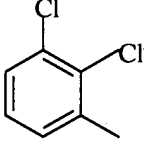
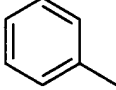
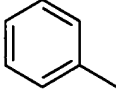
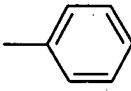
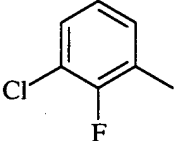
N° composto	R	R ¹	R ²	R ³
A2		H	H	H
A3		H	H	H
A4		H	H	H
A5		H	H	H
A6		H	H	H
A7		H	H	H
A8		H	H	H
A9		H	H	H
A10		H	H	H
A11		H	H	H
A12		H	H	H

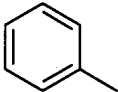
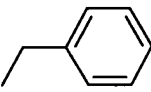
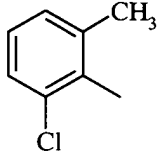
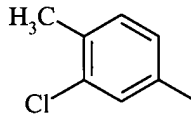
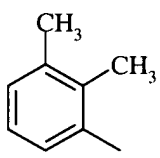
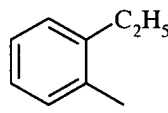
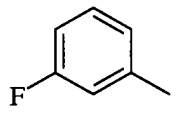
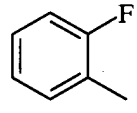
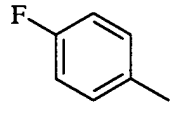
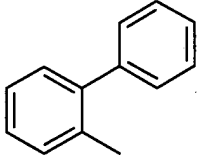
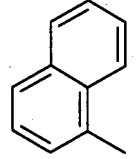
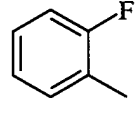
N° composto	R	R ¹	R ²	R ³
A13		H	H	H
A14		H	H	H
A15		H	H	H
A16		H	H	H
A17		H	H	H
A18		H	H	H
A19		H	H	H
A20		H	H	H
A21		H	H	H
A22		H	H	H
A23		H	H	H

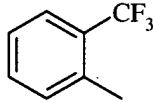
N° composto	R	R ¹	R ²	R ³
A24		H	H	H
A25		H	H	H
A26		H	H	H
A27		H	H	H
A28		H	H	H
A29		H	H	H
A30		H	H	H
A31		H	H	H
A32		H	H	-COCH ₃
A33		H	H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂

N° composto	R	R ¹	R ²	R ³
A34		H	H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
A35		H	H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
A36		H	H	-CO ₂ CH ₃
A37		H	H	-CHO
A38		H	H	-CONHCH ₃
A39		H	H	-CSNHCH ₃
A40		H	H	-CH=NC ₂ H ₅
A41		H	H	-CH=NOC ₂ H ₅
A42		H	H	-COCH ₃
A43		H	H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂

N° composto	R	R ¹	R ²	R ³
A44		H	H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
A45		H	H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
A46		H	H	-CO ₂ CH ₃
A47		H	H	-CHO
A48		H	H	-CONHCH ₃
A49		H	H	-CSNHCH ₃
A50		H	H	-CH=NC ₂ H ₅
A51		H	H	-CH=NOC ₂ H ₅
A52		-CH ₃	H	H
A53		-CH ₃	-CH ₃	H

N° composto	R	R ¹	R ²	R ³
A54		H	H	H
A55		H	H	H
A56		H	H	-CH ₃
A57		H	H	-CH ₃
A58*		-CH ₃	H	H
A59**		-CH ₃	H	-CH ₃
A60*		-CH ₃	H	-CH ₃
A61**		-CH ₃	H	H
A62		-CH ₃	H	H
A63		-C ₂ H ₅	H	H
A64			H	H
A65		H	H	H

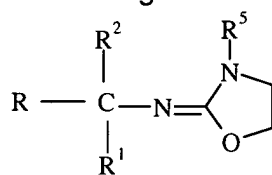
Nº composto	R	R ¹	R ²	R ³
A66			H	H
A67		H	H	H
A68		H	H	H
A69		-CH ₃	H	H
A70		H	H	H
A71		H	H	H
A72		-CH ₃	H	H
A73		-CH ₃	H	H
A74		H	H	H
A75		H	H	H
A76		H	H	H

Nº composto	R	R ¹	R ²	R ³
A77		-CH ₃	H	H

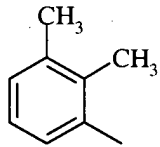
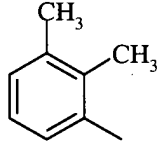
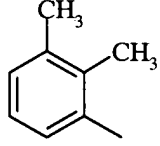
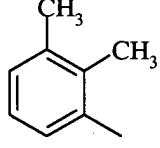
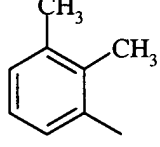
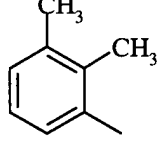
* isômero ((1S)-1-feniletila)

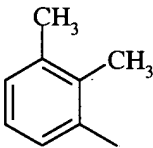
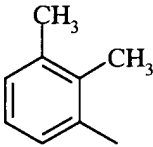
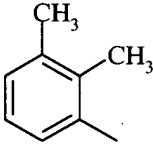
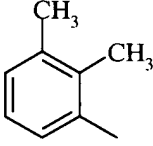
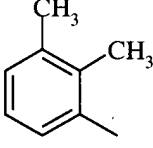
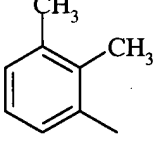
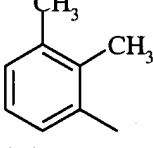
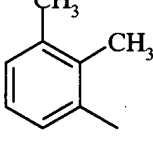
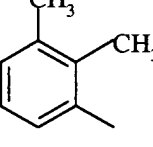
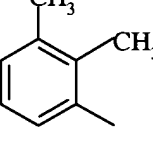
** isômero ((1R)-1-feniletila)

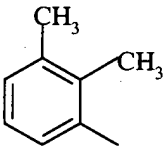
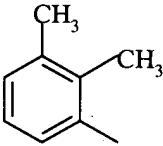
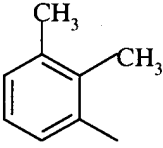
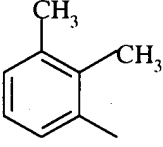
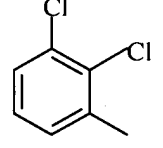
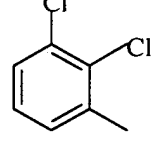
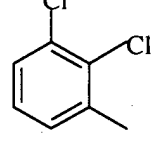
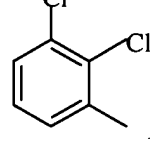
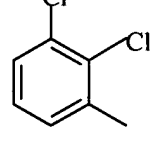
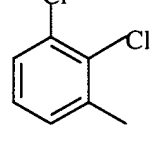
Fórmula I onde R² é hidrogênio e R⁴ é fórmula (B):

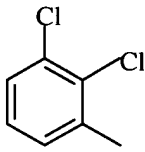
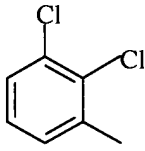
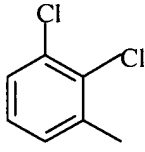
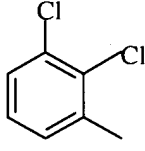
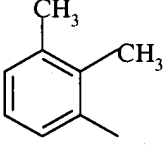
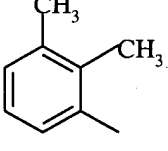
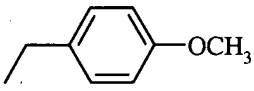
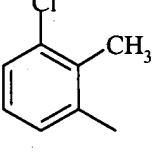
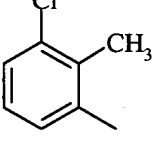
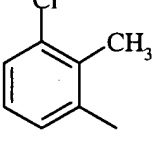
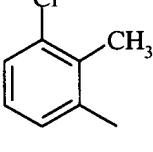


