



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

(21) PI 0714572-1 A2



* B R P I 0 7 1 4 5 7 2 A 2 *

(22) Data de Depósito: 13/08/2007

(43) Data da Publicação: 04/06/2013
(RPI 2213)

(51) Int.Cl.:

C07D 409/12

C07F 7/08

A01N 43/40

(54) Título: COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO AGRÍCOLA, PROCESSO PARA O TRATAMENTO DE FUNGOS NOCIVOS FITOPATOGÊNICOS, USO DE COMPOSTOS, MÉTODOS PARA COMBATER PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER COLHEITAS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER SEMENTE DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES E DA INFESTAÇÃO DE BROTO E RAÍZES DE MUDAS POR PESTES ARTRÓPODES, E PARA PROTEGER MATERIAIS NÃO-VIVOS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, E, SEMENTE

(30) Prioridade Unionista: 22/08/2006 EP 06119331.4

(73) Titular(es): Basf Se

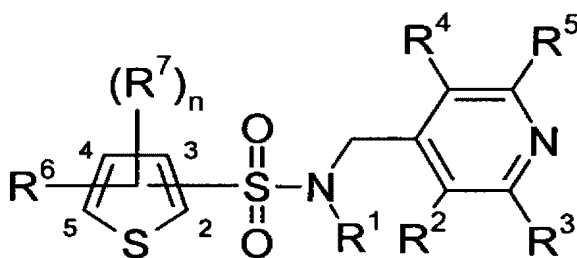
(72) Inventor(es): Bernd müller, Jan Klaas Lohmann, Jens Renner, Joachim Rheinheimer, Jochen Dietz, Michael Puhl, Wassilios Grammenos

(74) Procurador(es): Monsen Leonardos & CIA

(86) Pedido Internacional: PCT EP2007058348 de 13/08/2007

(87) Publicação Internacional: WO 2008/022937 de 28/02/2008

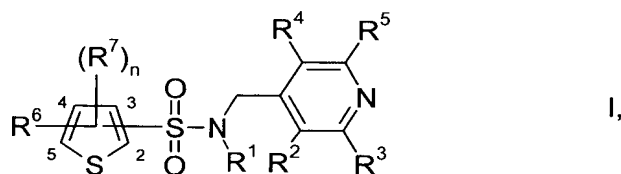
(57) Resumo: COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO AGRÍCOLA, PROCESSO PARA O TRATAMENTO DE FUNGOS NOCIVOS FITOPATOGÊNICOS, USO DE COMPOSTOS, MÉTODOS PARA COMBATER PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER COLHEITAS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER SEMENTE DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES E DA INFESTAÇÃO DE BROTO E RAÍZES DE MUDAS POR PESTES ARTRÓPODES, E PARA PROTEGER MATERIAIS NÃO-VIVOS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, E, SEMENTE. A presente invenção refere-se às picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I onde R^1 a R^7 e n são como definidos nas reivindicações e aos N-óxidos, sais agriculturamente aceitáveis e sais veterinariamente aceitáveis e aos N-óxidos, sais agriculturamente aceitáveis e sais veterinariamente aceitáveis dos Compostos (I), desde que se o anel tiofeno estiver ligado no grupo sulfonila via posição 2, R^6 não poderá estar na posição 5. A invenção também se refere a um processo para preparar estes compostos. Ademais, a invenção refere-se ao uso dos compostos I e dos seus N-óxidos e de seus sais agriculturamente aceitáveis para combater fungos fitopatogênicos (dqui em diante chamados de fungos nocivos). Adicionalmente, os compostos (I), seus N-óxidos e sais podem ser usados para controlar pestes artrópodes. Além disso, a invenção refere-se à semente compreendendo um composto (I) ou um seu N-óxido ou sal agriculturamente aceitável.



“COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO AGRÍCOLA, PROCESSO PARA O TRATAMENTO DE FUNGOS NOCIVOS FITOPATOGÊNICOS, USO DE COMPOSTOS, MÉTODOS PARA COMBATER PESTES ARTRÓPODES, PARA
 5 PROTEGER COLHEITAS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER SEMENTE DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES E DA INFESTAÇÃO DE BROTO E RAÍZES DE MUDAS POR PESTES ARTRÓPODES, E PARA PROTEGER MATERIAIS NÃO-VIVOS DO ATAQUE OU DA
 10 INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, E, SEMENTE”

Descrição da patente de invenção

A presente invenção refere-se às picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I



onde

15 R^1 é hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, ciano- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_6 -ciclo-alquil- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_6 -halo-ciclo-alquil- C_1 - C_4 -alquila, (C_1 - C_4 -alquil)-carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonila, C_2 - C_4 -alquenila, ciano- C_2 - C_4 -alquenila, C_2 - C_4 -halo-
 20 alquenila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_2 - C_4 -alquenila, C_1 - C_4 -halo-alcóxi- C_2 - C_4 -alquenila, (C_1 - C_4 -alquil)-carbonil- C_2 - C_4 -alquenila, (C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonil- C_2 - C_4 -alquenila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino- C_2 - C_4 -alquenila, C_2 - C_4 -alquinila, C_2 - C_4 -halo-alquinila, C_1 - C_4 -alquil- C_2 - C_4 -alquinila, C_1 - C_4 -halo-alquil- C_2 - C_4 -alquinila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_2 - C_4 -alquinila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino, ou benzila
 25 que pode possuir no anel fenila um radical ciano, halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, C_1 - C_4 -halo-alcoxila, (C_1 - C_4 -alquil)-

carbonila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila ou di(C₁-C₄-alquil)-amino;

R², R³ independentemente um do outro são selecionados de hidrogênio, tiol, amino, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-halo-alquil-tio, C₁-C₄-alquil-sulfinila, C₁-C₄-halo-alquil-sulfinila, C₁-C₄-alquil-sulfonila, C₁-C₄-halo-alquil-sulfonila, (C₁-C₄-alquil)-amino, di(C₁-C₄-alquil)-amino, tri-C₁-C₄-alquil-silila C₂-C₄-alquenila, C₂-C₄-alquinila ou um anel heterociclila de 5 ou 6 membros contendo um átomo de nitrogênio e opcionalmente um segundo heteroátomo selecionado de oxigênio, enxofre, NH ou N(C₁-C₄-alquila);

R⁴, R⁵ independentemente um do outro são selecionados de hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo-alcoxila;

ou

R² e R³ juntos com os átomos de carbono nos quais estão ligados, podem formar um anel fenila, ciclo-pentila, ciclo-hexila ou heterociclila de 5 ou 6 membros contendo um a três heteroátomos selecionados do grupo consistindo de 2 átomos de nitrogênio, 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre, sendo possível que todos estes anéis tragam um ou dois grupos R⁸ e/ou R⁹,

R⁸, R⁹ independentemente um do outro são halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo-alcoxila;

R⁶ é halogênio, ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcoxila, C₁-C₆-halo-alcoxila, (C₁-C₄-alquil)-carbonila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, -C(R¹⁰)=NOR¹¹, (C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila, di(C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila, fenila ou fenoxila, onde o anel nos últimos dois radicais mencionados pode trazer um, dois ou três grupos R¹²;

R⁷ ciano, formila, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, amino-carbonila, C₁-C₄-alquil-amino-carbonila ou

di(C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila;

n é zero ou um;

ou

5 R⁶ e R⁷ juntos com os átomos de carbono nos quais estão ligados, podem formar um anel fenila condensado, sendo possível que o anel fenila traga um grupo C₁-C₄-alquila;

R¹⁰ é hidrogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alcóxi-C₁-C₄-alquila, fenila que pode possuir um radical ciano, halogênio, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo-alcoxila, ou benzila que pode possuir um radical ciano, halogênio ou C₁-C₄-alquila;

R¹¹ é C₁-C₆-alquila, benzila, C₂-C₄-alquenila, C₁-C₄-halo-alquila, C₂-C₄-halo-alquenila, C₂-C₄-alquinila ou C₂-C₄-halo-alquinila;

R¹² é nitro, ciano, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, C₁-C₄-alquil-tio, C₁-C₄-halo-alquil-tio, C₁-C₄-alquil-sulfonila, C₁-C₄-halo-alquil-sulfonila, (C₁-C₄-alquil)-amino, di(C₁-C₄-alquil)-amino, tri(C₁-C₄-alquil)-silila, -CH=NO(C₁-C₄-alquil), -C(C₁-C₄-alquil)=NO(C₁-C₄-alquila), C₂-C₄-alquenila ou C₃-C₄-alquinila;

ou dois radicais R¹² podem formar uma cadeia C₃-C₄-alquilenos ou C₄-alquenilenos que, junta com dois membros de anel adjacentes do anel arila no qual está ligada, forma um anel que pode estar substituído com um a 3 grupos R¹³;

R¹³ é halogênio, ciano, nitro, C₁-C₈-alquila, C₁-halo-alquila, C₁-C₈-alcoxila, C₁-C₈-halo-alcoxila, (C₁-C₄-alquil)-carbonila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, -C(R¹⁴)=NOR¹⁵, (C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila, di(C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila ou fenila ou fenoxila, onde o anel nos últimos dois radicais mencionados pode trazer um, dois ou três grupos R¹⁶;

R¹⁴ é hidrogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alcóxi-C₁-C₄-alquila, fenila que pode possuir

um radical ciano, halogênio, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo-alcoxila, ou benzila que pode possuir um radical ciano, halogênio ou C₁-C₄-alquila;

R¹⁵ é C₁-C₆-alquila, benzila, C₂-C₄-alquenila, C₁-C₄-halo-alquila, C₂-C₄-halo-alquenila, C₂-C₄-alquinila ou C₂-C₄-halo-alquinila;

5 R¹⁶ é halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcoxila, C₁-halo-alquila ou C₁-halo-alcoxila;

e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis e os sais veterinariamente aceitáveis dos Compostos I,

10 desde que se o anel tiofeno estiver ligado no grupo sulfonila via posição 2, R⁶ não poderá estar na posição 5.

Além do mais, a invenção refere-se aos processos para preparar estes Compostos, às composições contendo-os e ao seu uso para controlar their use para controlar fungos nocivos fitopatogênicos.

15 A presente invenção também se refere ao uso de picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico I para combater pestes artrópodes (artrópodes nocivos) e para proteger colheitas, semente e materiais contra infestação e/ou destruição por ditas pestes.

20 WO 2005/33081 descreve 4-piridil-metil-amidas de Compostos de ácido benzeno-sulfônico e seu uso para combater fungos nocivos. Contudo, a ação dos Compostos lá descritos nem sempre é completamente satisfatória. Portanto, um objetivo da presente invenção foi proporcionar Compostos tendo ação aperfeiçoada e/ou espectro de atividade ampliado contra fungos nocivos.

25 Foi descoberto que este objetivo é alcançado pelos Compostos de fórmula I, seus N-óxidos e sais, como aqui definidos. Comparados com os Compostos conhecidos, os Compostos de fórmula I têm eficácia aumentada contra fungos nocivos. Portanto a invenção refere-se aos Compostos de fórmula geral I, seus N-óxidos e os seus sais. A invenção também se refere a um processo para preparar estes Compostos.

Ademais, a invenção refere-se ao uso dos Compostos I e dos N-óxidos e dos sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos para combater fungos fitopatogênicos (daqui em diante chamados de fungos nocivos). Conseqüentemente, a invenção também proporciona um processo para combater fungos fitopatogênicos, cujo processo compreende tratar os fungos ou os materiais, plantas, o solo ou sementes a serem protegidos contra o ataque fúngico, com uma quantidade efetiva de uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I ou um seu N-óxido ou um seu sal agriculturalmente aceitável.

Conseqüentemente, a invenção adicionalmente proporciona composições agrícolas, preferivelmente na forma de pós, dispersões oleosas, pastas, emulsões, soluções diretamente pulverizáveis, materiais para espalhar, poeiras ou na forma de grânulos, que compreende uma quantidade pesticidamente efetiva de pelo menos um composto I, um seu N-óxido ou um seu sal, e pelo menos um veículo que pode ser líquido e/ou sólido e que é preferivelmente agronomicamente aceitável, e/ou pelo menos um tensoativo.

Ademais, foi descoberto que os Compostos I, seus N-óxidos e sais podem ser usados para controlar pestes artrópodes. Os Compostos I, seus N-óxidos e sais são em particular úteis para combater insetos. Igualmente os Compostos I, seus N-óxidos e sais são em particular úteis para combater aracnídeos. O termo "combater peste artrópode" como aqui usado compreende controlar, i.e. matar, ditas pestes e também proteger plantas, materiais não-vivos ou semente de um ataque ou uma infestação por ditas pestes. Portanto a invenção refere-se ao uso dos Compostos I e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis dos mesmos, para combater pestes artrópodes.

Ademais, a invenção proporciona um método para combater tais pestes, que compreende contatar ditas pestes, seu habitat, região de geração, fonte de alimento, planta, semente, solo, área, material ou ambiente

no qual as pestes animais estão crescendo ou podem crescer, ou os materiais, plantas, sementes, solos, superfícies ou espaços a serem protegidos de um ataque ou infestação por ditas pestes, com uma quantidade pesticidamente efetiva de um composto I, um seu N-óxido ou sal, como aqui definidos.

5 A invenção proporciona em particular um método para proteger colheitas, incluindo sementes, do ataque ou da infestação por pestes artrópodes e/ou da infecção por fungos fitopatogênicos, dito método compreende contatar uma colheita com uma quantidade efetiva de pelo menos um composto de fórmula I ou o seu N-óxido ou sal, como aqui definidos. A
10 invenção também proporciona sementes, compreendendo uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I, ou um seu N-óxido ou um seu sal agriculturalmente aceitável, preferivelmente em uma quantidade de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de sementes.

A invenção também proporciona um método para proteger
15 materiais não-vivos do ataque ou da infestação pelas pestas e/ou pelos fungos nocivos anteriormente mencionados, cujo método compreende contatar o material não-vivo com uma quantidade efetiva de pelo menos um composto de fórmula I como aqui definido, com um seu N-óxido ou com um seu sal.

Compostos de fórmula I adequados incluem todos os possíveis
20 estereoisômeros (isômeros cis/trans, enantiômeros) que podem ocorrer e suas misturas. Centros estereoisoméricos são e.g. o átomo de carbono e o átomo de nitrogênio dos grupos $-C(R^{10})=NOR^{11}$ e $-C(R^{14})=NOR^{15}$, bem como os átomos de carbono assimétricos nos radicais R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 e/ou R^6 etc. A presente invenção proporciona ambos os enantiômeros ou diastereômeros
25 puros ou suas misturas, os isômeros cis e trans puros quanto as suas misturas. Os Compostos de fórmula geral I também podem existir na forma de taurômeros diferentes. A invenção compreende os tautômeros individuais, se separáveis, bem como a misturas de tautômeros. A presente invenção inclui ambos os (R)- e (S)-isômeros de Compostos de fórmula I tendo centros

quirais bem como as suas misturas, em particular os seus racematos.

Os Compostos de fórmula I podem estar presentes em modificações cristalinas diferentes cuja atividade biológica pode diferir. Também formam parte do tema da presente invenção.

5 Sais dos Compostos de fórmula I e dos N-óxidos de fórmula I são preferivelmente sais agriculturalmente aceitáveis ou veterinariamente aceitáveis. Podem ser formados por métodos costumeiros, e.g. pela reação do composto I com um ácido do ânion em questão se o composto de fórmula I
10 I ácido com uma base adequada.

Sais agriculturalmente úteis adequados incluem os sais daqueles cátions ou os sais de adição de ácido cujos cátions e ânions, respectivamente, não têm qualquer efeito adverso sobre a ação dos Compostos de acordo com a presente invenção. Cátions adequados são em
15 particular os íons dos metais alcalinos, preferivelmente lítio, sódio e potássio, dos metais alcalino-terrosos, preferivelmente cálcio, magnésio e bário, e dos metais de transição, preferivelmente manganês, cobre, zinco e ferro, e também amônio (NH_4^+) e amônio substituído no qual um a quatro dos átomos de hidrogênio estão substituídos por C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -hidróxi-alquila, C_1 -
20 C_4 -alcoxila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, hidróxi- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, fenila ou benzila. Exemplos de íons amônio substituído compreendem metil-amônio, isopropil-amônio, dimetil-amônio, diisopropil-amônio, trimetil-amônio, tetrametil-amônio, tetraetil-amônio, tetrabutyl-amônio, 2-hidróxi-etil-amônio, 2-(2-hidróxi-etóxi)-etil-amônio, bis(2-hidróxi-etil)-amônio, benzil-
25 trimetil-amônio e benzil-trietil-amônio, ademais íons fosfônio, íons sulfônio, preferivelmente tri(C_1 - C_4 -alquil)-sulfônio, e íons sulfoxônio, preferivelmente tri(C_1 - C_4 -alquil)-sulfoxônio.

Ânions de sais de adição de ácido úteis são primariamente cloreto, brometo, brometo, fluoreto, hidrogeno-sulfato, sulfato, di-hidrogeno-

fosfato, hidrogeno-fosfato, fosfato, nitrato, hidrogeno-carboneto, hexafluoro-silicato, hexafluoro-fosfato, benzoato, e os ânions de ácidos C₁-C₄-alcanóicos, preferivelmente formiato, acetato, propionato e butirato. Podem ser formados pela reação dos Compostos de fórmula I com um ácido do ânion correspondente, preferivelmente de ácido clorídrico, ácido bromídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico ou ácido nítrico.

Os grupos orgânicos mencionados nas definições acima das variáveis são - como o termo halogênio - termos coletivos para listagens individuais dos membros de grupo individual. O prefixo C_n-C_m indica em cada caso o possível número de átomos de carbono no grupo.

halogênio: flúor, cloro, bromo e iodo;

alquila e todos os grupos alquila em alquil-carbonila, alquil-amino, dialquil-amino, tri(alquil)-silila, dialquil-amino-carbonila, alquil-sulfinila, alquil-sulfonila: radicais hidrocarboneto saturados de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono, preferivelmente 1 a 6 átomos de carbono (C₁-C₆-alquila), especialmente 1 a 4 átomos de carbono (C₁-C₄-alquila) tais como metila, etila, propila, 1-metil-etila, butila, 1-metil-propila, 2-metil-propila, 1,1-dimetil-etila, pentila, 1-metil-butila, 2-metil-butila, 3-metil-butila, 2,2-dimetil-propila, 1-etil-propila, hexila, 1,1-dimetil-propila, 1,2-dimetil-propila, 1-metil-pentila, 2-metil-pentila, 3-metil-pentila, 4-metil-pentila, 1,1-dimetil-butila, 1,2-dimetil-butila, 1,3-dimetil-butila, 2,2-dimetil-butila, 2,3-dimetil-butila, 3,3-dimetil-butila, 1-etil-butila, 2-etil-butila, 1,1,2-trimetil-propila, 1,2,2-trimetil-propila, 1-etil-1-metil-propila e 1-etil-2-metil-propila; alquila tendo 1 a 10 átomos de carbono (C₁-C₁₀-alquila): C₁-C₆-alquila como mencionada acima, e também, por exemplo heptila, octila, 2-etil-hexila, 2,4,4-trimetil-pentila, 1,1,3,3-tetrametil-butila, n-nonila e n-decila;

alcoxila: radicais hidrocarboneto saturados de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono, preferivelmente 1 a 6 átomos de carbono, especialmente 1 a 4 átomos de carbono, como aqui

definidos, que está ligado no restante da molécula via uma ligação oxigênio;

halo-alquila: grupos alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 2, 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono (como mencionado acima), onde alguns ou todos os átomos de hidrogênio nestes grupos podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima: em particular C_1 - C_2 -halo-alquila, tais como cloro-metila, bromo-metila, dicloro-metila, tricloro-metila, fluoro-metila, difluoro-metila, trifluoro-metila, cloro-fluoro-metila, dicloro-fluoro-metila, cloro-difluoro-metila, 1-cloro-etila, 1-bromo-etila, 1-fluoro-etila, 2-fluoro-etila, 2,2-difluoro-etila, 2,2,2-trifluoro-etila, 2-cloro-2-fluoro-etila, 2-cloro-2,2-difluoro-etila, 2,2-dicloro-2-fluoro-etila, 2,2,2-tricloro-etila, pentafluoro-etila ou 1,1,1-trifluoroprop-2-ila;

halo-alcoxila e todos os grupos halo-alcoxila em halo-alcóxi-alquila, halo-alcóxi-alquenila: grupos alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono, em particular 1 a 6 átomos de carbono (C_1 - C_6 -halo-alquila), especialmente 1 a 4 átomos de carbono (C_1 - C_4 -halo-alquila), como mencionado acima ligados através de ligação oxigênio, em qualquer ligação no grupo alquila, onde alguns ou todos os átomos de hidrogênio nestes grupos podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima, por exemplo C_1 - C_2 -halo-alcoxila, tais como cloro-metoxila, bromo-metoxila, dicloro-metoxila, tricloro-metoxila, fluoro-metoxila, difluoro-metoxila, trifluoro-metoxila, cloro-fluoro-metoxila, dicloro-fluoro-metoxila, cloro-difluoro-metoxila, 1-cloro-etoxila, 1-bromo-etoxila, 1-fluoro-etoxila, 2-fluoro-etoxila, 2,2-difluoro-etoxila, 2,2,2-trifluoro-etoxila, 2-cloro-2-fluoro-etoxila, 2-cloro-2,2-difluoro-etoxila, 2,2-dicloro-2-fluoro-etoxila, 2,2,2-tricloro-etoxila, 5-fluoro-pentoxila, 5-cloro-pentoxila, 5-bromo-pentoxila, 5-iodo-pentoxila, 6-fluoro-hexoxila, 6-cloro-hexoxila, 6-bromo-hexoxila ou 6-iodo-hexoxila e semelhante;

alquil-tio: radicais hidrocarboneto saturados de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono, preferivelmente 1 a

6 átomos de carbono, especialmente 1 a 4 átomos de carbono, como aqui definidos, que está ligado no restante de molécula via uma ligação enxofre;

halo-alquil-tio: grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4 átomos de carbono, como mencionado acima que está ligado no
5 restante de molécula via uma ligação enxofre, onde alguns ou todos os átomos de hidrogênio podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima;

halo-alquil-sulfinila: grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4 átomos de carbono, como mencionado acima que está
10 ligado no restante de molécula via um grupo SO, onde alguns ou todos os átomos de hidrogênio podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima;

halo-alquil-sulfonila: grupo alquila de cadeia linear ou ramificada tendo 1 a 4 átomos de carbono, como mencionado acima que está
15 ligado no restante de molécula via um grupo SO₂, onde alguns ou todos os átomos de hidrogênio podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima;

alquenila: radicais hidrocarboneto insaturados de cadeia linear ou ramificada tendo 2 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono e uma ou duas
20 ligações duplas em qualquer posição, por exemplo C₂-C₆-alquenila, tais como etenila, 1-propenila, 2-propenila, 1-metil-etenila, 1-butenila, 2-butenila, 3-butenila, 1-metil-1-propenila, 2-metil-1-propenila, 1-metil-2-propenila, 2-metil-2-propenila, 1-pentenila, 2-pentenila, 3-pentenila, 4-pentenila, 1-metil-1-butenila, 2-metil-1-butenila, 3-metil-1-butenila, 1-metil-2-butenila, 2-metil-2-butenila, 3-metil-2-butenila, 1-metil-3-butenila, 2-metil-3-butenila, 3-metil-3-butenila, 1,1-dimetil-2-propenila, 1,2-dimetil-1-propenila, 1,2-dimetil-2-propenila, 1-etil-1-propenila, 1-etil-2-propenila, 1-hexenila, 2-hexenila, 3-hexenila, 4-hexenila, 5-hexenila, 1-metil-1-pentenila, 2-metil-1-pentenila, 3-metil-1-pentenila, 4-metil-1-pentenila, 1-metil-2-pentenila, 2-

metil-2-pentenila, 3-metil-2-pentenila, 4-metil-2-pentenila, 1-metil-3-pentenila, 2-metil-3-pentenila, 3-metil-3-pentenila, 4-metil-3-pentenila, 1-metil-4-pentenila, 2-metil-4-pentenila, 3-metil-4-pentenila, 4-metil-4-pentenila, 1,1-dimetil-2-butenila, 1,1-dimetil-3-butenila, 1,2-dimetil-1-butenila, 1,2-di metil-2-butenila, 1,2-dimetil-3-butenila, 1,3-dimetil-1-butenila, 1,3-dimetil-2-butenila, 1,3-dimetil-3-butenila, 2,2-dimetil-3-butenila, 2,3-dimetil-1-butenila, 2,3-di metil-2-butenila, 2,3-dimetil-3-butenila, 3,3-dimetil-1-butenila, 3,3-dimetil-2-butenila, 1-etil-1-butenila, 1-etil-2-butenila, 1-etil-3-butenila, 2-etil-1-butenila, 2-etil-2-butenila, 2-etil-3-bu tenila, 1,1,2-trimetil-2-propenila, 1-etil-1-metil-2-propenila, 1-etil-2-metil-1-propenila e 1-etil-2-metil-2-propenila;

halo-alquenila: radicais hidrocarboneto insaturados de cadeia linear ou ramificada tendo 2 a 4 átomos de carbono e uma ou duas ligações duplas em qualquer posição (como mencionado acima), onde nestes grupos alguns ou todos os átomos de hidrogênio podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima, em particular por flúor, cloro e bromo;

alquinila: grupos hidrocarboneto de cadeia linear ou ramificada tendo 2 a 4, 6, 8 ou 10 átomos de carbono e uma ou duas ligações triplas em qualquer posição, por exemplo C₂-C₆-alquinila, tais como etinila, 1-propinila, 2-propinila, 1-butinila, 2-butinila, 3-butinila, 1-metil-2-propinila, 1-pentinila, 2-pentinila, 3-pentinila, 4-pentinila, 1-metil-2-butinila, 1-metil-3-butinila, 2-metil-3-butinila, 3-metil-1-butinila, 1,1-dimetil-2-propinila, 1-etil-2-propinila, 1-hexinila, 2-hexinila, 3-hexinila, 4-hexinila, 5-hexinila, 1-metil-2-pentinila, 1-metil-3-pentinila, 1-metil-4-pentinila, 2-metil-3-pentinila, 2-metil-4-pentinila, 3-metil-1-pentinila, 3-metil-4-pentinila, 4-metil-1-pentinila, 4-metil-2-pentinila, 1,1-dimetil-2-butinila, 1,1-dimetil-3-butinila, 1,2-dimetil-3-butinila, 2,2-dimetil-3-butinila, 3,3-dimetil-1-butinila, 1-etil-2-butinila, 1-etil-3-butinila, 2-etil-3-butinila e 1-etil-1-metil-2-propinila;

halo-alquinila: radicais hidrocarboneto insaturados de cadeia

linear ou ramificada tendo 2 a 4 átomos de carbono e uma ligação tripla em qualquer posição (como mencionado acima), onde nestes grupos alguns ou todos os átomos de hidrogênio podem estar substituídos por átomos de halogênio como mencionado acima, em particular por flúor, cloro e bromo;

5 ciclo-alquila: grupos hidrocarboneto saturados mono- ou bicíclicos tendo 3 a 6 membros de anel de carbonos, por exemplo C₃-C₆-ciclo-alquila tais como ciclo-propila, ciclo-butila, ciclo-pentila, e ciclo-hexila;

 tri(C₁-C₄-alquil)-silila: radical de silício trazendo grupos 3 C₁-C₄-alquila, que podem ser idênticos ou diferentes, exemplos incluindo
10 trimetil-silila, trietil-silila, dimetil-etil-silila, dimetil-isopropil-silila, dimetil-n-butil-silila, dimetil-2-butil-silila, etc.

 os termos "ciano-C₁-C₄-alquila", "C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila", "C₁-C₄-halo-alcóxi-C₁-C₄-alquila", "di(C₁-C₄-alquil)-amino-C₁-C₄-alquila", "C₃-C₆-ciclo-alquil-C₁-C₄-alquila", "C₃-C₆-halo-ciclo-alquil-C₁-C₄-alquila",
15 "N-heterociclílico-de-5-ou-6-membros-saturado-C₁-C₄-alquila", como aqui usados, referem-se a C₁-C₄-alquila, como aqui definido, que está substituída com um radical selecionado de ciano, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, di(C₁-C₄-alquil)-amino, C₃-C₆-ciclo-alquila, C₃-C₆-halociclo-alquila, N-heterociclílica de 5 ou 6 membros saturada;

20 os termos "ciano-C₂-C₄-alquenila", "C₁-C₄-alcóxi-C₂-C₄-alquenila", "C₁-C₄-halo-alcóxi-C₂-C₄-alquenila", "(C₁-C₄-alquil)-carbonil-C₂-C₄-alquenila", "(C₁-C₄-alcóxi)-carbonil-C₂-C₄-alquenila", "di(C₁-C₄-alquil)-amino-C₂-C₄-alquenila" referem-se a C₂-C₄-alquenila, como aqui definido, que está substituída com um radical selecionado de ciano, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, (C₁-C₄-alquil)-carbonila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, di(C₁-C₄-alquil)-amino;
25

 os termos "C₁-C₄-halo-alquil-C₂-C₄-alquinila", "C₁-C₄-alcóxi-C₂-C₄-alquinila", "tri(C₁-C₄-alquil)-silil-C₂-C₄-alquinila" refere-se a C₂-C₄-alquinila, como aqui definido, que está substituída com um radical

selecionado de C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila, tri(C₁-C₄-alquil)-silila;

heterociclo de cinco ou seis membros que contém um, dois, três ou quatro heteroátomos do grupo consistindo de O, N e S, é para ser entendido com o significado de heterociclos tanto saturados, parcialmente insaturados quanto aromáticos tendo 5 ou 6 átomos no anel, incluindo:

- heterociclila de 5 ou 6 membros que contém um, dois ou três átomos de nitrogênio e/ou um átomo de oxigênio ou de enxofre ou um ou dois átomos de oxigênio e/ou de enxofre, e que está saturada ou parcialmente insaturada, por exemplo 2-tetra-hidro-furanila, 3-tetra-hidro-furanila, 2-tetra-hidro-tienila, 3-tetra-hidro-tienila, 2-pirrolidinila, 3-pirrolidinila, 3-isoxazolidinila, 4-isoxazolidinila, 5-isoxazolidinila, 3-isotiazolidinila, 4-isotiazolidinila, 5-isotiazolidinila, 3-pirazolidinila, 4-pirazolidinila, 5-pirazolidinila, 2-oxazolidinila, 4-oxazolidinila, 5-oxazolidinila, 2-tiazolidinila, 4-tiazolidinila, 5-tiazolidinila, 2-imidazolidinila, 4-imidazolidinila, 2-pirrolin-2-ila, 2-pirrolin-3-ila, 3-pirrolin-2-ila, 3-pirrolin-3-ila, 2-piperidinila, 3-piperidinila, 4-piperidinila, 1,3-dioxan-5-ila, 2-tetra-hidro-piranila, 4-tetra-hidro-piranila, 2-tetra-hidro-tienila, 3-hexa-hidro-piridazinila, 4-hexa-hidro-piridazinila, 2-hexa-hidro-pirimidinila, 4-hexa-hidro-pirimidinila, 5-hexa-hidro-pirimidinila e 2-piperazinila;

- heterociclila aromática (heteroarila) de 5 membros que contém um, dois, três ou quatro átomos de nitrogênio ou um, dois ou três átomos de nitrogênio e um átomo de enxofre ou de oxigênio: grupos heteroarila de 5 membros que, em adição aos átomos de carbono, podem conter um a quatro átomos de nitrogênio ou um a três átomos de nitrogênio e um átomo de enxofre ou de oxigênio como membros de anel, por exemplo 2-tienila, 3-tienila, 3-pirazolila, 4-pirazolila, 5-pirazolila, 2-oxazolila, 4-oxazolila, 5-oxazolila, 2-tiazolila, 4-tiazolila, 5-tiazolila, 2-imidazolila, 4-imidazolila e 1,3,4-triazol-2-ila;

- heteroarila de 6 membros que contém um, dois, três ou

quatro átomos de nitrogênio: heteroarila de 6 membros grupos que, em adição aos átomos de carbono, pode conter um, dois, três ou quatro átomos de nitrogênio como membros de anel, por exemplo 2-piridinila, 3-piridinila, 4-piridinila, 3-piridazinila, 4-piridazinila, 2-pirimidinila, 4-pirimidinila, 5-pirimidinila e 2-pirazinila.

Igualmente um heterociclo saturado de cinco a oito membros que é ligado via nitrogênio e pode conter um, dois ou três outros heteroátomos ou grupos de heteroátomos do grupo consistindo de O, N, S, S(O) e S(O)₂ como membros de anel, é um heterociclo saturado, que contém um átomo de nitrogênio como membro de anel e que está ligado no restante da molécula via dito átomo de nitrogênio, e que tem 5, 6, 7 ou 8 átomos de anel que são átomos de carbono ou heteroátomos tais como O, N ou S ou grupos de heteroátomos tais como S(O) ou S(O)₂; exemplos incluindo pirrolidin-1-ila, piperazin-1-ila, morfolin-4-ila, tiomorfolin-4-ila, azepan-1-ila etc.

Carbociclo fundido de 5 ou 6 membros significa um anel hidrocarboneto que compartilha átomos de carbono adjacentes com outro anel, exemplos sendo ciclo-pentano, ciclo-penteno, ciclo-hexano, ciclo-hexeno e benzeno.

Exemplos de heterociclos de 5 ou 6 membros que contêm um anel carbociclo fundido de 5 ou 6 membros como mencionado acima são indolila, indolinila, isoindolinila, benzpirazolila, benzimidazolila, benzotriazolila, quinolinila, 1,2,3,4-tetra-hidro-quinolinila, isoquinolinila, ftalazinila, quinazinila, quinazolinila, cinolinila, benzofuranila, benzotiofenila, benzopiranila, di-hidro-benzopiranila, benzotiopiranila, 1,3-benzodioxolila, benzoxazolila, benzotiazolila, benzisoxazolila e 1,4-benzodioxanila.

Tendo em vista os usos intencionados das picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico I, preferência particular é dada aos seguintes significados de substituintes, em cada caso individualmente ou em

combinação:

A invenção preferivelmente proporciona Compostos de fórmula I na qual R^1 é hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, alila, propargila ou benzila, em particular hidrogênio.

5 Preferência também é dada aos Compostos de fórmula I na qual R^2 , R^3 , R^4 e R^5 independentemente uns dos outros são hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila tais como metila ou etila, halogênio tais como flúor ou cloro, C_1 - C_2 -halo-alquila tais como CF_3 , ou C_1 - C_2 -halo-alcoxila tais como OCF_3 ou $OCHF_2$.