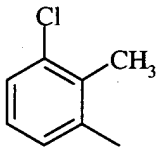
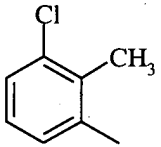
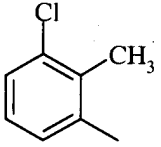
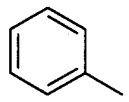
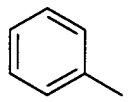
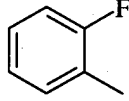
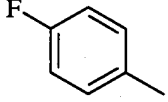
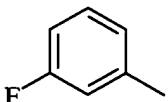
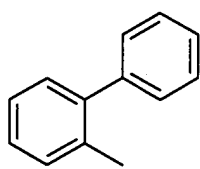
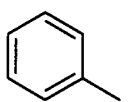
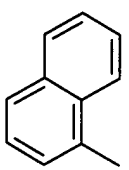
IB

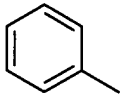
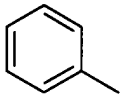
Nº composto	R	R ¹	R ⁵
B1		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B2		H	-COCH ₃
B3		H	-SO ₂ CH ₃
B4		H	-PS(OCH ₃) ₂
B5		H	-CH ₂ OCOC(CH ₃) ₃
BB6		H	-CON(CH ₃) ₂

Nº composto	R	R ¹	R ⁵
B7		H	-COC ₂ H ₅
B8		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
B9		H	-CONH(CH ₃)
B10		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
B11		H	-CO ₂ C ₂ H ₅
B12		H	-CO ₂ CH ₃
B13		H	-PO(OCH ₃) ₂
B14		H	-PO(N(CH ₃) ₂) ₂
B15		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B16		H	-CH ₂ OC ₂ H ₅

Nº composto	R	R ¹	R ⁵
B17		H	-CHO
B18		H	-CSNHCH ₃
B19		H	-CH=NC ₂ H ₅
B20		H	-CH=NOC ₂ H ₅
B21		H	-COCH ₃
B22		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
B23		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
B24		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B25		H	-CO ₂ CH ₃
B26		H	-CHO

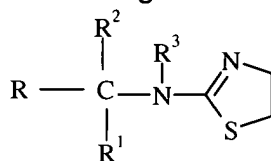
N° composto	R	R ¹	R ⁵
B27		H	-CONHCH ₃
B28		H	-CSNHCH ₃
B29		H	-CH=NC ₂ H ₅
B30		H	-CH=NOC ₂ H ₅
B31		H	-CN
B32		H	
B33		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
B34		H	-PO[N(CH ₃) ₂] ₂
B35		H	-PS(OCH ₃) ₂
B36		H	-CN

Nº composto	R	R ¹	R ⁵
B37		H	-CSNHCH ₃
B38		H	-COCH ₃
B39		H	-COC ₂ H ₅
B40		-C(CH ₃) ₃	-CSNHCH ₃
B41		-CH(CH ₃) ₂	-CSNHCH ₃
B42		-CH ₃	-CSNHCH ₃
B43		-CH ₃	-CSNHCH ₃
B44		-CH ₃	-CSNHCH ₃
B45		H	-CSNHCH ₃
B46*		-CH ₃	-CSNHCH ₃
B47		H	-CSNHCH ₃

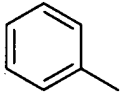
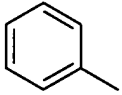
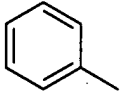
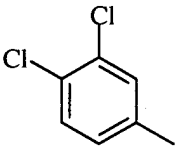
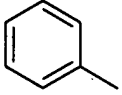
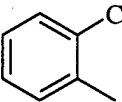
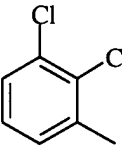
Nº composto	R	R ¹	R ⁵
B48		-CF ₃	-CSNHCH ₃
B49*		-CH ₃	-CSNHC ₂ H ₅

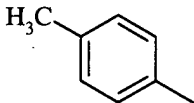
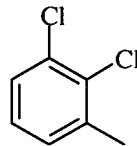
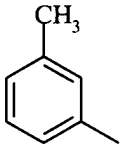
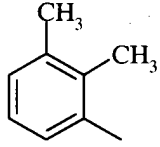
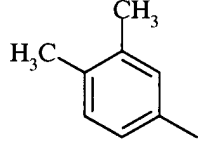
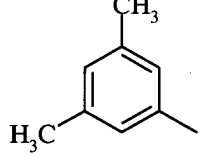
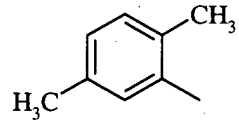
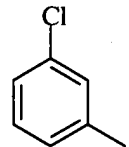
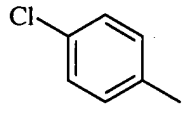
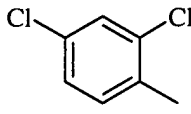
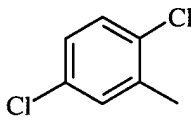
* isômero (2-((2R)-1-aza-2-fenilpropilidina)(1,3-oxazolidin-3-ila)

Fórmula I onde R² é hidrogênio e R⁴ é fórmula (C):

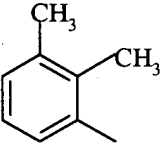
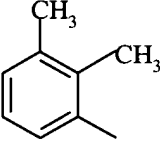
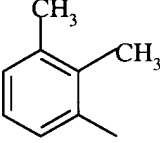
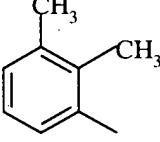
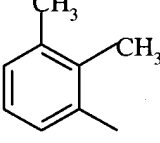
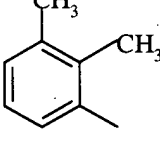
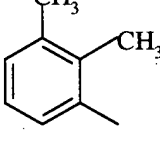
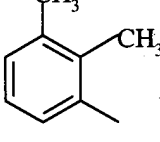
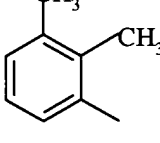
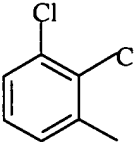


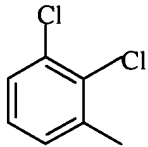
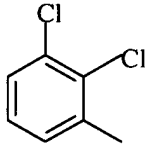
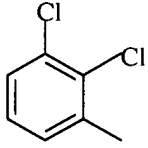
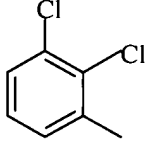
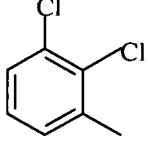
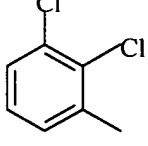
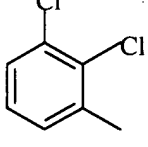
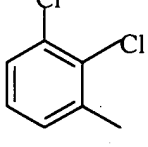
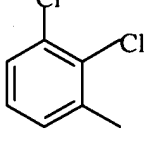
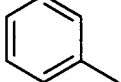
IC