10 Preferência particular é dada aos Compostos nos quais R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio.

Em adição, preferência particular também é dada aos Compostos de fórmula I na qual pelo menos um, em particular um ou dois, grupo(s) selecionado(s) de R^2 , R^3 , R^4 e R^5 não é/são hidrogênio. Dentre estes, 15 preferência é dada àqueles Compostos, nos quais ambos R^4 e R^5 são hidrogênio, enquanto que pelo menos um dos radicais R^2 , R^3 é diferente de hidrogênio e tem um dos significados dados acima. Em particular o R^2 e/ou R^3 que é diferente de hidrogênio é selecionado de C_1 - C_4 -alquila tal como metila ou etila, halogênio, tal como flúor ou cloro, C_1 - C_2 -halo-alquila tal 20 como CF_3 , ou C_1 - C_2 -halo-alcoxila tal como OCF_3 ou $OCHF_2$. Nesta modalidade preferência também é dada aos Compostos, nos quais um dos radicais R^2 e/ou R^3 é selecionado de amino, C_1 - C_4 -alquil-tio, C_1 - C_4 -halo-alquil-tio, C_1 - C_4 -alquil-sulfinila, C_1 - C_4 -halo-alquil-sulfinila, C_1 - C_4 -alquil-sulfonila, C_1 - C_4 -halo-alquil-sulfonila, (C_1 - C_4 -alquil)-amino, di(C_1 - C_4 -alquil)- 25 amino, tri(C_1 - C_4 -)alquil-silila C_2 - C_4 -alquenila ou C_2 - C_4 -alquinila. O radical restante R^2 ou R^3 é preferivelmente hidrogênio ou selecionado do grupo consistindo de C_1 - C_4 -alquila tal como metila ou etila, halogênio, tal como flúor ou cloro, C_1 - C_2 -halo-alquila tal como CF_3 , ou C_1 - C_2 -halo-alcoxila tal como OCF_3 ou $OCHF_2$.

Preferência é igualmente também dada aos Compostos de fórmula I, na qual os radicais R^2 e R^3 juntos com os átomos nos quais estão ligados formam um anel benzeno fundido, i.e. R^2 e R^3 juntos formam um radical bivalente $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$, no qual um ou dois dos átomos de hidrogênio podem estar substituídos por radicais R^8 e/ou R^9 . Nesta modalidade, R^4 e R^5 são preferivelmente hidrogênio.

Em uma primeira modalidade, R^6 é selecionado de halogênio, em particular cloro e flúor; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila, em particular metila e etila; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxila, em particular metoxila e etoxila; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -halo-alquila, em particular trifluoro-metila; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -halo-alcoxila, em particular difluoro-metoxila e trifluoro-metoxila; $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alcóxi})$ - carbonila, em particular metóxi-carbonila e etóxi-carbonila.

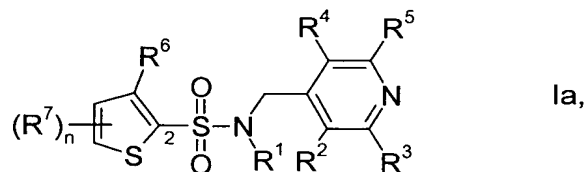
Em uma segunda modalidade R^6 é fenila, que estão não substituída ou preferivelmente traz 1, 2 ou 3 radicais R^{12} como definido acima. Preferência maior é dada aos Compostos nos quais um dos radicais é fenila, que está não substituída ou que preferivelmente traz 1, 2 ou 3 radicais R^{12} como definido acima. Se presente, o outro radical R^6 é preferivelmente diferente de fenila ou fenoxila, e mais preferivelmente selecionado de halogênio, em particular cloro e flúor; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alquila, em particular metila e etila; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alcoxila, em particular metoxila e etoxila; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -halo-alquila, em particular trifluoro-metila; $\text{C}_1\text{-C}_4$ -halo-alcoxila, em particular difluoro-metoxila e trifluoro-metoxila; $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alcóxi})$ - carbonila, em particular metóxi-carbonila e etóxi-carbonila.

Em uma modalidade dos Compostos I de acordo com a presente invenção, o índice n é zero.

Em outra modalidade dos Compostos I de acordo com a presente invenção, o índice n é 1.

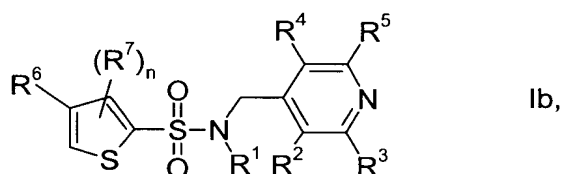
Nos Compostos de fórmula I, o anel tiofeno no grupo sulfonila pode estar ligado via o átomo de carbono na posição 2 ou 3.

Conseqüentemente, uma modalidade da invenção refere-se aos Compostos de fórmula Ia



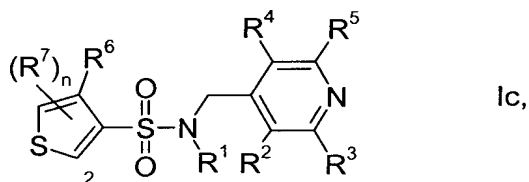
sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e n são como aqui definidos, e seus N-óxidos e sais. Dentre os Compostos Ia, preferência é dada àqueles, nos quais n é zero. Nos Compostos Ia, R^6 é preferivelmente fenila, que está não substituída ou substituída como definido acima.

Conseqüentemente, uma outra modalidade da invenção refere-se aos Compostos de fórmula Ib



sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e n são como aqui definidos, e seus N-óxidos e sais. Dentre os Compostos Ib, preferência é dada àqueles, nos quais n é zero. Nos Compostos Ib, R^6 é preferivelmente fenila, que está não substituída ou substituída como definido acima.

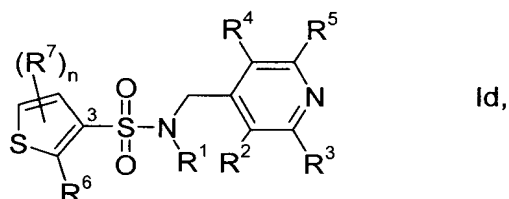
Conseqüentemente, uma outra modalidade da invenção refere-se aos Compostos de fórmula Ic



sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e n são como aqui definidos, e seus N-óxidos e sais. Dentre os Compostos Ic, preferência é dada àqueles, nos quais n é zero. Nos Compostos Ic, R^6 é preferivelmente fenila, que está não substituída ou substituída como definido acima.

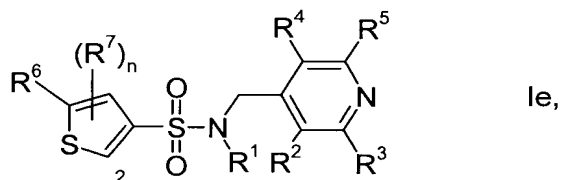
Conseqüentemente, uma outra modalidade da invenção refere-

se aos Compostos de fórmula Id



sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e n são como aqui definidos, e seus N-óxidos e sais. Dentre os Compostos Id, preferência é dada àqueles, nos quais n é zero. Nos Compostos Id, R^6 é preferivelmente fenila, que está não substituída ou substituída como definido acima.

Conseqüentemente, uma outra modalidade da invenção refere-se aos Compostos de fórmula Ie



sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e n são como aqui definidos, e seus N-óxidos e sais. Dentre os Compostos Ie, preferência é dada àqueles, nos quais n é zero. Nos Compostos Ie, R^6 é preferivelmente fenila, que está não substituída ou substituída como definido acima.

R^8 , se presente, é preferivelmente selecionado de halogênio, em particular cloro e flúor; C_1 - C_4 -alquila, em particular metila, etila, isopropila, terc-butila; C_1 - C_4 -alcoxila, em particular metoxila, etoxila, isopropoxila, terc-butoxila; e C_1 - C_4 -halo-alquila, em particular trifluorometila e penta fluoro-etila.

R^9 , se presente, é preferivelmente selecionado de halogênio, em particular cloro e flúor; C_1 - C_4 -alquila, em particular metila, etila, isopropila, terc-butila; C_1 - C_4 -alcoxila, em particular metoxila, etoxila, isopropoxila, terc-butoxila; e C_1 - C_4 -halo-alquila, em particular trifluorometila e penta fluoro-etila.

R^{10} , R^{14} , se presentes, são independentemente um do outro

preferivelmente selecionados de hidrogênio ou C₁-C₄-alquila, em particular hidrogênio.

R¹¹, R¹⁵, se presentes, são independentemente um do outro preferivelmente C₁-C₄-alquila.

5 R¹², se presente, é preferivelmente selecionado de nitro, CN, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, C₁-C₄-alquil-carbonila, C₁-C₄-alquil-tio, C₁-C₄-halo-alquil-tio, C₁-C₄-alquil-sulfonila, C₁-C₄-halo-alquil-sulfonila, (C₁-C₄-alquil)-amino, di(C₁-C₄-alquil)-amino, tri(C₁-C₄-alquil)-silila, -
10 CH=NO(C₁-C₄-alquil), -C(C₁-C₄-alquil)=NO(C₁-C₄-alquil), C₂-C₄-alquenila ou C₃-C₄-alquinila, ou dois radicais R¹² juntos com dois átomos de carbono adjacentes do anel fenila podem formar um radical de fórmula: (CH₂)₃, (CH₂)₄, O-CH₂-O, O(CH₂)₃ ou -CH=CH-CH=CH-. R¹², se presente, é mais preferivelmente selecionado de ciano, halogênio, em particular flúor ou cloro,
15 C₁-C₄-alquila, em particular metila, etila, n-propila, isopropila ou terc-butila, C₁-C₄-halo-alquila, em particular trifluoro-metila, difluoro-metila ou trifluoro-etila, C₁-C₄-alcoxila, em particular metoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, em particular trifluoro-metoxila, C₁-C₄-alquil-carbonila, em particular acetila, CONH₂, -CH=NOCH₃, -C(CH₃)=NOCH₃, -CH=NOCH₂CH₃, ou -
20 C(CH₃)=NOCH₂CH₃.

R¹⁶, se presente, é preferivelmente selecionado de metila, etila, trifluoro-metila, 2-fluoro-etila, 2,2-difluoro-etila ou 2,2,2-trifluoro-etila.

Muito mais preferivelmente R⁶ é fenila que traz um, dois ou três radicais R¹² como aqui definidos, em particular como dados nas linhas de
25 tabela A. Em tabela A, o prefixo indica a posição do anel fenila, na qual o radical R¹² está ligado.

Exemplos de Compostos preferidos são dados nas seguintes tabelas:

Tabela 1

Compostos de fórmula IaA, na qual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 2

5 Compostos de fórmula IaB, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 is cloro, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 3

10 Compostos de fórmula IaC, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 is cloro, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 4

15 Compostos de fórmula IaD, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 is cloro, R^3 é cloro, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 5

Compostos de fórmula IaE, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

20 Tabela 6

Compostos de fórmula IaF, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metoxila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 7

25 Compostos de fórmula IaG, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 8

Compostos de fórmula IaH, na qual R^1 , R^4 e R^5 são

hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metoxila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 9

Compostos de fórmula IaK, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 10

Compostos de fórmula IaL, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 11

Compostos de fórmula IaM, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, R^3 é metila, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 12

Compostos de fórmula IaN, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é $OCHF_2$, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 13

Compostos de fórmula IaP, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é $OCHF_2$, n é zero e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 14

Compostos de fórmula IbA, na qual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 15

Compostos de fórmula IbB, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é cloro, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz

1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 16

Compostos de fórmula IbC, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 17

Compostos de fórmula IbD, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, R^3 é cloro, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 18

Compostos de fórmula IbE, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 19

Compostos de fórmula IbF, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 20

Compostos de fórmula IbG, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 21

Compostos de fórmula IbH, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 22

Compostos de fórmula IbK, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 23

Compostos de fórmula IbL, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

5 Tabela 24

Compostos de fórmula IbM, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, R^3 é metila, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 25

10 Compostos de fórmula IbN, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 26

15 Compostos de fórmula IbP, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 27

20 Compostos de fórmula IcA, na qual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 28

Compostos de fórmula IcB, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é cloro, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

25 Tabela 29

Compostos de fórmula IcC, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 30

Compostos de fórmula IcD, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, R^3 é cloro, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 31

5 Compostos de fórmula IcE, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 32

10 Compostos de fórmula IcF, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 33

15 Compostos de fórmula IcG, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 34

Compostos de fórmula IcH, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

20 Tabela 35

Compostos de fórmula IcK, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 36

25 Compostos de fórmula IcL, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 37

Compostos de fórmula IcM, na qual R^1 , R^4 e R^5 são

hidrogênio, R^2 é metila, R^3 é metila, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 38

Compostos de fórmula IcN, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 39

Compostos de fórmula IcP, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é metoxila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 40

Compostos de fórmula IdA, na qual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

15 Tabela 41

Compostos de fórmula IdB, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é cloro, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 42

20 Compostos de fórmula IdC, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 43

25 Compostos de fórmula IdD, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, R^3 é cloro, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 44

Compostos de fórmula IdE, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1

ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 45

Compostos de fórmula IdF, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 46

Compostos de fórmula IdG, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 47

Compostos de fórmula IdH, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 48

Compostos de fórmula IdK, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 49

Compostos de fórmula IdL, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 50

Compostos de fórmula IdM, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, R^3 é metila, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 51

Compostos de fórmula IdN, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 52

Compostos de fórmula IdP, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é cloro e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

5 Tabela 53

Compostos de fórmula IeA, na qual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 54

10 Compostos de fórmula IeB, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é cloro, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 55

15 Compostos de fórmula IeC, na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 56

20 Compostos de fórmula IeD, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é cloro, R^3 é cloro, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 57

Compostos de fórmula IeE, na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

25 Tabela 58

Compostos de fórmula IeF, na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 59

Compostos de fórmula IeG , na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 60

5 Compostos de fórmula IeH , na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metoxila, R^3 é metoxila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 61

10 Compostos de fórmula IeK , na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 62

15 Compostos de fórmula IeL , na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é metila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 63

20 Compostos de fórmula IeM , na qual R^1 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é metila, R^3 é metila, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela 64

Compostos de fórmula IeN , na qual R^1 , R^2 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^3 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

25 Tabela 65

Compostos de fórmula IeP , na qual R^1 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio, R^2 é $OCHF_2$, n é um, R^7 é trifluoro-metila e R^6 é um anel fenila, que traz 1 ou 2 radicais R^{12} como definido nas linhas de Tabela A;

Tabela A

No.	R ¹²
1	2-F
2	3-F
3	4-F
4	2-F, 3-F
5	2-F, 4-F
6	3-F, 4-F
7	2-Cl
8	3-Cl
9	4-Cl
10	2-Cl, 3-Cl
11	2-Cl, 4-Cl
12	3-Cl, 4-Cl
13	2-CH ₃
14	3-CH ₃
15	4-CH ₃
16	2-CH ₃ , 3-CH ₃
17	2-CH ₃ , 4-CH ₃
18	3-CH ₃ , 4-CH ₃
19	2-C ₂ H ₅
20	3-C ₂ H ₅
21	4-C ₂ H ₅
22	2-C ₂ H ₅ , 3-C ₂ H ₅
23	2-C ₂ H ₅ , 4-C ₂ H ₅
24	3-C ₂ H ₅ , 4-C ₂ H ₅
25	2-CH ₂ CH ₂ CH ₃
26	3-CH ₂ CH ₂ CH ₃
27	4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
28	2-CH ₂ CH ₂ CH ₃ , 3-CH ₂ CH ₂ CH ₃
29	2-CH ₂ CH ₂ CH ₃ , 4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
30	3-CH ₂ CH ₂ CH ₃ , 4-CH ₂ CH ₂ CH ₃
31	2-CH(CH ₃) ₂
32	3-CH(CH ₃) ₂
33	4-CH(CH ₃) ₂
34	2-CH(CH ₃) ₂ , 3-CH(CH ₃) ₂
35	2-CH(CH ₃) ₂ , 4-CH(CH ₃) ₂
36	3-CH(CH ₃) ₂ , 4-CH(CH ₃) ₂
37	4-C(CH ₃) ₃
38	2-CF ₃
39	3-CF ₃
40	4-CF ₃
41	2-CF ₃ , 3-CF ₃
42	2-CF ₃ , 4-CF ₃
43	3-CF ₃ , 4-CF ₃
44	2-C ₂ F ₅
45	3-C ₂ F ₅
46	4-C ₂ F ₅
47	2-C ₂ F ₅ , 3-C ₂ F ₅

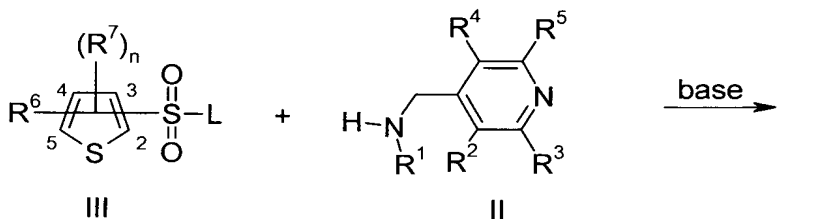
No.	R ¹²
48	2-C ₂ F ₅ , 4-C ₂ F ₅
49	3-C ₂ F ₅ , 4-C ₂ F ₅
50	2-OH
51	3-OH
52	4-OH
53	2-OH, 3-OH
54	2-OH, 4-OH
55	3-OH, 4-OH
56	2-OCH ₃
57	3-OCH ₃
58	4-OCH ₃
59	2-OCH ₃ , 3-OCH ₃
60	2-OCH ₃ , 4-OCH ₃
61	3-OCH ₃ , 4-OCH ₃
62	2-OCF ₃
63	3-OCF ₃
64	4-OCF ₃
65	2-OCF ₃ , 3-OCF ₃
66	2-OCF ₃ , 4-OCF ₃
67	3-OCF ₃ , 4-OCF ₃
68	2-OC ₂ F ₅
69	3-OC ₂ F ₅
70	4-OC ₂ F ₅
71	2-OC ₂ F ₅ , 3-OC ₂ F ₅
72	2-OC ₂ F ₅ , 4-OC ₂ F ₅
73	3-OC ₂ F ₅ , 4-OC ₂ F ₅
74	2-NO ₂
75	3-NO ₂
76	4-NO ₂
77	2-NO ₂ , 3-NO ₂
78	2-NO ₂ , 4-NO ₂
79	3-NO ₂ , 4-NO ₂
80	2-CN
81	3-CN
82	4-CN
83	2-CN, 3-CN
84	2-CN, 4-CN
85	3-CN, 4-CN
86	2-(CO-OCH ₃)
87	3-(CO-OCH ₃)
88	4-(CO-OCH ₃)
89	2-(CO-OC ₂ H ₅)
90	3-(CO-OC ₂ H ₅)
91	4-(CO-OC ₂ H ₅)
92	2-CHO
93	3-CHO
94	4-CHO
95	2-(CO-CH ₃)

No.	R ¹²
96	3-(CO-CH ₃)
97	4-(CO-CH ₃)
98	2-(CO-NH ₂)
99	3-(CO-NH ₂)
100	4-(CO-NH ₂)
101	2-[C(CH ₃)=N-OCH ₃]
102	3-[C(CH ₃)=N-OCH ₃]
103	4-[C(CH ₃)=N-OCH ₃]
104	2-[C(CH ₃)=N-OC ₂ H ₅]
105	3-[C(CH ₃)=N-OC ₂ H ₅]
106	4-[C(CH ₃)=N-OC ₂ H ₅]
107	2-SCH ₃
108	3-SCH ₃
109	4-SCH ₃
110	2-(SO ₂ -CH ₃)
111	3-(SO ₂ -CH ₃)
112	4-(SO ₂ -CH ₃)
113	2-(SO-CH ₃)
114	3-(SO-CH ₃)
115	4-(SO-CH ₃)
116	2-[N(CH ₃) ₂]
117	3-[N(CH ₃) ₂]
118	4-[N(CH ₃) ₂]
119	2-[Si(CH ₃) ₃]
120	3-[Si(CH ₃) ₃]
121	4-[Si(CH ₃) ₃]
122	2-F, 3-Cl
123	2-F, 4-Cl
124	2-F, 5-Cl
125	2-F, 6-Cl
126	3-F, 2-Cl
127	3-F, 4-Cl
128	3-F, 5-Cl
129	4-F, 2-Cl
130	4-F, 3-Cl
131	4-F, 2-CH ₃
132	4-Cl, 2-CH ₃
133	2-Cl, 4-OCH ₃
134	3-Cl, 4-OCH ₃
135	2-F, 4-OCH ₃
136	3-F, 4-OCH ₃
137	3,4 (O-CH ₂ -O)

Os Compostos I de acordo com a invenção podem ser preparados analogamente aos métodos descritos na técnica.

Vantajosamente, são obtidos a partir de derivados de piridina de fórmula II.

Um processo adequado para a preparação dos Compostos I compreende a reação dos Compostos II com ácidos sulfônicos ou derivados de ácido sulfônico de fórmula III, sob condições básicas como descrito no seguinte esquema de reação:



Nas fórmulas II e III, n e os radicais R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 e R^7 são como definidos acima. Em fórmula III, L é um grupo de saída adequado tal como hidroxila ou halogênio, preferivelmente cloro.

Esta reação é normalmente realizada em temperaturas de $(-30)^\circ\text{C}$ a 120°C , preferivelmente de $(-10)^\circ\text{C}$ a 100°C , em um solvente orgânico inerte na presença de uma base [cf. Lieb. An. Chem. 641 (1990)].

Solventes adequados incluem hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, ciclo-hexano e éter de petróleo, hidrocarbonetos aromáticos, tais como tolueno, o-, m- e p-xileno, hidrocarbonetos halogenados, tais como cloreto de metileno, clorofórmio e cloro-benzeno, éteres, tais como dietil-éter, diisopropil-éter, terc-butil-metil-éter, dioxano, anisol e tetra-hidro-furano, nitrilas, tais como acetonitrila e propionitrila, cetonas, tais como acetona, metil-etil-cetona, dietil-cetona e terc-butil-metil-cetona, e também dimetil-sulfóxido, dimetil-formamida e dimetil-acetamida, particularmente preferivelmente diisopropil-éter, dietil-éter e tetra-hidro-furano. Também é possível usar misturas dos solventes mencionados.

Bases adequadas são, em geral, Compostos inorgânicos, tais como hidróxidos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como hidróxido de lítio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio e hidróxido de cálcio, óxidos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, hidretos de

metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como hidreto de lítio, hidreto de sódio, hidreto de potássio e hidreto de cálcio, carbonatos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tal como bicarbonato de sódio, além do mais bases orgânicas, por exemplo aminas terciárias, tais como trimetil-amina, trietil-amina, triisopropil-etil-amina e N-metil-piperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetil-amino- piridina, e também aminas bicíclicas.

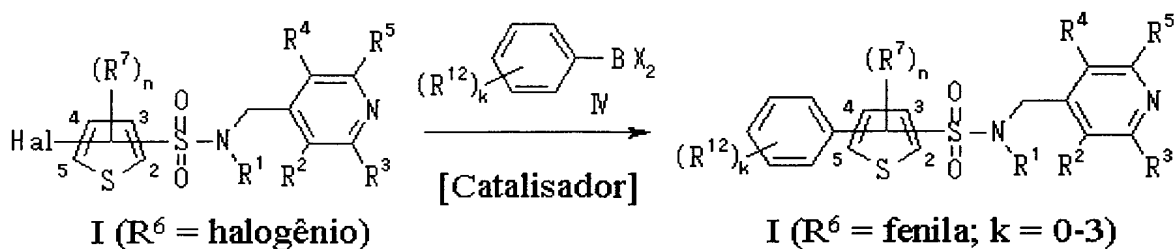
Preferência particular é dada a piridina, trietil-amina e carbonato de potássio.

As bases são geralmente empregadas em quantidades catalíticas; contudo, também podem ser empregadas em quantidades equimolares, em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os materiais iniciais são geralmente reagidos uns com os outros em quantidades equimolares.

Em termos de rendimento, pode ser vantajoso o uso de um excesso de II, baseado em III.

Compostos, nos quais R^6 é fenila opcionalmente substituída também podem ser preparados a partir de Compostos I, sendo que R^6 é halogênio, em particular bromo, por uma reação de copulação tal como uma copulação de Stille ou sob as condições de uma copulação de Suzuki, e.g. pela reação mostrada no seguinte esquema:



No esquema, as variáveis R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , e R^{12} são como definido acima. A variável k é 0,1, 2 ou 3. Hal é halogênio, em particular bromo. X em fórmula IV é OH ou C_1 - C_4 -alcoxila. Catalisador é um

catalisador de metal de transição, em particular um catalisador de Pd. Condições de reação podem ser tomadas dos exemplos de trabalho ou de Suzuki et al., Chem. Rev. 95, 2457-2483 (1995) e da literatura lá citada.

A reação de copulação é realizada sob as mesmas condições que as da condensação dos Compostos II e III.

A copulação de Suzuki de um composto I, no qual R⁶ é halogênio, com um derivado de ácido borônico IV ou um seu éster é normalmente realizada em temperaturas de 20°C a 180°C, preferivelmente de 40°C a 120°C, em um solvente orgânico inerte na presença de uma base e um metal platina, em particular um catalisador de platina [cf. Synth. Commun. Vol. 11, p. 513 (1981); Acc. Chem. Res. Vol. 15, pp. 178-184 (1982); Chem. Rev. Vol. 95, pp. 2457-2483 (1995); Organic Letters Vol. 6 (16), p. 2808 (2004); WO 2002/42275].

Catalisadores adequados são em particular tetraquis(trifenil-fosfina)paládio(0); cloreto de bis(trifenil-fosfina)paládio(II); cloreto de bis(acetonitril)paládio(II); complexo de [1,1'-bis(difenil-fosfino)ferroceno]-paládio(II) cloreto/cloreto de metileno (1:1); bis[bis-(1,2-difenil-fosfino)etano]paládio(0); cloreto de bis(bis-(1,2-difenil-fosfino)butano)-paládio(II); acetato de paládio(II); cloreto de paládio(II); e complexo de paládio(II) acetato/tri-*o*-tolil-fosfina; tris-*terc*-butil-fosfina / paládio-dibenzilideno-acetona.

Solventes adequados são hidrocarbonetos alifáticos, tais como pentano, hexano, ciclo-hexano e éter de petróleo, hidrocarbonetos aromáticos, tais como tolueno, *o*-, *m*- e *p*-xileno, éteres, tais como diisopropil-éter, *terc*-butil-metil-éter, dioxano, anisol e tetra-hidro-furano e dimetóxi-etano, cetonas, tais como acetona, metil-etil-cetona, dietil-cetona e *terc*-butil-metil-cetona, e também dimetil-sulfóxido, dimetil-formamida e dimetil-acetamida, particularmente preferivelmente éteres, tais como tetra-hidro-furano, dioxano e dimetóxi-etano. Também é possível o uso de misturas dos solventes

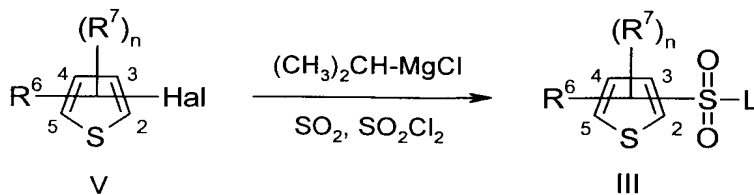
mencionados.

Bases adequadas são, em geral, Compostos inorgânicos, tais como óxidos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como óxido de lítio, óxido de sódio, óxido de cálcio e óxido de magnésio, carbonatos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como carbonato de lítio, carbonato de sódio, carbonato de potássio e carbonato de cálcio, e também bicarbonatos de metal alcalino, tal como bicarbonato de sódio, alcóxidos de metal alcalino e de metal alcalino-terroso, tais como metóxido de sódio, etóxido de sódio, etóxido de potássio e terc-butóxido de potássio, além do mais bases orgânicas, por exemplo aminas terciárias, tais como trimetil-amina, trietil-amina, triisopropil-etil-amina e N-metil-piperidina, piridina, piridinas substituídas, tais como colidina, lutidina e 4-dimetil-amino -piridina, e também aminas bicíclicas. Preferência particular é dada às bases tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio, carbonato de cézio, trietil-amina e bicarbonato de sódio.

As bases são geralmente empregadas em quantidades equimolares; contudo, também podem ser empregadas em excesso ou, se apropriado, como solvente.

Os materiais iniciais são geralmente reagidos uns com os outros em quantidades equimolares. Em termos de rendimento, também pode ser vantajoso o uso de um excesso de IV, baseado em I (R^6 sendo halogênio).

O intermediário III pode ser preparado a partir de respectivo haleto de piridila V pelo tratamento com halogeneto de alquil-magnésio tal como $(CH_3)_2CH-MgCl$, SO_2 e SO_2Cl_2 como mostrado no esquema abaixo.



Os materiais iniciais exigidos para preparar os Compostos I estão comercialmente disponíveis ou são conhecidos na técnica ou podem ser

preparados analogamente aos métodos descritos na técnica.

Por exemplo, Compostos de amino-metil-piridina de formula II na qual um ou mais dos radicais R^2 , R^3 , R^4 ou R^5 é/são diferentes de hidrogênio, tais como (halo)alcoxila, (halo)alquil-tio, (halo)alquila, alquenila, trialquil-silila ou alquinila, podem ser preparados partindo de halo-piridina-carbonitrilas pela substituição de um radical halogênio por um radical halogênio diferente, por reação de substituição nucleofílica convencional ou por uma reação de copulação, e.g. pelo tratamento com um nucleófilo adequado tal como $HNR'R''$, (halo)alcóxido, (halo)alquil-tio, um composto orgânico de metal, opcionalmente na presença de um catalisador de metal de transição, para obter a carbonitrila substituída correspondente [cf. *Journal of Medicinal Chemistry*, 22(11), 1284-90 (1979); US 4,558,134, *Synthesis* (6), 763-768 (1996) e *Heterocycles* 41(4), 675-88 (1995)], e hidrogenação subsequente do radical $C\equiv N$ para obter o composto de amino-metil-piridina II correspondente, no qual R^1 é hidrogênio [cf. *Heterocycles* 41(4), 675-88 (1995); *Recueil des Travaux Chimiques des Pays-Bas et de la Belgique* 52, 55-60 (1933); *Acta Poloniae Pharmaceutica* 32(3), 265-8 (1975); *Journal of Medicinal Chemistry* 24(1), 115-17 (1981), P 49173, *Heterocycles* 41(4), 675-88 (1995), *Angewandte Chemie, International Edition*, 43(37), 4902-4906 (2004); *Journal of Heterocyclic Chemistry* 19(6), 1551-2 (1982)]. A alquilação subsequente do nitrogênio de amino-metila dá Compostos, nos quais R^1 é diferente de hidrogênio.

As misturas reacionais são processadas na maneira costumeira, por exemplo por misturação com água, separação das fases e, se apropriado purificação cromatográfica dos produtos brutos. Alguns dos intermediários e produtos finais são obtidos na forma de óleos viscosos incolores ou ligeiramente amarronzados, que podem ser purificados ou liberados dos componentes voláteis sob pressão reduzida e em temperatura moderadamente elevada. Se os intermediários e os produtos finais são obtidos como sólidos,

purificação também pode ser realizada por recristalização ou digestão.

Os N-óxidos podem ser preparados a partir dos Compostos I de acordo com métodos de oxidação convencionais, por exemplo pelo tratamento das picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico I livres com um
5 perácido orgânico tal como ácido meta-cloro-perbenzóico [Journal of Medicinal Chemistry 38(11), 1892-903 (1995), WO 03/64572]; ou com agentes oxidantes inorgânicos tal como peróxido de hidrogênio [cf. Journal of Heterocyclic Chemistry 18(7), 1305-8 (1981)] ou oxona [cf. Journal of the
10 American Chemical Society 123(25), 5962-5973 (2001)]. A oxidação pode levar aos mono-N-óxidos puros ou a uma mistura de diferentes N-óxidos, que pode ser separada por métodos convencionais tal como cromatografia. Preferivelmente um ou dois dos nitrogênios de piridina em Compostos I são oxidados aos mono- ou bis-N-óxidos correspondentes.

Se Compostos I não puderem ser obtidos pelas rotas descritas
15 acima, também podem ser preparados por derivação de outros Compostos I.

Se a síntese der misturas de isômeros, uma separação será geralmente não necessariamente exigida porque em alguns casos os isômeros individuais podem ser interconvertidos durante o processamento para uso ou durante aplicação (por exemplo sob ação de luz, ácidos ou bases). Tais
20 conversões também podem ocorrer após o uso, por exemplo no tratamento de plantas na planta tratada, ou no fungo nocivo ou peste a ser controlado(a).

Os Compostos I são adequados como fungicidas. Podem ser distinguidos por eficácia excelente contra um espectro amplo de fungos fitopatogênicos, especialmente das classes de *Ascomicetos*, *Basidiomicetos*,
25 *Deuteromicetos* e *Peronosporomicetos* (sin. *Oomicetos*) e *Fungi imperfecti*. Alguns são sistemicamente eficazes e podem ser usados em proteção de colheita como fungicidas foliares, fungicidas para revestimento de sementes e fungicidas de solo.

São particularmente importantes no controle de uma multitude

de fungos sobre várias plantas cultivadas, tais como trigo, centeio, cevada, triticale, aveia, arroz, milho, gramínea, bananeiras, algodoeiro, feijões-soja, cafeeiro, cana-de-açúcar, videiras, plantas ornamentais e frutíferas, e hortaliças, tais como pepineiros, feijoeiros, tomateiros, batateiras e cucúrbitas, e sobre as sementes destas plantas. Também podem ser usados em colheitas que são tolerantes contra o ataque de insetos ou aplicações de herbicida devido à geração, incluindo métodos de engenharia genética. Além do mais, são adequados para controlar espécie *Botryosphaeria*, espécie *Cylindrocarpon*, *Eutypa lata*, *Neonectria liriodendri* e *Stereum hirsutum*, que atacam, inter alia, madeira ou as raízes de videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Alternaria* sobre hortaliças, colza, beterraba, fruta, arroz, feijões-soja e sobre batateiras (por exemplo, *A. solani* ou *A. alternata*) e tomateiros (por exemplo, *A. solani* ou *A. alternata*) e *Alternaria ssp.* (espiga preta) sobre trigo.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Aphanomyces* sobre beterraba e hortaliças.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Ascochyta* sobre cereais e hortaliças, por exemplo *Ascochyta tritici* (mancha foliar) sobre trigo.

Os Compostos I são adequados para controlar espécies *Bipolaris* e *Drechslera* sobre milho (por exemplo, *D. Maydis*), cereais, arroz e gramados.

Os Compostos I são adequados para controlar *Blumeria graminis* (míldio pulverulento) sobre cereais (por exemplo, trigo ou cevada).

Os Compostos I são adequados para controlar *Botrytis cinerea* (bolor cinza) sobre morangueiros, hortaliças, flores, videiras e trigo (míldio de espiga).