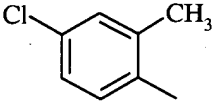
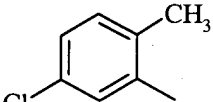
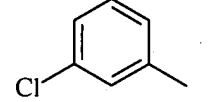
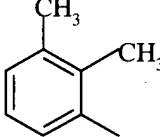
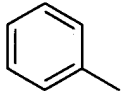
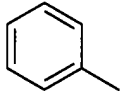
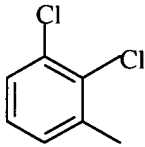
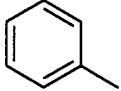
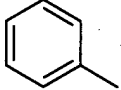
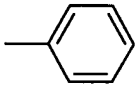
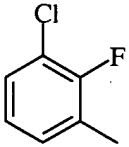
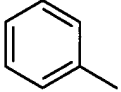
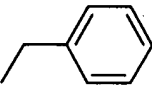
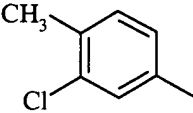
Nº composto	R	R ¹	R ³
C1		H	-CH ₃
C2		H	H
C3 Sal iodidrato		H	H
C4 Sal cloridrato		H	H
C5 Sal cloridrato		H	H
C6 Sal cloridrato		H	H
C7 Sal cloridrato		H	H

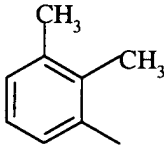
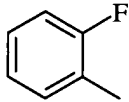
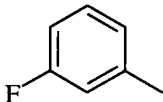
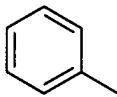
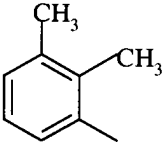
Nº composto	R	R ¹	R ³
C8		H	H
C9		H	H
C10 Sal cloridrato		H	H
C11 Sal cloridrato		H	H
C12 Sal cloridrato		H	H
C13 Sal cloridrato		H	H
C14		H	H
C15 Sal cloridrato		H	H
C16 Sal cloridrato		H	H
C17 Sal cloridrato		H	H
C18 Sal cloridrato		H	H

N° composto	R	R ¹	R ³
C19 Sal cloridrato		H	H
C20 Sal cloridrato		H	H
C21 Sal cloridrato		H	H
C22 Sal cloridrato		H	H
C23 Sal cloridrato		H	H
C24 Sal cloridrato		H	H
C25		H	H
C26		H	H
C27		H	H
C28		H	H
C29		H	-COCH ₃

N° composto	R	R ¹	R ³
C30		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
C31		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
C32		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
C33		H	-CO ₂ CH ₃
C34		H	-CHO
C35		H	-CONHCH ₃
C36		H	-CSNHCH ₃
C37		H	-CH=NC ₂ H ₅
C38		H	-CH=NOC ₂ H ₅
C39		H	-COCH ₃

N° composto	R	R ¹	R ³
C40		H	-SO ₂ N(CH ₃) ₂
C41		H	-PO(OC ₂ H ₅) ₂
C42		H	-PS(OC ₂ H ₅) ₂
C43		H	-CO ₂ CH ₃
C44		H	-CHO
C45		H	-CONHCH ₃
C46		H	-CSNHCH ₃
C47		H	-CH=NC ₂ H ₅
C48		H	-CH=NOC ₂ H ₅
C49		-CH ₃	H

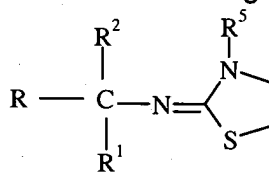
N° composto	R	R ¹	R ³
C50		H	H
C51		H	H
C52		H	-CH ₃
C53		H	-CO ₂ CH ₃
C54*		-CH ₃	H
C55**		-CH ₃	-CH ₃
C56		-CH ₃	H
C57		-C ₂ H ₅	H
C58			H
C59		H	H
C60			H
C61		H	H

Nº composto	R	R ¹	R ³
C62		-CH ₃	H
C63		H	H
C64		H	H
C65		-CH(CH ₃) ₂	H
C66		H	H

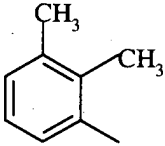
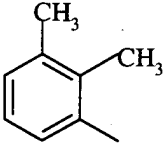
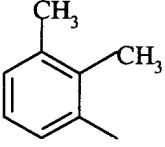
* ((1S)-1-feniletil) isômero

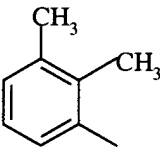
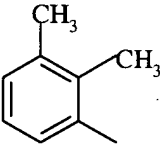
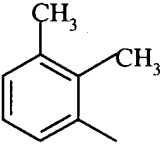
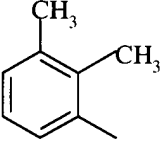
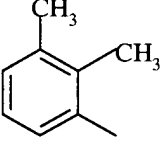
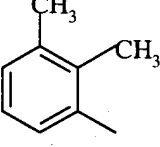
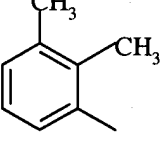
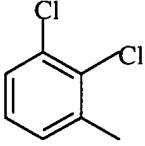
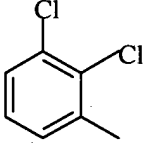
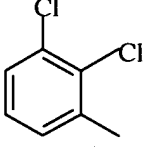
** ((1R)-1-feniletil) isômero

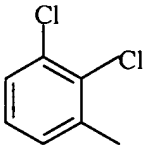
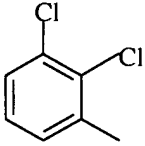
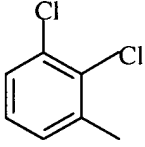
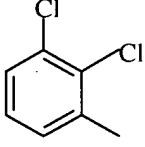
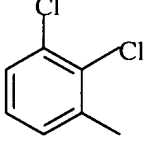
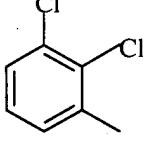
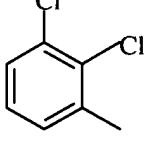
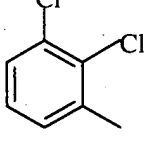
Fórmula I onde R¹ e R² são hidrogênio e R⁴ é fórmula (D):



ID

Nº composto	R	R ⁵
D1		-COCH ₃
D2		-SO ₂ N(CH ₃) ₂
D3		-PO(OC ₂ H ₅) ₂

N° composto	R	R ⁵
D4		-PS(OC ₂ H ₅) ₂
D5		-CO ₂ CH ₃
D6		-CHO
D7		-CONHCH ₃
D8		-CSNHCH ₃
D9		-CH=NC ₂ H ₅
D10		-CH=NOC ₂ H ₅
D11		-COCH ₃
D12		-SO ₂ N(CH ₃) ₂
D13		-PO(OC ₂ H ₅) ₂

Nº composto	R	R ⁵
D14		-PS(OC ₂ H ₅) ₂
D15		-CO ₂ CH ₃
D16		-CHO
D17		-CONHCH ₃
D18		-CSNHCH ₃
D19		-CH=NC ₂ H ₅
D20		-CH=NOC ₂ H ₅
D21		-PS(OCH ₃) ₂

A seguinte tabela especifica dados de caracterização física para alguns compostos de fórmula I da presente invenção:

Tabela 2

Derivados Heterocíclicos de Benzilamino Inseticidas

Caracterização do composto

	Fórmula molecular	Ponto de fusão (°C) de sólidos ou estado físico
A1	$C_{10}H_{10}Cl_2N_2O$	113-115
A2	$C_{10}H_{11}ClN_2O$	ÓLEO
A3	$C_{10}H_{11}ClN_2O$	ÓLEO
A4	$C_{10}H_{11}ClN_2O$	86-88
A5	$C_{10}H_{10}Cl_2N_2O$	ÓLEO
A6	$C_{10}H_{10}Cl_2N_2O$	121-124
A7	$C_{10}H_{10}Cl_2N_2O$	ÓLEO
A8	$C_{10}H_{10}Cl_2N_2O$	102-105
A9	$C_{11}H_{11}F_3N_2O$	78-79
A10	$C_{11}H_{11}F_3N_2O$	ÓLEO
A11	$C_{11}H_{11}F_3N_2O$	114-115
A12	$C_{11}H_{14}N_2O_2$	ÓLEO
A13	$C_{12}H_{16}N_2O_3$	ÓLEO
A14	$C_{12}H_{16}N_2O_3$	ÓLEO
A15	$C_{12}H_{16}N_2O_3$	SÓLIDO
A16	$C_{12}H_{16}N_2O_3$	SÓLIDO
A17	$C_{12}H_{16}N_2O_3$	108-112
A18	$C_{11}H_{14}N_2O_2$	99-102
A19	$C_{11}H_{14}N_2O_2$	75-78
A20	$C_{12}H_{16}N_2O_3$	ÓLEO
A21	$C_{11}H_{14}N_2O$	ÓLEO
A22	$C_{12}H_{16}N_2O$	ÓLEO
A23	$C_{12}H_{16}N_2O$	ÓLEO
A24	$C_{11}H_{14}N_2O$	ÓLEO
A25	$C_{12}H_{16}N_2O$	81-83
A26	$C_{12}H_{16}N_2O$	85-88
A27	$C_{12}H_{16}N_2O$	ÓLEO
A28	$C_{10}H_{12}N_2O$	ÓLEO

Fórmula molecular	Ponto de fusão (°C) de sólidos ou estado físico
A29 $C_{11}H_{14}N_2O$	ÓLEO
A30 $C_{11}H_{13}ClN_2O$	100-102
A52 $C_{11}H_{14}N_2O$	110-112
A53 $C_{12}H_{16}N_2O$	129-133
A54 $C_{11}H_{13}ClN_2O$	104-108
A55 $C_{11}H_{13}ClN_2O$	98-102
A56 $C_{11}H_{13}ClN_2O$	ÓLEO
A57 $C_{11}H_{14}N_2O$	ÓLEO
A58 $C_{11}H_{14}N_2O$	SÓLIDO
A59 $C_{12}H_{16}N_2O$	ÓLEO
A60 $C_{12}H_{16}N_2O$	ÓLEO
A61 $C_{11}H_{14}N_2O$	81-83
A62 $C_{11}H_{12}Cl_2N_2O$	100-105
A63 $C_{12}H_{16}N_2O$	116-119
A64 $C_{16}H_{16}N_2O$	151-153
A65 $C_{10}H_{10}ClFN_2O$	42-45
A66 $C_{17}H_{18}N_2O$	129-131
A67 $C_{11}H_{13}ClN_2O$	130-131
A68 $C_{11}H_{13}ClN_2O$	63-65
A69 $C_{13}H_{18}N_2O$	149-151
A70 $C_{12}H_{16}N_2O$	48-50
A71 $C_{10}H_{11}FN_2O$	ÓLEO
A72 $C_{11}H_{13}FN_2O$	132-135
A73 $C_{11}H_{13}FN_2O$	104-106
A74 $C_{16}H_{16}N_2O$	143-148
A75 $C_{14}H_{14}N_2O$	96-100
A76 $C_{10}H_{11}FN_2O$	ÓLEO
A77 $C_{11}H_{11}F_3N_2O$	165-167
A78 $C_{11}H_{14}N_2O_2$	ÓLEO
A79 $C_{12}H_{13}F_3N_2O$	139-142
B1 $C_{16}H_{25}N_2O_3PS$	ÓLEO
B2 $C_{14}H_{18}N_2O_2$	125-126

Fórmula molecular	Ponto de fusão (°C) de sólidos ou estado físico
B3 $C_{13}H_{18}N_2O_3S$	127-128
B4 $C_{14}H_{21}N_2O_3PS$	ÓLEO
B5 $C_{18}H_{26}N_2O_3$	ÓLEO
B6 $C_{15}H_{21}N_3O_2$	ÓLEO
B7 $C_{15}H_{20}N_2O_2$	85-86
B8 $C_{14}H_{21}N_3O_3S$	ÓLEO
B9 $C_{14}H_{19}N_3O_2$	135-136
B10 $C_{16}H_{25}N_2O_4P$	ÓLEO
B11 $C_{15}H_{20}N_2O_3$	109-110
B12 $C_{14}H_{18}N_2O_3$	119-120
B13 $C_{14}H_{21}N_2O_4P$	ÓLEO
B14 $C_{16}H_{27}N_4O_2P$	ÓLEO
B15 $C_{15}H_{22}N_2O_2$	ÓLEO
B17 $C_{14}H_{19}N_3OS$	122-123
B31 $C_{13}H_{15}N_3O$	125-127
B32 $C_{20}H_{24}N_2O_2$	ÓLEO
B33 $C_{15}H_{22}ClN_2O_3PS$	ÓLEO
B34 $C_{15}H_{24}ClN_4O_2P$	ÓLEO
B35 $C_{13}H_{18}ClN_2O_3PS$	94-95
B36 $C_{12}H_{12}ClN_3O$	126-127
B37 $C_{13}H_{16}ClN_3OS$	SÓLIDO
B38 $C_{13}H_{15}ClN_2O_2$	SÓLIDO
B39 $C_{14}H_{17}ClN_2O_2$	SÓLIDO
B40 $C_{16}H_{23}N_3OS$	127-128
B41 $C_{15}H_{21}N_3OS$	127-128
B42 $C_{13}H_{16}FN_3OS$	ÓLEO
B43 $C_{13}H_{16}FN_3OS$	ÓLEO
B44 $C_{13}H_{16}FN_3OS$	ÓLEO
B45 $C_{18}H_{19}N_3OS$	123-128
B46 $C_{13}H_{17}N_3OS$	109-112
B47 $C_{16}H_{17}N_3OS$	136-140
B48 $C_{13}H_{14}F_3N_3OS$	ÓLEO

Fórmula molecular	Ponto de fusão (°C) de sólidos ou estado físico
B49 C ₁₄ H ₁₉ N ₃ OS	ÓLEO
C1 C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S	ÓLEO
C2 C ₁₀ H ₁₂ N ₂ S	82
C3 C ₁₀ H ₁₃ N ₂ S. I	SÓLIDO
C4 C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl	164-166
C5 C ₁₀ H ₁₃ N ₂ S. Cl	100-102
C6 C ₁₀ H ₁₂ CIN ₂ S. Cl	187-188
C7 C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl	218-220
C8 C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S	94-96
C9 C ₁₀ H ₁₀ Cl ₂ N ₂ S	119-121
C10 C ₁₁ H ₁₅ N ₂ S. Cl	148-150
C11 C ₁₂ H ₁₇ N ₂ S. Cl	180-182
C12 C ₁₂ H ₁₇ N ₂ S. Cl	146-148
C13 C ₁₂ H ₁₇ N ₂ S. Cl	170-173
C14 C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S	154-155
C15 C ₁₀ H ₁₂ CIN ₂ S. Cl	148-150
C16 C ₁₀ H ₁₂ CIN ₂ S. Cl	145-147
C17 C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl	163-165
C18 C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl	212-213
C19 C ₁₀ H ₁₁ Cl ₂ N ₂ S. Cl	202-204
C20 C ₁₁ H ₁₂ F ₃ N ₂ S. Cl	192-194
C21 C ₁₁ H ₁₂ F ₃ N ₂ S. Cl	147-148
C22 C ₁₁ H ₁₂ F ₃ N ₂ S. Cl	129-131
C23 C ₁₁ H ₁₅ N ₂ OS. Cl	118-120
C24 C ₁₁ H ₁₅ N ₂ OS. Cl	128-130
C25 C ₁₂ H ₁₆ N ₂ O ₂ S	82-85
C26 C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ S	SÓLIDO
C27 C ₁₁ H ₁₃ CIN ₂ S	124-125
C49 C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S	110-113
C50 C ₁₁ H ₁₃ CIN ₂ S	118-120
C51 C ₁₁ H ₁₃ CIN ₂ S	134-135
C52 C ₁₁ H ₁₃ CIN ₂ S	ÓLEO

Fórmula molecular	Ponto de fusão (°C) de sólidos ou estado físico
C53 C ₁₄ H ₁₈ N ₂ O ₂ S	LÍQUIDO
C54 C ₁₁ H ₁₄ N ₂ S	84-86
C55 C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S	ÓLEO
C56 C ₁₁ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ S	114-116
C57 C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S	105-106
C58 C ₁₆ H ₁₆ N ₂ S	124-126
C59 C ₁₀ H ₁₀ ClFN ₂ S	92-94
C60 C ₁₇ H ₁₈ N ₂ S	122-123
C61 C ₁₁ H ₁₃ ClN ₂ S	90-95
C62 C ₁₃ H ₁₈ N ₂ S	120-121
C63 C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ S	106-109
C64 C ₁₀ H ₁₁ FN ₂ S	SÓLIDO
C65 C ₁₃ H ₁₈ N ₂ S	110-114
C66 C ₁₂ H ₁₆ N ₂ S	110-114
D2 C ₁₄ H ₂₁ N ₃ O ₂ S ₂	81-84
D4 C ₁₆ H ₂₅ N ₂ O ₂ PS ₂	LÍQUIDO
D5 C ₁₄ H ₁₈ N ₂ O ₂ S	129-131
D11 C ₁₂ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ OS	137-140
D12 C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ N ₃ O ₂ S ₂	119-120
D14 C ₁₄ H ₁₉ Cl ₂ N ₂ O ₂ PS ₂	LÍQUIDO
D15 C ₁₂ H ₁₂ Cl ₂ N ₂ O ₂ S	105-110
D21 C ₁₂ H ₁₅ Cl ₂ N ₂ O ₂ PS ₂	LÍQUIDO

Os inseticidas candidatos foram avaliados para atividade inseticida por observação da mortalidade em uma população de afídeos do algodão tratados (*Aphis gossipii*) em discos de folha de planta de algodão quando comparados a populações semelhantes de afídeos do algodão não tratados em discos de folha de planta de algodão. Estes testes foram conduzidos do seguinte modo:

Plantas de algodão de três semanas a um mês de idade (*Gossypium hirsutum*) foram preparadas por infestação por corte dos e cotilédones e crescimento de nova folha verdadeira, deixando as das duas folhas verdadeiras mais velhas. A planta de teste foi infestada com afídeos do algodão

por translocação de plantas de algodão cultivadas em uma colônia de afídeos do algodão. As cavidades de bandejas de 128 cavidades, transparentes (CD-International, Pittman, New Jersey) foram cheias com 1 mL de uma solução aquosa quente, a 3% ágar e deixadas resfriar em temperatura ambiente. The folhas de algodão infestadas com afídeos foram removidas das plantas e colocadas com o lado de fundo para cima em uma plataforma de corte. Os discos circulares foram cortados das folhas infestadas e colocados com o lado de fundo voltado para cima sobre o gel ágar resfriado, um disco por cavidade. Cada disco de folha foi visualmente inspecionado para assegurar que um mínimo de 10 afídeos vivos estavam presentes. Uma solução de carga de 50 mM do composto de teste foi preparada por dissolução da quantidade apropriada do composto de teste em DMSO. Uma solução compreendendo 1000 partes por milhão (ppm) de cada composto de teste foi preparada por dissolução de 10 µl da solução de carga em 140 µl de uma solução aquosa 0,003% Kinetic® (um adjuvante penetrante/ espalhador/ umectante não iônico, Helena Chemical Company Collierville, Tennessee). A solução de 1000 ppm de composto de teste foi diluída em série com uma solução consistindo de 66mL de DMSO e 30 µl de Kinetic® em 934 mL de água (solução de diluição) para prover soluções de cada composto de teste para menores taxas de aplicação, por exemplo, 300 ppm, 100 ppm, 30 ppm, ou 10 ppm. Cada disco de planta de teste infestada em réplica foi pulverizado com 10 µl da solução de teste a cerca de 0,56 kg/cm² durante 1 segundo. Para fins de comparação, a solução de um padrão, como bifentrina, preparada em um modo análogo ao especificado acima, assim como uma solução aquosa de 0,003% Kinetic® não contendo composto de teste e a solução de diluição não contendo composto de teste foram também pulverizadas sobre discos de plantas de teste infestadas. Ao completar a pulverização das soluções de composto de teste, a solução de padrão e as soluções não contendo composto de teste, os discos de plantas foram deixados secar. Ao completar a secagem, as bandejas de teste foram cobertas com uma película de plástico. Fendas foram feitas na película sobre cada cavidade para permitir a entrada de ar em cada cavidade. As bandejas de teste foram colocadas em

uma bio-câmara (25°C, 16 horas de luz 8 horas de escuro e 35-40% umidade relativa) durante três dias. Neste momento, cada disco de planta foi avaliado para mortalidade percentual causada pelo composto de teste quando comparado com a população de afídeos que foi infestada sobre os discos de plantas de teste não contendo composto de teste. Um composto de teste foi designado como possuindo atividade inseticida (SA) se se tiver 40% a 75% de mortalidade de afídeos do algodão em discos de plantas pulverizados com este composto. Se se notar 75% mortalidade ou mais dos afídeos do algodão, um composto de teste foi designado como sendo mais inseticamente ativo (A). Se se notar 40% mortalidade ou menos dos afídeos do algodão, o composto de teste foi chamado como inativo (I).

Uma avaliação da atividade inseticida em taxas selecionadas de aplicação a partir deste teste é dada na Tabela 3. Os compostos de teste de fórmula I são identificados por números que correspondem aos da Tabela 1.