Os Compostos I são adequados para controlar *Bremia lactucae* sobre alface.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Cercospora* sobre milho, arroz, beterraba e, por exemplo, *Cercospora sojina* (mancha foliar) ou *Cercospora kikuchii* (mancha foliar) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Cladosporium*
5 *herbarum* (espiga preta) em trigo.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Cocliobolus* sobre milho, cereais (por exemplo, *Cocliobolus sativus*) e arroz (por exemplo, *Cocliobolus miyabeanus*).

Os Compostos I são adequados para controlar espécie
10 *Colletotricum* sobre algodoeiro e, por exemplo, *Colletotrichum truncatum* (*Antracnose*) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *corinespora cassiicola* (mancha foliar) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Dematofora*
15 *necatrix* (podridão da raiz/do caule) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Diaporthe phaseolorum* (doença do caule) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Drechslera*, espécie *Pirenofora* sobre milho, cereais, arroz e gramados, sobre
20 cevada (por exemplo, *D. teres*) e sobre trigo (por exemplo, *D. tritici-repentis*).

Os Compostos I são adequados para controlar *Esca* sobre videiras, causada por *Phaeoacremonium clamydosporium*, *Ph. Aleofilum*, e *Formitipora punctata* (*sin. Phellinus punctatus*).

Os Compostos I são adequados para controlar *Elsinoe*
25 *ampelina* sobre videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar *Epicoccum spp.* (espiga preta) sobre trigo.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Exserohilum* sobre milho.

Os Compostos I são adequados para controlar *Erysiphe cichoracearum* e *Sphaerotheca fuliginea* sobre pepineiros.

Os Compostos I são adequados para controlar espécies *Fusarium* e *Verticillium* sobre várias plantas: por exemplo, *F. graminearum* ou *F. culmorum* (podridão da raiz) sobre cereais (por exemplo, trigo ou cevada) ou, por exemplo, *F. oxysporum* sobre tomateiros e *Fusarium solani* (doença do caule) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Gaeumanomyces graminis* (negridão da raiz) sobre cereais (por exemplo, trigo ou cevada).

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Gibberella* sobre cereais e arroz (por exemplo *Gibberella fujikuroi*).

Os Compostos I são adequados para controlar *Glomerella cingulata* sobre videiras e outras plantas.

Os Compostos I são adequados para controlar *Grainstaining complexo* sobre arroz.

Os Compostos I são adequados para controlar *Guignardia budwelli* sobre videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Helminthosporium* sobre milho e arroz.

Os Compostos I são adequados para controlar *Isariopsis clavispora* sobre videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar *Macrofomina phaseolina* (podridão da raiz/do caule) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Microdochium nivale* (bolor branco) sobre cereais (por exemplo, trigo ou cevada).

Os Compostos I são adequados para controlar *Microsphaera diffusa* (míldio pulverulento) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie

Mycosphaerella sobre cereais, bananeiras e amendoins, tais como, por exemplo, *M. graminicola* sobre trigo ou *M. fijiensis* sobre bananeiras.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Peronospora* sobre repolho (por exemplo, *P. brassicae*), plantas bulbosas (por exemplo, *P. destructor*) e, por exemplo, *Peronospora manshurica* (míldio penugento) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Phakopsara pachyrhizi* (ferrugem da soja) e *Phakopsara meibomia* (ferrugem da soja) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Fialofora gregata* (doença do caule) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Fomopsis* sobre girassóis, videiras (por exemplo, *P. viticol*) e feijões-soja (por exemplo, *Fomopsis phaseoli*).

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Phytophthora* sobre various plantas, por exemplo, *P. capsici* sobre pimentões, *Phytophthora megasperma* (podridão do caule/da folha) sobre feijões-soja, *Phytophthora infestans* sobre batateiras e tomateiros.

Os Compostos I são adequados para controlar *Plasmopara viticola* sobre videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar *Podosphaera leucotricha* sobre macieiras.

Os Compostos I são adequados para controlar *Pseudocercospora herpotrichoides* (mancha ocular) sobre cereais (trigo ou cevada).

Os Compostos I são adequados para controlar *Pseudoperonospora* sobre várias plantas, por exemplo, *P. cubensis* sobre pepineiros ou *P. humili* sobre lúpulo.

Os Compostos I são adequados para controlar *Pseudopezicula*

tracheifilae sobre videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Puccinia* sobre várias plantas, por exemplo, *P. triticina*, *P. striiformis*, *P. hordei* ou *P. graminis* sobre cereais (por exemplo, trigo ou cevada), ou sobre aspargo (por exemplo, *P. asparagi*).

Os Compostos I são adequados para controlar *Piricularia oryzae*, *Corticium sasakii*, *Sarocladium oryzae*, *S. attenuatum*, *Pirenofora tritici-repentis* (mancha foliar) sobre trigo ou *Pirenofora teres* (mancha reticulada) sobre cevada.

Os Compostos I são adequados para controlar *Entyloma oryzae* sobre arroz.

Os Compostos I são adequados para controlar *Piricularia grisea* sobre gramados e cereais.

Os Compostos I são adequados para controlar *Pythium spp.* sobre gramados, arroz, milho, trigo, algodoeiro, colza, girassóis, beterraba, hortaliças e outras plantas (por exemplo, *P. ultimum* ou *P. aphanidermatum*).

Os Compostos I são adequados para controlar *Ramularia collo-cygni* (complexo de queimadura solar / *Ramularia* / manchas foliares fisiológicas) sobre cevada.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Rhizoctonia* sobre algodoeiro, arroz, batateiras, gramados, milho, colza, batateiras, beterraba, hortaliças e sobre várias plantas por exemplo, *Rhizoctonia solani* (podridão da raiz/do caule) sobre feijões-soja ou *Rhizoctonia cerealis* (mancha ocular acentuada) sobre trigo ou cevada.

Os Compostos I são adequados para controlar *Rhinchosporium secalis* sobre cevada (mancha foliar), centeio e triticle.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Sclerotinia* sobre colza e girassóis, e, por exemplo, *Sclerotinia sclerotiorum* (doença do caule) ou *Sclerotinia rolfsii* (doença do caule) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Septoria glycines* (mancha foliar) sobre feijões-soja.

Os Compostos I são adequados para controlar *Septoria tritici* (leaf septoria) e *Stagonospora nodorum* sobre trigo.

5 Os Compostos I são adequados para controlar *Erysiphe* (sin. *Uncinul*) *necator* sobre videiras.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Setospaeria* sobre milho e gramados.

10 Os Compostos I são adequados para controlar *Sphacelotheca reilinia* sobre milho.

Os Compostos I são adequados para controlar *Stagonospora nodorum* (septoria de espiga) sobre trigo.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Thievaliopsis* sobre feijões-soja e algodoeiro.

15 Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Tilletia* sobre cereais.

Os Compostos I são adequados para controlar *Typhula incarnata* (podridão branca) sobre trigo ou cevada.

20 Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Ustilago* sobre cereais, milho (por exemplo, *U. maydis*) e cana-de-açúcar.

Os Compostos I são adequados para controlar espécie *Venturia* (escabiose) sobre macieiras (por exemplo, *V. inaequalis*) e pereiras.

25 Os Compostos I também são adequados para controlar fungos nocivos na proteção de materiais (e.g. madeira, papel, dispersões de tinta, fibra ou tecidos) e na proteção de produtos armazenados. Como para a proteção de madeira, os seguintes fungos nocivos são dignos de nota: *Ascomycetes* tais como *Ofiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerofoma* spp., *Chaetomium* spp., *Hemicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp.; *Basidiomycetes* tais como *Coniofora* spp., *Coriolus* spp.,

Gloeophyllum spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. e *Tyromyces* spp., *Deuteromycetes* tais como *Aspergillus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicillium* spp., *Trichoderma* spp., *Alternaria* spp., *Paecilomyces* spp. e *Zygomycetes* tais como *Mucor* spp., e em adição na proteção de produtos armazenados os seguintes fungos de levedura são dignos de nota: *Candida* spp. e *Saccharomyces cerevisiae*.

Os Compostos I, seus N-óxidos ou seus sais são empregados pelo tratamento de fungos ou das plantas, sementes, materiais ou do solo a serem protegidos do ataque fúngico com uma quantidade fungicidamente eficaz dos Compostos ativos. A aplicação pode ser realizada tanto antes quanto depois da infecção dos materiais, plantas, sementes ou solo pelos fungos.

As composições fungicidas geralmente compreendem entre 0,1 e 95%, preferivelmente entre 0,5 e 90%, em peso de composto ativo. Os Compostos ativos são empregados em uma pureza de 90% a 100%, preferivelmente de 95% a 100% (de acordo com espectro de RMN).

Quando empregados na proteção de planta, as quantidades aplicadas estão, dependendo do tipo de efeito desejado, entre 0,01 e 2,0 kg de composto ativo por ha.

Em tratamento de semente, por exemplo por polvilhamento, revestimento ou banho da semente, quantidades de composto ativo de 1 a 1.000 g, preferivelmente de 5 a 100 g, por 100 quilograma de sementes são geralmente exigidas.

Quando usados na proteção de materiais ou produtos armazenados, a quantidade de composto ativo aplicada depende do tipo de área de aplicação e do efeito desejado. Quantidades costumeiramente aplicadas na proteção de materiais são, por exemplo, 0,001 g a 2 kg, preferivelmente 0,005 g a 1 kg, de composto ativo por metro cúbico de material tratado.

Em adição os Compostos de fórmula I também podem ser usados em culturas que podem tolerar ataque de insetos ou de fungos devido ao cultivo, incluindo engenharia genética.

Os Compostos de fórmula I são adicionalmente adequados para controlar eficazmente pestes das classes de insetos, aracnídeos e nematódeos. Podem ser usados como pesticidas em proteção de colheita e nos setores de higiene e de proteção de produtos armazenados e no setor veterinário.

Podem atuar por contato ou podem atuar no estômago, ou ter ação sistêmica ou residual. Ação por contato significa que a peste é morta ao entrar em contato com um composto I ou com material que libera composto I. Ação no estômago significa que a peste é morta se ingerir uma quantidade pesticidamente eficaz do composto I ou material contendo uma quantidade pesticidamente eficaz de composto I. Ação sistêmica significa que o composto é absorvido para dentro de tecidos da planta tratada e a peste é controlada, se ela comer o tecido da planta ou se sugar a seiva da planta.

Compostos I são em particular adequados para controlar as seguintes pestes inseto:

insetos da ordem de *Lepidoptera*, por exemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyrestia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirfis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grafolitha funebrana*, *Grafolitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*,

Leucoptera scitella, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinofora gossypiella*, *Peridroma saucia*,
 5 *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*,
Rhyacionia frustrana, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*,
Sparganothis pilleriana, *Spodoptera eridania*, *Spodoptera frugiperda*,
Spodoptera littoralis, *Spodoptera litura*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* e *Zeiraphera canadensis*,
 10

da ordem de *Coleoptera* (besouros), por exemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amfimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*,
 15 *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceuthorrhinchus assimilis*, *Ceuthorrhinchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12-punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*,
 20 *Hypera bruneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligetes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhinchus sulcatus*, *Otiorrhinchus ovatus*, *Phaedon cocleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*,
 25 *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* e *Sitophilus granaria*,

da ordem de *Diptera*, por exemplo *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*,

Contarinia sorghicola, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fania canicularis*, *Gasterofilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hil-emyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza*
 5 *sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*,
Lycoria pectoralis, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Forbia antiqua*,
Forbia brassicae, *Forbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*,
Tabanus bovinus, *Tipula oleracea* e *Tipula paludosa*,

10 da ordem de *Thysanoptera* (tripes), e.g. *Dichromothrips* spp.,
Frankliniella fusca, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*,
Scirtothrips citri, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* e *Thrips tabaci*,

formigas, abelhas, vespas, vespões da ordem de
 (Hymenoptera) e.g. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta cephalotes*, *Atta*
 15 *laevigata*, *Atta robusta*, *Atta capiguara*, *Atta sexdens*, *Atta texana*,
Crematogaster spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinaa*,
Monomorium pharaonis, *Solenopsis geminata*, e *Solenopsis invicta*,
Solenopsis richteri, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*,
Pogonomyrmex californicus, *Pheidole megacephala*, *Dasymutilla*
 20 *occidentalis*, *Bombus* spp. *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*,
Paravespula pensylvanica, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula*
maculata, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus*, e
Linepithema humile,

da ordem de *Homoptera*, e.g. *Acyrtosifon onobrychis*,
 25 *Adelges laricis*, *Afidula nasturtii*, *Afis craccivora*, *Afis fabae*, *Afis forbesi*, *Afis*
pomi, *Afis gossypii*, *Afis grossulariae*, *Afis schneideri*, *Afis spiraecola*, *Afis*
sambuci, *Acyrtosifon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisa tabaci*, *Bemisa*
argentifolii, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus*
persicae, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicorine brassicae*, *Capitoformus horni*,

Cerosipha gossypii, *Chaetosifon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmaniana*, *Dreyfusia piceae*, *Dysafis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysafis plantaginea*, *Dysafis piri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*,
 5 *Macrosiphum euforbiae*, *Macrosifon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanafis pirarius*, *Metopolofium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemfigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Forodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*,
 10 *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappafis mala*, *Sappafis mali*, *Schizafis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiand*, e *Viteus vitifolii*,

da ordem de *Isoptera* (cupins), e.g. *Calotermes flavicollis*, *Heterotermes aureus*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*,
 15 *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, aund *Termes natalensis*, e *Coptotermes formosanus*,

baratas (*Blattaria* - *Blattodea*), e.g. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, e *Blatta orientalis*,
 20 percevejos verdadeiros (*Hemiptera*), e.g. *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis*, *Thyanta perditor*, *Acyrtosifon onobrychis*,
 25 *Adelges laricis*, *Afidula nasturtii*, *Afis fabae*, *Afis forbesi*, *Afis pomi*, *Afis gossypii*, *Afis grossulariae*, *Afis schneideri*, *Afis spiraecola*, *Afis sambuci*, *Acyrtosifon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicorine brassicae*, *Capitoforus horni*, *Cerosipha gossypii*,

Chaetosifon fragaefolii, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmaniana*,
Dreyfusia piceae, *Dysafis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysafis*
plantaginea, *Dysafis piri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus*
lactucae, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euforbiae*, *Macrosifon rosae*,
5 *Megoura viciae*, *Melanafis pirarius*, *Metopolofium dirhodum*, *Myzus*
persicae, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-*
nigri, *Nilaparvata lugens*, *Pemfigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*,
Forodon humuli, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*,
Rhopalosiphum maidis, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*,
10 *Sappafis mala*, *Sappafis mali*, *Schizafis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*,
Sitobion avenae, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, *Viteus*
vitifolii, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma*
spp., e *Arilus critatus*,

grilos, gafanhotos, gafanhotos peregrinos da ordem de
15 (Ortoptera), e.g. *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*,
Calliptamus italicus, *Chortoicetes terminifera*, *Dociostaurus maroccanus*,
Forficula auricularia, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus daganensis*,
Kraussaria angulifera, *Locusta migratoria*, *Locustana pardalina*, *Melanoplus*
bivittatus, *Melanoplus femur-rubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus*
20 *sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Oedaleus*
senegalensis, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca*
peregrina, *Schistocerca gregaria*, *Stauronotus maroccanus* e, *Tachycines*
asinamorus, *Tachycines asinamorus*, *Zonozerus variegatus*.

Os Compostos de fórmula I e seus sais também são úteis para
25 controlar aracnídeos (*Arachnoidea*), tais como aracnídeos (*Acarina*), e.g. das
famílias *Argasidae*, *Ixodidae* e *Sarcoptidae*, tais como *Amblyomma*
americanum, *Amblyomma variegatum*, *Ambryomma maculatum*, *Argas*
persicus, *Boophilus anulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*,
Dermacentor silvarum, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*,

- Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*,
Ixodes holocyclus, *Ixodes pacificus*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros*
turicata, *Ornithonyssus bacoti*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*,
Dermanyssus gallinae, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus sanguineus*,
5 *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, e
Eriophyidae spp. tais como *Aculus sclechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* e
Eriophyes sheldoni; *Tarsonemidae* spp. tais como *Phytonemus pallidus* e
Polyphagotarsonemus latus; *Tenuipalpidae* spp. tais como *Brevipalpus*
foenicis; *Tetranychidae* spp. tais como *Tetranychus cinabarinus*, *Tetranychus*
10 *kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* e *Tetranychus urticae*,
Panonychus ulmi, *Panonychus citri*, e *oligonychus pratensis* e *Oligonychus*
pratensis; *Araneida*, e.g. *Latrodectus mactans*, e *Loxosceles reclusa*,
pulgas (*Sifonaptera*), e.g. *Ctenocephalides felis*,
Ctenocephalides canis, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*,
15 e *Nosopsyllus fasciatus*,
traça, tesourinha (*Thysanura*), e.g. *Lepisma saccharina* e
Thermobia domestica,
centopéias (*Chilopoda*), e.g. *Scutigera coleoptrata*,
miriápodes (*Diplopoda*), e.g. *Narceus spp.*,
20 lacrainhas (*Dermaptera*), e.g. *forficula auricularia*,
piolhos (*Phthiraptera*), e.g. *Pediculus humanus capitis*,
Pediculus humanus corporis, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*,
Haematopinus suis, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*,
Menacanthus straminaus e *Solenopotes capillatus*.
25 Os Compostos de fórmula I, seus N-óxidos e seus sais também
são úteis para controlar nematódeos, por exemplo, nematódeos das galhas,
e.g. *Meloidogine hapla*, *Meloidogine incognita*, *Meloidogine javanica*,
nematódeos formadores de cisto, e.g. *Globodera rostochiensis*, *Heterodera*
avenae, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*,

nematódeos de caule e folha, e.g. *Belonolaimus longicaudatus*, *Ditilenchus destructor*, *Ditilenchus dipsaci*, *Heliocotilenchus multicinctus*, *Longidorus elongatus*, *Radofolus similis*, *Rotilenchus robustus*, *Trichodorus primitivus*, *Tilenchorhynchus claytoni*, *Tilenchorhynchus dubius*, *Pratilenchus neglectus*,
 5 *Pratilenchus penetrans*, *Pratilenchus curvatus* e *Pratilenchus goodeyi*.

Compostos de fórmula I são particularmente úteis para controlar insetos da ordem *Lepidoptera*.

Em geral, as composições inseticidas incluem de 0,01 a 95% em peso, preferivelmente de 0,1 a 90% em peso, de composto ativo. Os
 10 Compostos ativos são empregados em uma pureza de 90% a 100%, preferivelmente de 95% a 100% (de acordo com espectro de RMN).

Sob condições externas, a taxa de aplicação de composto ativo para controlar pestes é de 0,1 a 2,0, preferivelmente de 0,2 a 1,0, kg/ha.

Os Compostos I, seus N-óxidos e sais podem ser convertidos
 15 em formulações costumeiras (formulações agrícolas), e.g. soluções, emulsões, suspensões, poeiras, pós, pastas e grânulos. A forma de aplicação depende do propósito intencionado particular; em cada caso, deve garantir uma distribuição fina e uniforme do composto de acordo com a invenção.

As formulações são preparadas em uma maneira conhecida,
 20 e.g. por diluição do ingrediente ativo com solventes e/ou veículos, se desejado usando emulsificadores e dispersantes. Solventes / auxiliares, que são adequados, são essencialmente:

- água, solventes aromáticos (por exemplo produtos Solvesso, xileno), parafinas (por exemplo frações minerais), alcoóis (por
 25 exemplo metanol, butanol, pentanol, benzil-álcool), cetonas (por exemplo ciclo-hexanona, gama-butirolactona), pirrolidonas (N-metil-pirrolidona, N-octil-pirrolidona), acetatos (diacetato de glicol), glicóis, dimetil-amidas de ácido graxo, ácidos graxos e ésteres de ácido graxo. Em princípio, misturas de solventes também podem ser usadas.

- veículos tais como minerais naturais moídos (e.g. caulins, argilas, talco, giz) e minerais sintéticos moídos (e.g. silicatos e sílica elevadamente dispersados); emulsificadores tais como emulsificadores não-iônicos e aniônicos (e.g. poloxietileno-álcool-graxo-éteres, alquil-sulfonatos e aril-sulfonatos) e dispersantes tais como licores residuais de lignina-sulfito e metil-celulose.

Tensoativos adequados são sais de metal alcalino, de metal alcalino-terroso e de amônio de ácido ligno-sulfônico, ácido naftaleno-sulfônico, ácido fenol-sulfônico, ácido dibutil-naftaleno-sulfônico, alquil-aril-sulfonatos, alquil-sulfatos, alquil-sulfonatos, sulfatos de álcool graxo, ácidos graxos e glicol-éteres de álcool graxo sulfatado, adicionalmente condensados de naftaleno sulfonado e derivados de naftaleno sulfonados com formaldeído, condensados de naftaleno ou de ácido naftaleno-sulfônico com fenol e formaldeído, polioxietileno-octil-fenol-éter, isooctil-fenol etoxilado, octil-fenol etoxilado, nonil-fenol etoxilado, alquil-fenil-poliglicol-éteres, tributil-fenil-poliglicol-éter, triestearil-fenil-poliglicol-éter, alquil-aril-poliéter-alcoóis, condensados de óxido de etileno / álcool e álcool graxo, óleo de rícino etoxilado, polioxietileno-alquil-éteres, polioxipropileno etoxilado, lauril-álcool-poliglicol-éter-acetal, ésteres de sorbitol, licores residuais de lignina-sulfito, e metil-celulose.

Substâncias que são adequadas para a preparação de soluções, emulsões, pastas ou dispersões oleosas diretamente pulverizáveis são frações de óleo mineral de ponto de ebulição médio a alto, tais como querosene ou óleo diesel, adicionalmente óleos de alcatrão de carvão e óleos de origem vegetal ou animal, hidrocarbonetos alifáticos, cíclicos e aromáticos, por exemplo tolueno, xileno, parafina, tetra-hidro-naftaleno, naftalenos alquilados ou seus derivados, metanol, etanol, propanol, butanol, ciclo-hexanol, ciclo-hexanona, isoforona, solventes fortemente polares, por exemplo dimetil-sulfóxido, N-metil-pirrolidona, e água.

Também agentes anticongelantes tais como glicerina, etileno-glicol e propileno-glicol podem ser adicionados na formulação.

Agentes antiespumantes adequados são, por exemplo, aqueles baseados em silicone ou estearato de magnésio.

5 Pós, materiais para espalhamento e poeiras podem ser preparados por misturação ou moagem concomitantes com as substâncias ativas como um veículo sólido.

 Grânulos, por exemplo grânulos revestidos, grânulos impregnados e grânulos homogêneos, podem ser preparados pela ligação de
10 ingredientes ativos em veículos sólidos. Exemplos de veículos sólidos são terras minerais tais como geles de sílica, silicatos, talco, caulim, attaclay, calcário, cal, giz, loesse, argila, dolomita, terra diatomácea, sulfato de cálcio, sulfato de magnésio, óxido de magnésio, materiais sintéticos moídos, fertilizantes, tais como, por exemplo, sulfato de amônio, fosfato de amônio,
15 nitrato de amônio, uréias, e produtos de origem vegetal, tais como farinha de cereal, farinha de casca de árvore, farinha de madeira, e farinha de casca de noz, pós de celulose e outros veículos sólidos.

 Formulações para o tratamento de semente podem adicionalmente compreender aglutinantes e/ou agentes gelificantes e, se
20 apropriado, colorantes.

 Aglutinantes também podem ser adicionados para aumentar a adesão dos Compostos ativos sobre a semente após o tratamento. Aglutinantes adequados são, por exemplo, copolímeros em bloco de EO/PO mas também poli(vinil-alcoóis), poli(vinil-pirrolidonas), poliacrilatos, polimetacrilatos,
25 polibutenos, poliisobutilenos, poliestirenos, poli(etileno-aminas), poli(etileno-amidas), poli(etileno-iminas) (Lupasol®, Polymin®), poliéteres, poliuretanos, poli(acetatos de vinila), tylose e copolímeros derivados destes polímeros.

 Um agente gelificante adequado é, por exemplo, carragenana (Satiagel®).

Em geral, as formulações compreendem de 0,01 a 95% em peso, preferivelmente de 0,1 a 90% em peso, de composto ativo. Os Compostos ativos são empregados em uma pureza de 90% a 100%, preferivelmente de 95% a 100% (de acordo com espectro de RMN).

5 As concentrações de composto ativo nas preparações prontas-para-uso podem variar dentro de faixas relativamente amplas. Em geral, estão entre 0,0001 e 10%, preferivelmente entre 0,01 e 1%.

Os Compostos ativos também podem ser usados com sucesso grande em processo de volume ultra-baixo (ULV), sendo possível aplicar
10 formulações com mais do que 95% em peso de composto ativo ou até mesmo composto ativo sem aditivos

Para o tratamento de semente, as formulações em questão dão, após diluição dupla ou décupla, concentrações de composto ativo de 0,01 a 60% em peso, preferivelmente de 0,1 a 40% em peso, nas preparações
15 prontas-para-uso.

Os seguintes são exemplos de formulações:

1. Produtos para diluição com água:

A) Concentrados solúveis em água(SL, LS):

10 partes em peso de um composto I de acordo com a
20 invenção são dissolvidas em 90 partes em peso de água ou em um solvente solúvel em água. Como uma alternativa, agentes umectantes ou outros auxiliares são adicionados. O composto ativo se dissolve sob diluição com água. Nesta maneira, é obtida uma formulação tendo um teor de 10% em peso de composto ativo.

25 B) Concentrados dispersáveis (DC)

20 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são dissolvidas em 70 partes em peso de ciclo-hexanona com adição de 10 partes em peso de um dispersante, por exemplo poli(vinil-pirrolidona). Diluição com água dá uma dispersão. O teor de composto ativo é 20% em

peso.

C) Concentrados emulsificáveis (EC)

15 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são dissolvidas em 75 partes em peso de xileno com adição de dodecil-benzeno-sulfonato de cálcio e etoxilato de óleo de rícino (em cada caso concentração de 5%). Diluição com água dá uma emulsão. A formulação tem um teor de composto ativo de 15% em peso.

D) Emulsões (EW, EO, ES)

25 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são dissolvidas em 35 partes em peso de xileno com adição de dodecil-benzeno-sulfonato de cálcio e etoxilato de óleo de rícino (em cada caso concentração de 5%). Esta mistura é introduzida em 30 partes em peso de água por meio de uma máquina emulsificadora (Ultraturrax) e transformada em uma emulsão homogênea. Diluição com água dá uma emulsão. A formulação tem um teor de composto ativo de 25% em peso.

E) Suspensões (SC, OD, FS)

Em um moinho de bolas agitado, 20 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são cominuídas com a adição de 10 partes em peso de dispersantes, agentes umectantes e 70 partes em peso de água ou um solvente orgânico para dar uma suspensão fina de composto ativo. Diluição com água dá uma suspensão estável do composto ativo. O teor de composto ativo na formulação é de 20% em peso.

F) Grânulos dispersáveis em água e grânulos solúveis em água (WG, SG)

50 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são finamente moídas com adição de 50 partes em peso de dispersantes e agentes umectantes e preparadas como grânulos dispersáveis em água e grânulos solúveis em água por meio de equipamentos técnicos (por exemplo extrusão, torre de pulverização, leito fluidizado). Diluição com água

dá uma dispersão ou solução estável do composto ativo. A formulação tem um teor de composto ativo de 50% em peso.

G) Pós dispersáveis em água e pós solúveis em água (WP, SP, SS, WS)

5 75 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são moídas em um moinho de rotor-estator com a adição de 25 partes em peso de dispersantes, agentes umectantes e gel de sílica. Diluição com água dá uma dispersão ou solução estável de composto ativo. O teor de composto ativo da formulação é 75% em peso.

10 H) Gel (GF)

Em um moinho de bolas agitado, 20 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são cominuídas com adição de 10 partes em peso de dispersantes, 1 parte em peso de um agente gelificante umectantes e 70 partes em peso de água ou de um solvente orgânico para dar
15 uma suspensão fina do composto ativo. Diluição com água dá uma suspensão estável do composto ativo, por meio da qual é obtida uma formulação com 20% (p/p) de composto ativo.

2. Produtos a serem aplicados não-diluídos

J) Pós capazes de serem transformados em poeiras (DP, DS)

20 5 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são moídas finamente e misturadas intimamente com 95% de caulim finamente dividido. Isto dá um produto capaz de ser transformado em poeira tendo um teor de composto ativo de 5% em peso.

K) Grânulos (GR, FG, GG, MG)

25 0,5 parte em peso de um composto I de acordo com a invenção é moída finamente e associada com 99,5% de veículos. Métodos correntes são extrusão, secagem por pulverização ou o leito fluidizado. Isto dá grânulos a serem aplicados não diluídos, tendo um teor de composto ativo de 0,5% em peso.

L) Soluções ULV (UL)

10 partes em peso de um composto I de acordo com a invenção são dissolvidas em 90 partes em peso de um solvente orgânico, por exemplo xileno. Isto dá um produto a ser aplicado não diluído tendo um teor de composto ativo de 10% em peso.

Concentrados solúveis em água (LS), suspensões (FS), poeiras (DS), pós dispersáveis em água e pós solúveis em água (WS, SS), emulsões (ES), concentrados emulsificáveis (EC) e formulações de gel (GF) são normalmente usados para o tratamento de semente. Estas formulações podem ser aplicadas na semente não diluídas ou, preferivelmente, na forma diluída. A aplicação pode ser realizada antes da semeadura.

Os ingredientes ativos podem ser usados como tais, na forma de suas formulações ou nas formas de uso preparadas dos mesmos, e.g. na forma de soluções, pós, suspensões ou dispersões diretamente pulverizáveis, emulsões, dispersões oleosas, pastas, produtos capazes de serem transformados em poeira, materiais para espalhamento, ou grânulos, por meio de pulverização, atomização, polvilhamento, espalhamento, ou derramamento. As formas de uso dependem inteiramente dos propósitos intencionados; são intencionadas para garantir em cada caso a distribuição mais fina possível dos ingredientes ativos de acordo com a invenção.

Formas de uso aquosas podem ser preparadas a partir de concentrados de emulsão, pastas ou pós umectáveis (pós, dispersões oleosas pulverizáveis) pela adição de água. Para preparar emulsões, pastas ou dispersões oleosas, as substâncias, como tais ou dissolvidas em um óleo ou solvente, podem ser homogeneizadas em água por meio de um umectante, agente de pegajosidade, dispersante ou emulsificador. Alternativamente, é possível preparar concentrados Compostos de substância ativa, umectante, agente de pegajosidade, dispersante ou emulsificador e, se apropriado, solvente ou óleo, e tais concentrados são adequados para diluição com água.

As concentrações de ingrediente ativo nos produtos prontos-para-uso podem ser variadas dentro de faixas relativamente amplas. Em geral, são de 0,0001 a 10%, preferivelmente de 0,01 a 1%.

Os ingredientes ativos também podem ser usados com sucesso em processo de volume ultra-baixo (ULV), sendo possível aplicar formulações compreendendo mais de 95% em peso de ingrediente ativo, ou até mesmo aplicar o ingrediente ativo sem aditivos.

Vários tipos de óleos, umectantes, adjuvantes, herbicidas, fungicidas, outros pesticidas, ou bactericidas podem ser adicionados nos Compostos ativos, se apropriado não até imediatamente antes do uso (misturação em tanque). Estes agentes podem ser misturados com os agentes de acordo com a invenção em uma razão em peso de 1:100 a 100:1, preferivelmente 1:10 a 10:1.

As composições de acordo com a invenção, na forma de uso como fungicidas, também estão presentes juntas com Compostos ativos, e.g. com herbicidas, inseticidas, reguladores de crescimento, fungicidas ou então com fertilizantes. Misturação dos Compostos I ou das composições compreendendo-os na forma de uso como fungicidas com um ou mais outros fungicidas resulta em muitos casos em uma expansão do espectro de atividade fungicida ou evitação de desenvolvimento de resistência sendo obtidas.

Em muitos casos, efeitos sinérgicos são obtidos.

A presente invenção adicionalmente proporciona uma combinação de pelo menos um composto de acordo com a invenção e/ou um seu sal agriculturalmente aceitável e pelo menos um outro composto ativo fungicida, inseticida, herbicida e/ou regulador de crescimento.