15 Tabela 3

Os seguintes compostos da presente invenção Reduziram a população de afídeos de algodão em 40 a 100% quando aplicados a uma taxa de aplicação de 1000ppm ou menos aos discos de folha de algodão infestados

Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.	Nº Comp.
A2	A3	A4	A5	A6	A7	A8	A10	A11	A12
A13	A14	A15	A16	A17	A18	A19	A20	A21	A22
A23	A24	A26	A27	A53	A54	A79	B3	B8	B11
B12	B13	B15	B40	B41	C1	C3	C4	C7	C8
C9	C12	C13	C14	C16	C17	C19	C20	C21	C22
C23	C24	C25	C27	C50	C52	C53	C65	C66	D2
D4	D5	D12	D14	D15					

20 Os inseticidas candidatos foram avaliados para atividade inseticida por observação da mortalidade em uma população de afídeos do algodão (*Aphis gossipii*) em plantas de algodão tratadas quando comparadas a populações semelhantes de afídeos do algodão em plantas não tratadas. Estes testes foram conduzidos do seguinte modo:

Para cada taxa de aplicação de composto de teste, duas mudas de algodão de sete a dez dias de idade (*Gossipium hirsutum*) cultivadas em vasos de 7,6 cm de diâmetro foram selecionadas para teste. Cada planta de teste foi infestada com cerca de 120 afídeos do algodão adultos por colocação de cada corte de plantas de teste das folhas das plantas de algodão cultivadas em uma colônia de afídeos do algodão. Uma vez infestadas, as plantas de teste foram mantidas para cima por cerca de 12 horas para permitir a completa translocação dos afídeos sobre a planta de teste. Uma solução compreendendo 1000 partes por milhão (ppm) de cada composto de teste foi preparada por dissolução de 10 miligramas do composto de teste em 1 mL de acetona. Cada solução foi então diluída com 9 mL de uma solução de 0,03 mL de éter de polioxietileno (10) isooctilfenila em 100 mL de água. Cerca de 2,5 mL de solução de cada composto de teste foram necessários para a pulverização de cada réplica de planta de teste (5 mL no total para cada composto de teste). Se necessário, a solução de 1000 ppm de composto de teste foi serialmente diluída com uma solução de 10% acetona e 300 ppm de éter de polioxietileno (10) isooctilfenila em água para dar soluções de cada composto de teste para taxas de aplicação menores, por exemplo, 300 ppm, 100 ppm, 30 ppm, ou 10 ppm. Cada réplica de planta de teste foi pulverizada com as soluções de composto de teste até escorrer sobre as superfícies superior e inferior das folhas. Todas as plantas de teste foram pulverizadas usando um atomizador DeVilbus Modelo 152 (Sunrise Medical, Carlsbad, CA) a uma pressão de cerca de 0,63-0,74 quilograma por centímetro quadrado de uma distância de cerca de 30,5 centímetros das plantas de teste. Para fins de comparação, uma solução de 10% acetona e 300 ppm de éter de polioxietileno (10) isooctilfenila em água não contendo composto de teste foram também pulverizados sobre as plantas de teste de controle. Ao completar a pulverização das soluções de composto de teste e da solução não contendo composto de teste, as plantas foram deixadas secar. Ao completar a secagem, as plantas de teste e de controle foram colocadas em uma bandeja contendo cerca de 2,5 centímetros de água, onde elas foram mantidas em uma câmara de crescimento durante 72 horas. Após este tempo, cada

planta foi avaliada para mortalidade percentual causada pelo composto de teste quando comparado com a população de afídeos que foi infestada sobre as plantas de teste antes do tratamento com composto de teste. Um composto de teste foi designado como possuindo atividade inseticida (SA) se se notar 40% a 75% mortalidade de afídeos do algodão sobre as plantas pulverizadas com este composto. Se se notar 75% de mortalidade ou maior dos afídeos do algodão, um composto de teste foi designado como sendo mais inseticidamente ativo (A). Se se notar 40% de mortalidade ou menos dos afídeos do algodão, o composto de teste foi denominado como inativo (I).

Uma avaliação da atividade inseticida em taxas selecionadas de aplicação deste teste é dada na Tabela 3A. Os compostos de teste de fórmula I são identificados por números que correspondem aos da Tabela 1.

Tabela 3A

Os seguintes compostos da presente invenção reduziram a população de afídeos de algodão (*Aphis gossypii*) entre 40% e 100% quando aplicados a uma taxa de aplicação de 1000 ppm ou menos em plantas de algodão infestadas

Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.	Nº Com p.
A1	A9	A25	A28	A29	A30	A52	A55	A56	A57
A58	A59	A60	A61	A62	A63	A64	A65	A66	A67
A68	A69	A70	A71	A72	A73	A74	A75	A76	A77
A78	B1	B2	B4	B5	B6	B7	B9	B10	B14
B17	B31	B32	B33	B34	B35	B36	B37	B38	B39
B42	B43	B44	B45	B46	B47	B48	B49	C2	C5
C6	C10	C11	C15	C18	C26	C49	C51	C54	C55
C56	C57	C58	C59	C60	C61	C62	C63	C64	D11
D21									

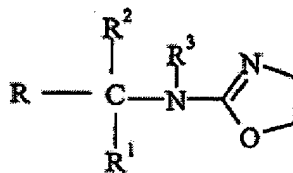
Como especificado em Tabelas 3 e 3A, os compostos testados da presente invenção reduziram a população de afídeos por pelo menos 40% em uma taxa de aplicação de 1000ppm ou menos.

Apesar desta invenção ter sido descrita com uma ênfase sobre as formas de realização preferidas, será entendido pelos versados na técnica que variações das formas de realização preferidas podem ser usadas e que se pretende que a invenção possa ser praticada de outro modo do que especificamente descrito aqui. Assim, esta invenção inclui todas as modificações englobadas dentro do espírito e escopo da invenção como definido pelas seguintes reivindicações.

5

REIVINDICAÇÕES

1. Composição inseticida compreendendo um composto de fórmula IA:



IA

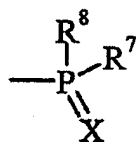
em que

5 R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila, (C₁-C₂) alcóxi, (C₁-C₂) haloalquila e fenila;

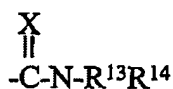
R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila, (C₁-C₂) hidroalquila e (C₁-C₂) haloalquila;

10 R² é selecionado dentre hidrogênio e (C₁-C₂) alquila; e

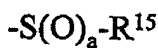
R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,



(1),



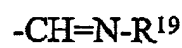
(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

15 R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

20 R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos;

desde que

quando R é 1-naftila e R³ é hidrogênio, então R¹ e R² são diferentes de (C₁-

C₂) alquila.

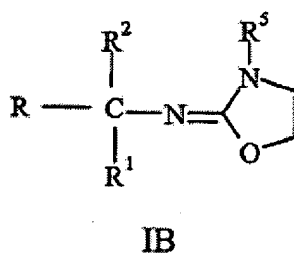
2. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 1, compreendida por compostos de fórmula IA onde

R é 2,3-diclorofenila ou 2,3-dimetilfenila;

5 R¹ é hidrogênio ou metila; e

R² e R³ são hidrogênio.

3. Composição inseticida compreendendo um composto de fórmula IB :

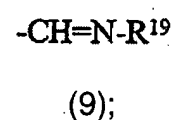
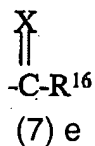
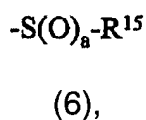
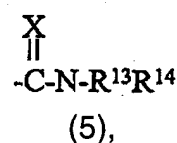
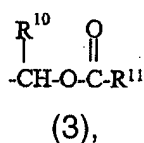
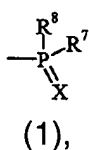


em que

10 R é 1-naftila, fenila ou fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₄) alquila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila e (C₁-C₂) haloalquila; R² é hidrogênio;

15 R⁵ é selecionado dentre ciano, (C₁-C₂) alcóxi(C₁-C₂) alquila, 4-(C₁-C₂) alcoxibenzila,



onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi ou (C₁-C₂) haloalquila;

R¹⁰ é hidrogênio;

20 R¹¹ é (C₁-C₄) alquila;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R^{14} é hidrogênio ou (C_1-C_2) alquila;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

5 R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

sais agriculturalmente dos mesmos,

desde que

quando R é 1-naftila e R^5 é fórmula (5) onde X é enxofre, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio, então R^1 é diferente de (C_1-C_2) alquila; e

10 quando R é 3-cloro-2-metilfenila e R^1 é hidrogênio, então R^5 é diferente de fórmula (5) onde X é oxigênio, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio ou de fórmula (6) onde a é 2 e R^{15} é metila.