A seguinte lista de fungicidas com os quais os Compostos de acordo com a invenção podem ser aplicados juntos significa ilustração das combinações possíveis, mas não os limita:

estrobilurinas

- azoxistrobina, di moxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, cresoxim-metil, metominostrobrina, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina, orisastrobina, (2-cloro-5-[1-(3-metil-benzil-óxi-imino)-etil]-benzil)-carbamato de metila, (2-cloro-5-[1-(6-metil-piridin-2-il-metóxi-imino)-etil]-benzil)-carbamato de metila, 2-(orto-(2,5-dimetil -fenil-óxi-metileno)-fenil)-3-metóxi-acrilato de metila;

carboxamidas

- carboxanilidas: benalaxil, benodanil, boscalida, carboxina, mepronil, fenfuram, fenex amida, flutolanil, furametpir, metalaxil, ofurace, oxadixil, oxicarboxina, pentiopirade, ti fluzamida, tiadinil, N-(4'-bromo-bifenil-2-il)-4-difluoro-metil-2-metil-tiazol-5-carboxamida, N-(4'-trifluor o-metil-bifenil-2-il)-4-difluoro-metil-2-metil-tiazol-5-carboxamida, N-(4'-cloro-3'-fluoro-bifenil-2-il)-4-difluoro-metil-2-metil-tiazol-5-carboxamida, N-(3',4'-di cloro-4-fluoro-bifenil-2-il)-3-difluoro-metil-1-metil-pira zol-4-carboxamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluro-bifenil-2-il)-3-difluoro-metil-1-metil-pirazol-4-carboxamida, N-(2-ciano-fenil)-3,4-dicloro -isotiazol-5-carboxamida;

- morfolidas de ácido carboxílico: dimetomorf, flumorf;

- benzamidas: flumetover, fluopicolida (picobenzamid), zoxamida;

- outras carboxamidas: carpropamid, diclocimet, mandipropamid, N-(2-(4-[3-(4-cloro fenil)-prop-2-inil-óxi]-3-metóxi-fenil)etil)-2-metano-sulfo nil-amino-3-metil-butiramida, N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)prop-2-inil-óxi]-3-metóxi-fenil)-etil)-2-etano-sulfonil-amino-3-metil-butiramida;

azóis

- triazóis: biterta nol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, enilconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, fluquinconazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol,

metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimenol, triadimefon, triticonazol;

- imidazóis: ciazofamid, imazalil, pefurazoato, procloraz, triflumizol;

5 - benzimidazóis: benomil, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol;

- outros: etaboxam, etridiazol, himexazol;

Compostos de heterociclila nitrogenados

10 - piridinas: fluazinam, pirifenox, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina;

- pirimidinas: bupirimato, ciprodinil, ferinzona, fenarimol, mepanipirim, nuarimol, pirimetanil;

- piperazinas: triforina;

- pirróis: fludioxonil, fempiclonil;

15 - morfolinas: aldimorf, dodemorf, fempropimorf, tridemorf;

- dicarboximidas: iprodiona, procimidona, vinclozolina;

- outros: acibenzolar-S-metil, anilazina, captan, captafol, dazo-met, diclomezina, fenoxanil, folpet, fempropidin, famoxadona, fenamidona, octilinona, probenazol, proquinazid, piroquilon, quinoxifeno,

20 triciclazol, 5-cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 6-(3,4-dicloro-fenil)-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 6-(4-terc-butil-fenil)-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-metil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-metil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-etil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-2,7-diamina, 6-etil-5-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-etil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-etil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 6-octil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-metóxi-metil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 6-

octil-5-trifluoro-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 5-trifluoro-metil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina, 2-butóxi-6-iodo-3-propil -cromen-4-ona, N, N-dimetil-3-(3-bromo-6-fluoro-2-metil-indol-1-sulfonil)-[1,2,4]triazol-1-sulfonamida;

- 5 carbamatos e ditiocarbamatos
 - ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metiram, metam, propineb, tiram, zineb, ziram;
 - carbamatos: dietofencarb, flubentiavalicarb, iprovalicarb, propamocarb, 3-(4-cloro-fenil)-3-(2-isopropóxi-carbonil-amino-3-metil-butiril-amino)-propionato de metila, N-(1-(1-(4-ciano-fenil)-etano-sulfonil)-but-2-il)-carbamato de 4-fluoro-fenila;
- 10 outros fungicidas
 - guanidinas: dodina, iminoctadina, guazatina;
 - antibióticos: casugamicina, polioxinas, estreptomicina, validamicinaA;
- 15 - Compostos organo-metálicos: sais de fentin (sais de trifenil-estanho);
 - Compostos de heterociclila contendo enxofres: isoprotiolano, ditionon;
- 20 - Compostos organofosforados: edifenfos, fosetil, fosetil-alumínio, iprobenfos, pirazofos, tolclofos-metil, ácido fosforoso e seus sais;
 - Compostos organocloro: tiofanato-metil, clorotalonil, diclo-fluanid, tolilfluanid, flusulfamida, ftalida, hexacloro-benzeno, pencicuron, quintozeno;
- 25 - derivados de nitro-fenila: binapacrila, dinocap, dinobuton;
 - Compostos inorgânicos ativos: mistura Bordeaux, acetato de cobre, hidróxido de cobre, óxi-cloreto de cobre, sulfato de cobre básico, enxofre;
 - outros: espiroxamina, ciflufenamida, cimoxanil,

metrafenona.

Conseqüentemente, a presente invenção adicionalmente se refere às composições listadas em tabela B, onde uma linha de Tabela B corresponde em cada caso a uma composição fungicida compreendendo um composto de fórmula I (componente 1), que é preferivelmente um dos Compostos aqui descritos como sendo preferidos, e o outro respectivo composto ativo (componente 2) enunciado na linha em questão.

Tabela B

Linha	Componente 1	Componente 2
B-1	um composto de fórmula I	azoxistrobina
B-2	um composto de fórmula I	dimoxistrobina
B-3	um composto de fórmula I	enestroburina
B-4	um composto de fórmula I	fluoxastrobina
B-5	um composto de fórmula I	cresoxim-metil
B-6	um composto de fórmula I	metomino strobina
B-7	um composto de fórmula I	picoxistrobina
B-8	um composto de fórmula I	piraclostrobina
B-9	um composto de fórmula I	trifloxistrobina
B-10	um composto de fórmula I	orisastrobina
B-11	um composto de fórmula I	(2-cloro-5-[1-(3-metil-benzil-óxi-imino)-etil]-benzil)-carbamato de metila
B-12	um composto de fórmula I	(2-cloro-5-[1-(6-metil-piridin-2-il metóxi-imino)-etil]-benzil)-carbamato de metila
B-13	um composto de fórmula I	2-(orto-(2,5-dimetil-fenil-óxi-metileno)-fenil)-3-metóxi-acrilato de metila
B-14	um composto de fórmula I	benalaxil
B-15	um composto de fórmula I	benodanil
B-16	um composto de fórmula I	boscalida
B-17	um composto de fórmula I	carboxina
B-18	um composto de fórmula I	mepronil
B-19	um composto de fórmula I	fenfuram
B-20	um composto de fórmula I	fenexamida
B-21	um composto de fórmula I	flutolanil
B-22	um composto de fórmula I	furametpir
B-23	um composto de fórmula I	metalaxil
B-24	um composto de fórmula I	ofurace
B-25	um composto de fórmula I	oxadixil
B-26	um composto de fórmula I	óxi-carboxina
B-27	um composto de fórmula I	pentiopirad
B-28	um composto de fórmula I	tifluzamida
B-29	um composto de fórmula I	tiadinil
B-30	um composto de fórmula I	N-(4'-bromo-bifenil-2-il)-4-difluoro-metil-2-metil-tiazol-5-carboxamida
B-31	um composto de fórmula I	N-(4'-trifluoro-metil-bifenil-2-il)-4-di fluoro-metil-2-metil-tiazol-5-carboxamida
B-32	um composto de fórmula I	N-(4'-cloro-3'-fluoro-bifenil-2-il)-4-di fluoro-metil-2-metil-tiazol-5-carboxamida

Linha	Componente 1	Componente 2
B-33	um composto de fórmula I	N-(3',4'-dicloro-4-fluoro-bifenil-2-il)-3-di fluoro- metil-1-metil-pirazol-4-carboxamida
B-34	um composto de fórmula I	N-(3',4'-dicloro-5-fluoro-bifenil-2-il)-3-di fluoro- metil-1-metil-pirazol-4-carboxamida
B-35	um composto de fórmula I	N-(2-ciano-fenil)-3,4-dicloro-isotiazol-5- carboxamida
B-36	um composto de fórmula I	dimetomorf
B-37	um composto de fórmula I	flumorf
B-38	um composto de fórmula I	flumetover
B-39	um composto de fórmula I	fluopicolida (picobenzamid)
B-40	um composto de fórmula I	zoxamida
B-41	um composto de fórmula I	carpropamida
B-42	um composto de fórmula I	diclocimet
B-43	um composto de fórmula I	mandipropamida
B-44	um composto de fórmula I	N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-inil-óxi]-3-metóxi- fenil)etil)-2-metano-sulfonil-amino-3-metil- butiramida
B-45	um composto de fórmula I	N-(2-(4-[3-(4-cloro-fenil)-prop-2-inil-óxi]-3-metóxi- fenil)-etil)-2-etano-sulfonil-amino-3-metil- butiramida
B-46	um composto de fórmula I	bitertanol
B-47	um composto de fórmula I	bromuconazol
B-48	um composto de fórmula I	cyproconazol
B-49	um composto de fórmula I	difenoconazol
B-50	um composto de fórmula I	diniconazol
B-51	um composto de fórmula I	enilconazol
B-52	um composto de fórmula I	epoxiconazol
B-53	um composto de fórmula I	fembuconazol
B-54	um composto de fórmula I	flusilazol
B-55	um composto de fórmula I	fluquinconazol
B-56	um composto de fórmula I	flutriafol
B-57	um composto de fórmula I	hexaconazol
B-58	um composto de fórmula I	imibenconazol
B-59	um composto de fórmula I	ipconazol
B-60	um composto de fórmula I	metconazol
B-61	um composto de fórmula I	miclobutanil
B-62	um composto de fórmula I	penconazol
B-63	um composto de fórmula I	propiconazol
B-64	um composto de fórmula I	protioconazol
B-65	um composto de fórmula I	simeconazol
B-66	um composto de fórmula I	tebuconazol
B-67	um composto de fórmula I	tetraconazol
B-68	um composto de fórmula I	triadi menol
B-69	um composto de fórmula I	triadimefon
B-70	um composto de fórmula I	triticonazol
B-71	um composto de fórmula I	ciazofamid
B-72	um composto de fórmula I	imazalil
B-73	um composto de fórmula I	pefurazoato
B-74	um composto de fórmula I	procloraz
B-75	um composto de fórmula I	triflumizol
B-76	um composto de fórmula I	benomil
B-77	um composto de fórmula I	carbendazim
B-78	um composto de fórmula I	fuberidazol

Linha	Componente 1	Componente 2
B-79	um composto de fórmula I	tiabendazol
B-80	um composto de fórmula I	etaboxam
B-81	um composto de fórmula I	etridiazol
B-82	um composto de fórmula I	himexazol
B-83	um composto de fórmula I	fluazinam
B-84	um composto de fórmula I	pirifenox
B-85	um composto de fórmula I	3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazo-4-il]piridina lidin-3-il
B-86	um composto de fórmula I	bupirimato
B-87	um composto de fórmula I	ciprodinil
B-88	um composto de fórmula I	ferinzone
B-89	um composto de fórmula I	fenarimol
B-90	um composto de fórmula I	mepanipirim
B-91	um composto de fórmula I	nuarimol
B-92	um composto de fórmula I	pirimetanil
B-93	um composto de fórmula I	triforine
B-94	um composto de fórmula I	fludioxonil
B-95	um composto de fórmula I	fempiclonil
B-96	um composto de fórmula I	aldimorf
B-97	um composto de fórmula I	dodemorf
B-98	um composto de fórmula I	fempropimorf
B-99	um composto de fórmula I	tridemorf
B-100	um composto de fórmula I	iprodione
B-101	um composto de fórmula I	procimidona
B-102	um composto de fórmula I	vinclozolin
B-103	um composto de fórmula I	acibenzolar-S-metil
B-104	um composto de fórmula I	anilazin
B-105	um composto de fórmula I	captan
B-106	um composto de fórmula I	captafol
B-107	um composto de fórmula I	dazo-met
B-108	um composto de fórmula I	diclomezina
B-109	um composto de fórmula I	fenoxanil
B-110	um composto de fórmula I	folpet
B-111	um composto de fórmula I	fempropidin
B-112	um composto de fórmula I	famoxadona
B-113	um composto de fórmula I	fenamidona
B-114	um composto de fórmula I	octilinona
B-115	um composto de fórmula I	probenazol
B-116	um composto de fórmula I	proquinazid
B-117	um composto de fórmula I	piroquilon
B-118	um composto de fórmula I	quinoxifeno
B-119	um composto de fórmula I	triciclazol
B-120	um composto de fórmula I	5-cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina
B-121	um composto de fórmula I	6-(3,4-dicloro-fenil)-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-122	um composto de fórmula I	6-(4-terc-butil-fenil)-5-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-123	um composto de fórmula I	5-metil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-124	um composto de fórmula I	5-metil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-125	um composto de fórmula I	5-etil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina-2,7-

Linha	Componente 1	Componente 2
		diamina
B-126	um composto de fórmula I	6-etil-5-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-127	um composto de fórmula I	5-etil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-128	um composto de fórmula I	5-etil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-129	um composto de fórmula I	6-octil-5-propil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-130	um composto de fórmula I	5-metóxi-metil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-131	um composto de fórmula I	6-octil-5-trifluoro-metil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-132	um composto de fórmula I	5-trifluoro-metil-6-(3,5,5-trimetil-hexil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-il-amina
B-133	um composto de fórmula I	2-butóxi-6-iodo-3-propil-cromeno-4-ona
B-134	um composto de fórmula I	N,N-dimetil-3-(3-bromo-6-fluoro-2-metilindole-1-sulfonil)-[1,2,4]triazol-1-sulfonamida
B-135	um composto de fórmula I	ferbam
B-136	um composto de fórmula I	mancozeb
B-137	um composto de fórmula I	maneb
B-138	um composto de fórmula I	metiram
B-139	um composto de fórmula I	metam
B-140	um composto de fórmula I	propineb
B-141	um composto de fórmula I	tiram
B-142	um composto de fórmula I	zineb
B-143	um composto de fórmula I	ziram
B-144	um composto de fórmula I	dietofencarb
B-145	um composto de fórmula I	flubentiavalicarb
B-146	um composto de fórmula I	iprovalicarb
B-147	um composto de fórmula I	propamocarb
B-148	um composto de fórmula I	3-(4-cloro-fenil)-3-(2-isopropóxi-carbonil-amino-3-metil-butilil-amino)-propionato de metila
B-149	um composto de fórmula I	N-(1-(1-(4-ciano-fenil)-etano-sulfonil)-but-2-il)-carbamato de 4-fluoro-fenila
B-150	um composto de fórmula I	dodina
B-151	um composto de fórmula I	iminocadina
B-152	um composto de fórmula I	guazatine
B-153	um composto de fórmula I	casugamicina
B-154	um composto de fórmula I	polioxina
B-155	um composto de fórmula I	estreptomicina
B-156	um composto de fórmula I	validamicina A
B-157	um composto de fórmula I	sais de fentin (sais de trifenil-estanho)
B-158	um composto de fórmula I	isoprotiolano
B-159	um composto de fórmula I	ditianon
B-160	um composto de fórmula I	edifenfos
B-161	um composto de fórmula I	fosetil
B-162	um composto de fórmula I	fosetil-alumínio
B-163	um composto de fórmula I	iprobefos
B-164	um composto de fórmula I	pirazofos
B-165	um composto de fórmula I	tolclofos-metil
B-166	um composto de fórmula I	ácido fosforoso e seus sais

Linha	Componente 1	Componente 2
B-167	um composto de fórmula I	tiofanato metil
B-168	um composto de fórmula I	clorotalonil
B-169	um composto de fórmula I	diclo-fluanid
B-170	um composto de fórmula I	tolilfluanid
B-171	um composto de fórmula I	flusulfamida
B-172	um composto de fórmula I	ftalida
B-173	um composto de fórmula I	hexacloro-benzeno
B-174	um composto de fórmula I	pencicuron
B-175	um composto de fórmula I	quintozeno
B-176	um composto de fórmula I	binapacril
B-177	um composto de fórmula I	dinocap
B-178	um composto de fórmula I	dinobuton
B-179	um composto de fórmula I	mistura Bordeaux
B-180	um composto de fórmula I	acetato de cobre
B-181	um composto de fórmula I	hidróxido de cobre
B-182	um composto de fórmula I	óxi-cloreto de cobre
B-183	um composto de fórmula I	sulfato de cobre básico
B-184	um composto de fórmula I	enxofre
B-185	um composto de fórmula I	espiroxamina
B-186	um composto de fórmula I	ciflufenamida
B-187	um composto de fórmula I	cimoxanil
B-188	um composto de fórmula I	metrafenona

Os Compostos ativos II, acima mencionados como componente 2, sua preparação e sua ação contra fungos nocivos são geralmente conhecidos (cf.: <http://www.hclrss.demon.co.uk/index.html>); estão comercialmente disponíveis. Os Compostos nomeados de acordo com IUPAC, sua preparação e sua ação fungicida são igualmente conhecidos [cf. EP-A 226.917; EP-A 10.28.125; EP-A 10.35.122; EP-A 12.01.648; WO 98/46608; WO 99/24413; WO 03/14103; WO 03/053145; WO 03/066609; WO 04/049804 e WO 07/012598].

Composições desta invenção também podem conter outros ingredientes ativos, por exemplo outros pesticidas tais como inseticidas e herbicidas, fertilizantes tais como tais como nitrato de amônio, uréia, potassa, e superfosfato, agentes fitotóxicos e reguladores de crescimento de planta, protetores e nematicidas. Estes ingredientes adicionais podem ser usados sequencialmente ou em combinação com as composições descritas acima, se apropriado também adicionados imediatamente antes do uso (misturação em tanque). Por exemplo, a(s) planta(s) pode(m) ser pulverizada(s) com uma composição desta invenção quer antes quer após ser(em) tratada(s) com

outros ingredientes ativos.

Estes agentes podem ser misturados com os agentes usados de acordo com a invenção em uma razão em peso de 1:100 a 100:1.