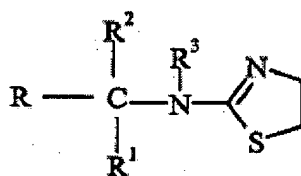
4. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 3, compreendida por compostos de fórmula IB onde

15 R é 2,3-diclorofenila, 2,3-dimetilfenila ou 3-cloro-2-metilfenila;

R^1 é hidrogênio; e

R^5 é ciano, fórmula (1), fórmula (5) ou fórmula (7).

5. Composição inseticida compreendendo um composto de fórmula IC:



IC

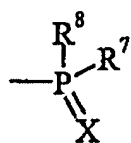
20 onde

R é selecionado dentre 1-naftila, 2- (C_1-C_2) alcoxifenila, 3- (C_1-C_2) alcoxifenila, 4- (C_1-C_2) alcoxifenila, 2,4- (C_1-C_2) dialcoxifenila, fenila ou fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados entre halogênio, (C_1-C_2) alquila e (C_1-C_2) haloalquila;

25 R^1 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_3) alquila, fenila ou benzila;

R^2 é hidrogênio; e

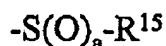
R^3 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_2) alquila,



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

5 R¹⁴ é hidrogênio;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

10 sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos;

desde que

quando R¹ e R³ são hidrogênio, então R é diferente de 2-metilfenila, 2,4-dimetilfenila ou 2-cloro-6-metilfenila;

15 quando R é fenila, R¹ e R³ são metila, então o composto é diferente de isômero ((1S)-1-feniletil)metil-1,3-tiazolin-2-ilamina;

quando R é fenila, R¹ é metila e R³ é hidrogênio, então o composto é diferente de isômero ((1R)-1-feniletila)-1,3-tiazolin-2-ilamina; e

quando R é 2,3-diclorofenila e R¹ é hidrogênio, então R³ é diferente de fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é metóxi.

20 6. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 5, compreendida por compostos de fórmula IC onde

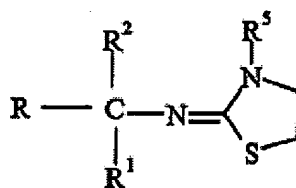
R é 2,3-diclorofenila ou 2,3-dimetilfenila;

R¹ é hidrogênio ou metila; e

R³ é hidrogênio ou fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é (C₁-C₂)

25 alcóxi.

7. Composição inseticida compreendendo um composto de fórmula ID:



ID

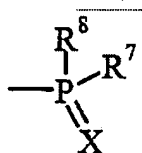
onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

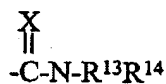
R¹ e R² são hidrogênio; e

R⁵ é selecionado dentre

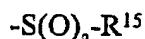
5



(1),



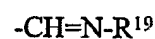
(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

10

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

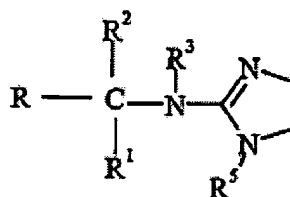
15 sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos.

8. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 5, compreendida pelos compostos de fórmula ID onde

R é 2,3-diclorofenila, 2,3-dimetilfenila;

20 R é fórmula (1) onde X é enxofre ou fórmula (7) onde X é oxigênio e R¹⁶ é (C₁-C₂) alcóxi.

9. Composição inseticida compreendendo um composto de fórmula IE:



IE

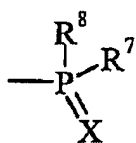
onde

R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila e (C₁-C₂) haloalquila;

5 R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₃) alquila, fenila ou benzila;

R² é hidrogênio; e

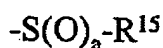
R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

10 X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

a é 2;

15 R¹⁵ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) dialquilamino;

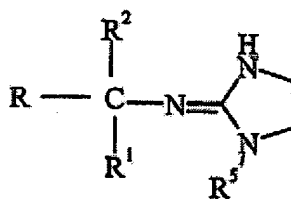
R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos.

10. Composição inseticida compreendendo um composto de

20 fórmula IF:



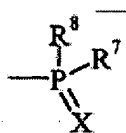
IF

onde

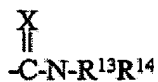
R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

R¹ e R² são hidrogênio; e

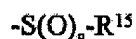
5 R⁵ é selecionado dentre ciano,



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

10 R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

15 sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos.

11. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 1, ainda compreendendo um ou mais compostos adicionais selecionados dentre o grupo consistindo de pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes e condicionadores do solo.

20 12. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 3, ainda compreendendo um ou mais compostos adicionais selecionados dentre o grupo consistindo de pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes e condicionadores do solo.

13. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 5, ainda compreendendo um ou mais compostos adicionais selecionados dentre o grupo consistindo de pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes e condicionadores do solo.

5 14. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 7, ainda compreendendo um ou mais compostos adicionais selecionados dentre o grupo consistindo de pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes e condicionadores do solo.

10 15. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 9, ainda compreendendo um ou mais compostos adicionais selecionados dentre o grupo consistindo de pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes e condicionadores do solo.

15 16. Composição inseticida de acordo com a reivindicação 10, ainda compreendendo um ou mais compostos adicionais selecionados dentre o grupo consistindo de pesticidas, reguladores do crescimento de plantas, fertilizantes e condicionadores do solo.

17. Método de controlar insetos, compreendendo aplicar uma composição como definida na reivindicação 1, a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.

20 18. Método de controlar insetos, compreendendo aplicar uma composição como definida na reivindicação 3, a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.

25 19. Método de controlar insetos, compreendendo aplicar uma composição como definida na reivindicação 5, a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.

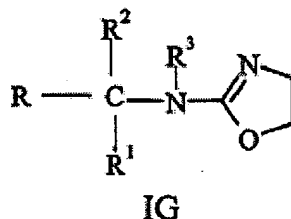
20. Método de controlar insetos, compreendendo aplicar uma composição como definida na reivindicação 7, a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.

30 21. Método de controlar insetos, compreendendo aplicar uma composição como definida na reivindicação 9, a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.

22. Método de controlar insetos, compreendendo aplicar uma

composição como definida na reivindicação 10, a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.

23. Composto de fórmula IG:



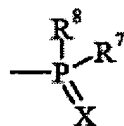
em que

5 R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C₁-C₂) alquila, (C₁-C₂) alcóxi, (C₁-C₂) haloalquila e fenila;

R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila, (C₁-C₂) hidroalquila e (C₁-C₂) haloalquila;

10 R² é selecionado dentre hidrogênio e (C₁-C₂) alquila; e

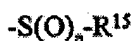
R³ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₂) alquila,



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi;

15 R¹³ é (C₁-C₂) alquila;

R¹⁴ é hidrogênio;

a é 2;

R¹⁵ é (C₁-C₂) dialquilamino;

R¹⁶ é hidrogênio, (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

20 R¹⁹ é (C₁-C₂) alquila ou (C₁-C₂) alcóxi; e

os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos;

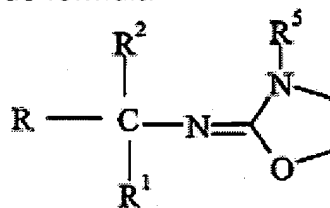
desde que

quando R¹ é metila e R² e R³ são hidrogênio, então R é diferente de fenila;

quando R é 1-naftila e R³ é hidrogênio, então R¹ e R² são diferentes de (C₁-C₂) alquila; e

- quando R¹, R² e R³ são hidrogênio, então R é diferente de 2-clorofenila, 2- fluorofenila, 2-metilfenila, 4-clorofenila, 3-trifluorometilfenila,
5 3,4- diclorofenila e 3,5-diclorofenila.

24. Composto de fórmula IH:



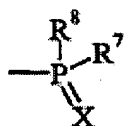
IH

em que

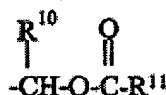
R é 1-naftila, fenila ou fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C₁-C₂) alquila;

- 10 R¹ é selecionado dentre hidrogênio, (C₁-C₄) alquila e (C₁-C₂) haloalquila; R² é hidrogênio;

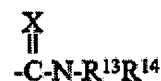
R⁵ é selecionado dentre ciano, (C₁-C₂) alcóxi(C₁-C₂) alquila, 4-(C₁-C₂) alcóxibenzila,



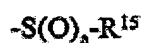
(1),



(3),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

- 15 X é oxigênio ou enxofre;
R⁷ e R⁸ são (C₁-C₂) alcóxi ou (C₁-C₂) haloalquila;
R¹⁰ é hidrogênio;
R¹¹ é (C₁-C₄) alquila;
R¹³ é (C₁-C₂) alquila;
20 R¹⁴ é hidrogênio ou (C₁-C₂) alquila;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

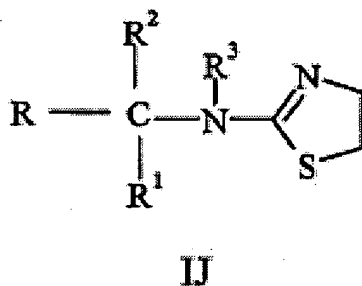
R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

- 5 os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos;
desde que

quando R é 1-naftila e R^5 é fórmula (5) onde X é enxofre, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio, então R^1 é diferente de (C_1-C_4) alquila; e

- 10 quando R é 3-cloro-2-metilfenila e R^1 é hidrogênio, então R^5 é diferente de fórmula (5) onde X é oxigênio, R^{13} é metila e R^{14} é hidrogênio ou fórmula (6) onde R^{15} é metila.

25. Composto de fórmula IJ:



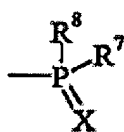
onde

- 15 R é selecionado dentre 1-naftila, 2- (C_1-C_2) alcoxifenila, 3- (C_1-C_2) alcoxifenila, 4- (C_1-C_2) alcoxifenila, 2,4- (C_1-C_2) dialcoxifenila, fenila ou fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C_1-C_2) alquila e (C_1-C_2) haloalquila;

R^1 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_3) alquila, fenila ou benzila;

- 20 R^2 é hidrogênio; e

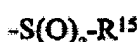
R^3 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_2) alquila,



(1),



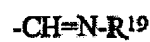
(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi;

R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio;

a é 2;

5 R^{15} é (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é hidrogênio, (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos;

desde que

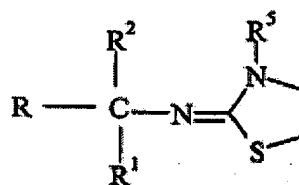
10 quando R é diferente de 2,3-dimetilfenila, então pelo menos um dentre R^1 ou R^3 é diferente de hidrogênio;

quando R é fenila, R^1 e R^3 são metila, então o composto é diferente de isômero ((1S)-1 -feniletil)metil-1,3-tiazolin-2-ilamina;

15 quando R é fenila, R^1 é metila e R^3 é hidrogênio, então o composto é diferente de isômero ((1R)-1-feniletila)-1,3-tiazolin-2-ilamina; e

quando R é 2,3-diclorofenila e R^1 é hidrogênio, então R^3 é diferente de fórmula (7) onde X é oxigênio e R^{16} é metóxi.

26. Composto de fórmula IK:



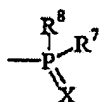
IK

20 onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C_1-C_2) alquila;

R^1 e R^2 são hidrogênio; e

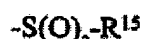
R^5 é selecionado dentre



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

25 onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi;

R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio;

5 a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) dialquilamino;

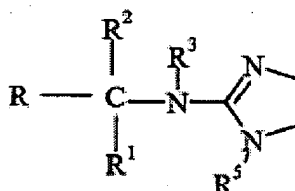
R^{16} é hidrogênio, (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos.

10

27. Composto de fórmula IL:



IL

onde

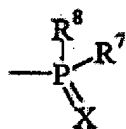
R é selecionado dentre 1-naftila, fenila ou fenila substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio, (C_1-C_2) alquila e (C_1-C_2) haloalquila;

15

R^1 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_3) alquila, fenila ou benzila;

R^2 é hidrogênio; e

R^3 é selecionado dentre hidrogênio, (C_1-C_2) alquila,



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

20

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi;

R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio ou (C_1-C_2) alquila;

a é 2;

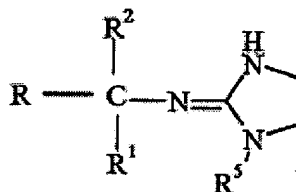
R^{15} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é hidrogênio, (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

5 os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos.

28. Composto de fórmula IM:



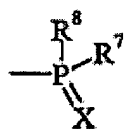
IM

onde

R é fenila opcionalmente substituída com um ou dois substituintes selecionados dentre halogênio ou (C_1-C_2) alquila;

10 R^1 e R^2 são hidrogênio; e

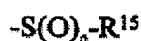
R^5 é selecionado dentre ciano,



(1),



(5),



(6),



(7) e



(9);

onde

X é oxigênio ou enxofre;

R^7 e R^8 são (C_1-C_2) alcóxi;

15 R^{13} é (C_1-C_2) alquila;

R^{14} é hidrogênio ou (C_1-C_2) alquila;

a é 2;

R^{15} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) dialquilamino;

R^{16} é hidrogênio, (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi;

20 e R^{19} é (C_1-C_2) alquila ou (C_1-C_2) alcóxi; e

os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos.

29. Composição inseticida compreendendo um composto como definido na reivindicação 23.

30. Composição inseticida compreendendo um composto como definido na reivindicação 24.

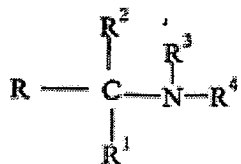
31. Composição inseticida compreendendo um composto como definido na reivindicação 25.

5 32. Composição inseticida compreendendo um composto como definido na reivindicação 26.

33. Composição inseticida compreendendo um composto como definido na reivindicação 27.

10 34. Composição inseticida compreendendo um composto como definido na reivindicação 28.

PI 0610877-2



RESUMO

Patente de Invenção: **"DERIVADOS HETEROCÍCLICOS E HETEROARILA COM SUBSTITUIÇÃO BENZILAMINO INSETICIDAS".**

A presente invenção refere-se a alguns derivados heterocíclicos e heteroarila com substituição benzilamino tem fornecido atividade inseticida e acaricida inesperada. Estes compostos são representados pela fórmula (I): em que R, R¹, R², R³ e R⁴ são completamente aqui descritos. Além disso, as composições compreendendo uma quantidade inseticidamente eficaz de, pelo menos, um composto de fórmula (I) e, opcionalmente, uma quantidade eficaz de pelo menos um composto adicional, são também descritos; junto com métodos de controle de insetos compreendendo aplicar referidas composições a um local onde os insetos estão presentes ou são esperados como estando presentes.