A seguinte lista de pesticidas juntos com os quais os
5 Compostos de acordo com a invenção podem ser usados, é intencionada para ilustrar as combinações possíveis, mas não impõe qualquer limitação:

A.1. Organo(tio)fosfatos: e.g. acefato, azametifos, azinfos-
metil, clorpirifos, clorpirifos-metil, clorfenvinfos, diazinon, diclorvos,
dicrotofos, dimetoato, disulfoton, etion, fenitroton, fention, isoxation,
10 malation, metamidofos, metidation, metil-paration, mevinfos, monocrotofos, oxidemeton-metila, paraoxon, paration, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidon, forato, foxim, pirimifos-metil, profenofos, protiofos, sulprofos, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, triclorfon;

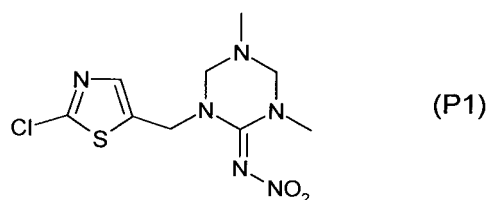
A.2. Carbamatos: e.g. alanicarb, aldicarb, bendiocarb,
15 benfuracarb, carbaril, carbofurano, carbosulfan, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomila, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato;

A.3. Piretróides: e.g. aletrina, bifentrina, ciflutrina, cialotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerate, etofempox, fempropatrina,
20 fenvalerato, imiprotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, praletrina, piretrina I e II, resmetrina, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina;

A.4. Reguladores de crescimento: a) inibidores de síntese de quitina: e.g. benzoil-uréias: clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron,
25 flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexitiazox, etoxazol, clofentezina; b) antagonistas de ecdisona: e.g. halofenozida, metóxi-fenozida, tebufenozida, azadiractina; c) juvenóides: e.g. piriproxifeno, metopreno, fenoxicarb; d) inibidores de síntese de lipídeo: e.g. espirodiclofeno, espiromesifeno ou

espirotetramat;

A.5. Compostos antagonistas / agonistas de receptor nicotínico (inseticidas nicotinóides ou neonicotinóides): e.g. clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, tiametoxam, nitempiram, acetamiprida, tiacloprida ou o
5 composto tiazol de fórmula P1



A.6. Compostos antagonistas de GABA: e.g. acetoprol, endosulfan, etiprol, fipronil, vaniliprol, pirafluprol, piriprol, 5-amino-3-(amino-tio-carbonil)-1-(2,6-dicloro-4-trifluoro-metil-fenil)-4-(trifluoro-metil-sulfinil)-pirazol;

10 A.7. Inseticidas de lactona macrocíclica: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosade,

A.8. Inibidores de transporte de elétrons de complexo mitocondrial I (Compostos METI I): e.g. fenazaquina, piridabeno, tebufempirad, tolfempirad, flufenerim;

15 A.9. Inibidores de transporte de elétrons de complexo mitocondrial II e/ou complexo mitocondrial III (Compostos METI II e III): e.g. acequinocil, fluaciprim, hidrametilnon;

A.10. Compostos desacopladores: e.g. clorfenapir;

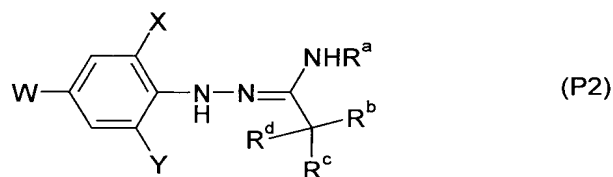
20 A.11. Compostos inibidores de fosforilação oxidativa: ciexatin, diafentiuron, óxido de fembutatin, propargito;

A.12. Compostos interruptores de exúvia: e.g. ciromazina;

A.13. Compostos inibidores de oxidase de função mista: e.g. butóxido de piperonila;

25 A.14. Compostos bloqueadores do canal de sódio: e.g. indoxacarb, metaflumizona,

A.15. Vários: benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalil, pimetrozina, enxofre, tiociclam, flubendiamida, cienopirafeno, flupirazofos, ciflumetofeno, amido-flumet, Compostos de fórmula P2:



sendo que X e Y são cada um independentemente halogênio, em particular cloro;

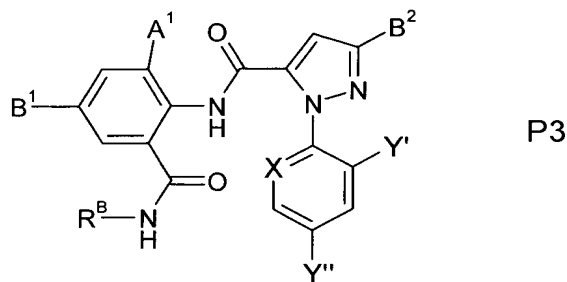
W é halogênio ou C₁-C₂-halo-alquila, em particular trifluorometila;

R^a é C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila ou C₃-C₆-ciclo-alquila cada uma das quais pode estar substituída com 1, 2, 3, 4 ou 5 átomos de halogênio; em particular R^a é metila ou etila;

R^b e R^c são C₁-C₆-alquila, em particular metila, ou podem formar juntos com o átomo de carbono adjacente um grupo C₃-C₆-ciclo-alquila, em particular um grupo ciclo-propila, que pode trazer 1, 2 ou 3 átomos de halogênio, exemplos incluindo 2,2-dicloro-ciclo-propila e 2,2-dibromo-ciclo-propila; e

R^d é hidrogênio ou C₁-C₆-alquila, em particular hidrogênio metila ou etila;

Compostos de antranil-amida de fórmula P3



sendo que A¹ é CH₃, Cl, Br, I, X é C-H, C-Cl, C-F ou N, Y' é F, Cl, ou Br, Y'' é F, Cl, CF₃, B¹ é hidrogênio, Cl, Br, I, CN, B² é Cl, Br, CF₃,

OCH_2CF_3 , OCF_2H , e R^B é hidrogênio, CH_3 ou $\text{CH}(\text{CH}_3)_2$;

e Compostos de malononitrila como descritos em JP 2002/284608, WO 02/89579, WO 02/90320, WO 02/90321, WO 04/06677, WO 04/20399 ou JP 2004/99597.

5 Compostos pesticidas adequados também incluem microorganisms tais como *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus tenebrionis* e *Bacillus subtilis*.

As composições anteriormente mencionadas são particularmente úteis para proteger plantas contra infestação de ditas pestes e
10 também para proteger plantas contra infecções de fungos fitopatogênicos ou para combater estas pestes/fungos em plantas infestadas/infectadas.

Contudo, os Compostos de fórmula I também são adequados para o tratamento de sementes. Aplicação nas sementes é realizada antes da semeadura, quer diretamente sobre as sementes quer após pré-germinação das
15 últimas.

Composições úteis para tratamento de semente são e.g.:

A Concentrados solúveis (SL, LS)

D Emulsões (EW, EO, ES)

E Suspensões (SC, OD, FS)

20 F Grânulos dispersáveis em água e grânulos solúveis em água (WG, SG)

G Pós dispersáveis em água e pós solúveis em água (WP, SP, WS)

H Pós capazes de serem transformados em poeiras (DP, DS)

25 Formulações FS preferidas de Compostos de fórmula I para tratamento de semente normalmente compreendem de 0,5 a 80% de ingrediente ativo, de 0,05 a 5 % de um umectante, de 0,5 a 15 % de um agente dispersante, de 0,1 a 5 % de um espessante, de 5 a 20% de um agente anticongelante, de 0,1 a 2% de um agente antiespumante, de 1 a 20% de um

pigmento e/ou um corante, de 0 a 15% de um agente de adesão / pegajosidade, de 0 a 75% de uma carga /um veículo, e de 0,01 a 1% de um conservante.

5 Pigmentos ou corantes adequados para formulações de tratamento de semente são pigment blue 15:4, pigment blue 15:3, pigment blue 15:2, pigment blue 15:1, pigment blue 80, pigment yellow 1, pigment yellow 13, pigment red 112, pigment red 48:2, pigment red 48:1, pigment red 57:1, pigment red 53:1, pigment orange 43, pigment orange 34, pigment orange 5, pigment green 36, pigment green 7, pigment white 6, pigment 10 brown 25, basic violet 10, basic violet 49, acid red 51, acid red 52, acid red 14, acid blue 9, acid yellow 23, basic red 10, basic red 108

Agentes de adesão / pegajosidade são adicionados para melhorar a adesão dos materiais ativos sobre as sementes após tratamento. Adesivos adequados são tensoativos copoliméricos em bloco de EO/PO mas 15 também poli(vinil-alcoóis), poli(vinil-pirrolidonas), poliacrilatos, polimetacrilatos, polibutenos, poliisobutilenos, poliestireno, poli(etileno-aminas), poli(etileno-amidas), poli(etileno-iminas) (Lupasol®, Polymin®), poliéteres e copolímeros derivados destes polímeros.

Para uso contra formigas, cupins, vespas, moscas, mosquitos, 20 grilos, ou baratas, Compostos de formula I, são preferivelmente usados em uma composição de isca.

A isca pode ser uma preparação líquida, sólida ou semi-sólida (e.g. um gel). Iscas sólidas podem ser formadas em várias formas e formatos adequados para a aplicação respectiva e.g. grânulos, blocos, bastões, discos. 25 Iscas líquidas podem ser adicionadas em vários dispositivos para garantir aplicação apropriada, e.g. recipientes abertos, dispositivos de borrifo, fontes de gotícula, ou fontes de evaporação. Geles podem ser baseados em matrizes aquosas ou oleosas e podem ser formulados para necessidades particulares em termos de pegajosidade, retenção de umidade ou características de

envelhecimento.

A isca empregada na composição é um produto que é suficientemente atraente para incitar insetos tais como formigas, cupins, vespas, moscas, mosquitos, grilos etc. ou baratas para comê-la. A atratividade
5 pode ser manipulada pelo uso de estimulantes de alimentação ou feromônios sexuais. Estimulantes alimentícios são escolhidos, por exemplo, mas não exclusivamente, de proteínas vegetal e/ou animal (carne, peixe, farinha de sangue, partes de inseto, gema de ovo), de gorduras e óleos de origem animal e/ou vegetal, ou mono-, oligo- ou poliorganossacarídeos, especialmente de
10 sacarose, lactose, frutose, dextrose, glicose, amido, pectina ou até mesmo melaço ou mel. Partes frescas ou em decomposição de frutas, colheitas, plantas, animais, insetos ou suas partes específicas também servem como um estimulante alimentício. Feromônios sexuais são conhecidos em serem mais específicos para inseto. Feromônios específicos são descritos na literatura e
15 são conhecidos por aqueles pessoas experientes na técnica.

Formulações de compostos de fórmulas I como aerossóis (e.g. em latas de borrifo), borrifos oleosos ou borrifos por bomba são elevadamente adequadas para o usuário não profissional para controlar pestes tais como moscas, pulgas, carrapatos, mosquitos ou baratas. Receitas de aerossol são
20 preferivelmente compostas de composto ativo, solventes tais como alcoóis inferiores (e.g. metanol, etanol, propanol, butanol), cetonas (e.g. acetona, metil-etil-cetona), hidrocarbonetos parafínicos (e.g. querosenes) tendo faixas de ebulição de aproximadamente 50 a 250°C, dimetil-formamida, N-metil-pirrolidona, dimetil-sulfóxido, hidrocarbonetos aromáticos tais como tolueno,
25 xileno, água, outros auxiliares tais como emulsificadores tais como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleila tendo 37 moles de óxido de etileno, etoxilato de álcool graxo, óleos de perfume tais como óleos etéreos, ésteres de ácidos graxos médios com alcoóis inferiores, Compostos carbonilados aromáticos, se apropriados estabilizadores tais como benzoato de sódio,

tensoativos anfotéricos, epóxidos inferiores, orto-formiato de trietila e, se exigidos, propelentes tais como propano, butano, nitrogênio, ar comprimido, dimetil-éter, dióxido de carbono, óxido nitroso, ou misturas destes gases.

5 As formulações de borribo oleosas diferem das receitas de aerossol pelo fato de não serem usados propelentes.

Os compostos de fórmulas I e suas respectivas composições também podem ser usados em serpentinas fumegantes e contra mosquito, cartuchos de fumaça, placas vaporizadoras e também papéis anti-traça, almofadas anti-traças ou outros sistemas vaporizadores independentes de
10 calor.

Os compostos de fórmulas I e suas composições podem ser usados para proteger material não-vivo, em particular materiais baseados em celulose tais como materiais de madeira e.g. árvores, cercas de tábuas, estrados, etc. e construções tais como casas, alpendres, fábricas, mas também
15 materiais de construção, mobílias, couros, fibras, artigos de vinil, cabos e fios elétricos etc. contra formigas e/ou cupins, e para controlar formigas e cupins contra o dano em colheitas ou em ser humano (e.g. quando as pestes invadem casas e instalações públicas). Os Compostos de formula I são aplicados não apenas na superfície de solo circundante ou no solo sob o assoalho com o
20 propósito de proteger materiais de madeira mas também podem ser aplicados em materiais acumulados tais como superfícies de concreto sob o assoalho, postos de alcova, vigas, madeiras compensadas, mobílias, etc., artigos de madeira tais como chapas de aglomerado de madeira, *half boards*, etc. e artigos de vinila tais como fios elétricos encapados, chapas vinílicas, material
25 isolante elétrico tais como espumas de estireno, etc. No caso de aplicação contra formigas que danificam colheitas ou seres humanos, o controlador de formigas da presente invenção é aplicado nas colheitas ou no solo circundante, ou é aplicado no ninho das formigas ou semelhante.

Nos métodos de acordo com a invenção as pestes são

controladas pelo contato da peste/parasita alvo, sua fonte de alimento, seu habitat, região de procriação ou seu locus com uma quantidade pesticidamente eficaz de Compostos I ou seu N-óxido ou seu sal ou com uma composição, contendo uma quantidade pesticidamente eficaz de um composto I, ou seu N-óxido ou seu sal.

"Locus" significa um habitat, região de procriação, planta, semente, solo, área, material ou ambiente no qual uma peste ou um parasita está crescendo ou pode crescer.

Em geral, "quantidade pesticidamente eficaz" significa a quantidade de ingrediente ativo necessária para alcançar um efeito observável sobre crescimento, incluindo os efeitos de necrose, morte, retardação, preservação, e remoção, destruição, ou de outra maneira diminuição da ocorrência e da atividade do organismo alvo. A quantidade pesticidamente eficaz pode variar para vários(as) Compostos/composições usados(as) na invenção. Uma quantidade pesticidamente eficaz das composições também variará de acordo com as condições prevalecentes tais como o efeito e a duração do pesticida desejados, estado atmosférico, espécie alvo, locus, modo de aplicação, e semelhante.

Os compostos I da invenção também podem ser aplicados preventivamente em lugares nos quais a ocorrência das pestes é esperada.

Os Compostos de fórmula I também podem ser usados para proteger plantas crescendo contra o ataque ou a infestação por pestes pelo contato da planta com uma quantidade pesticidamente eficaz de Compostos de fórmula I. Como tal, "contato" inclui tanto contato direto (aplicação de Compostos/composições diretamente sobre a peste e/ou planta - tipicamente na folhagem, no caule ou nas raízes da planta) e contato indireto (aplicações de Compostos/composições no locus da peste e/ou planta).

Os compostos I são empregados pelo tratamento de fungos, pestes ou das plantas, sementes, materiais ou do solo a serem protegidos do

ataque fúngico ou ataque de pestes com uma quantidade fungicidamente ou pesticidamente efetiva de pelo menos um composto ativo I, seu N-óxido ou sal. A aplicação pode ser realizada antes e após a infecção / infestação dos materiais, plantas ou sementes pelos fungos ou peste.

5 Quando empregadas em proteção de planta, as quantidades aplicadas são, dependendo do tipo de efeito desejado, dentro da faixa de 0,1 g a 4.000 g por hectare, desejavelmente de 25 g a 600 g por hectare, mais desejavelmente de 50 g a 500 g por hectare.

10 No tratamento de semente, as taxas de aplicação dos compostos ativos são geralmente de 0,001 g a 100 g por kg de sementes, preferivelmente de 0,01 g a 50 g por kg de sementes, em particular de 0,01 g a 2 g por kg de sementes.

15 No caso de tratamento de solo ou de aplicação no ninho ou local de residência das pestes, a quantidade de ingrediente ativo varia de 0,0001 a 500 g por 100 m², preferivelmente de 0,001 a 20 g por 100 m².

Taxas de aplicação costumeiras na proteção de materiais são, por exemplo, de 0,01 g a 1.000 g de composto ativo por m² de material tratado, desejavelmente de 0,1 g a 50 g por m².

20 Composições inseticidas para uso na impregnação de materiais tipicamente contêm de 0,001 a 95% em peso, preferivelmente de 0,1 a 45% em peso, e mais preferivelmente de 1 a 25% em peso de pelo menos um repelente e / ou inseticida.

25 Para uso em composições de isca, o teor típico de ingrediente ativo é de 0,001% em peso a 15% em peso, desejavelmente de 0,001% em peso a 5% em peso de composto ativo.

Para uso em composições de borrifo, o teor de ingrediente ativo é de 0,001 a 80% em peso, preferivelmente de 0,01 a 50% em peso e mais preferivelmente de 0,01 a 15% em peso.

Quando usada na proteção de materiais ou produtos

armazenados, a quantidade de composto ativo aplicada depende do tipo de área de aplicação e do efeito desejado. Quantidades costumeiramente aplicadas na proteção de materiais são, por exemplo, 0,001 g a 2 kg, preferivelmente 0,005 g a 1 kg, de composto ativo por metro cúbico de material tratado.

Sob condições externas, a taxa de aplicação de composto ativo para controlar pestes é de 0,1 a 2,0, preferivelmente de 0,2 a 1,0, kg/ha.

Vários tipos de óleos, umectantes, adjuvantes, herbicidas, fungicidas, outros pesticidas, ou bactericidas podem ser adicionados nos Compostos ativos, se apropriado não até imediatamente antes do uso (misturação em tanque). Estes agentes podem ser misturados com os agentes de acordo com a invenção em uma razão em peso de 1:100 a 100:1, preferivelmente 1:10 a 10:1.

Adjuvantes que podem ser usados são em particular polissiloxanos orgânicos modificados tais como Break Thru S 240[®]; alcóxilatos de álcool tais como Atplus 245[®], Atplus MBA 1303[®], Plurafac LF 300[®] e Lutensol SOBRE 30[®]; copolímeros em bloco de EO/PO, e.g. Pluronic RPE 2035[®] e Genapol B[®]; etóxilatos de álcool tal como Lutensol XP 80[®]; e dioctil-sulfo-succinato de sódio tal como Leofen RA[®].

Compostos de fórmula I, seus N-óxidos e seus sais veterinariamente aceitáveis bem como as composições compreendendo-os também podem ser usados para controlar e prevenir infestações e infecções em animais incluindo animais de sangue quente (incluindo humanos) e peixe. São por exemplo adequados para controlar e prevenir infestações e infecções em mamíferos tais como gado bovino, ovino, suíno, camelídeo, cervídeo, cavalos, porcos, aves domésticas, coelhos, cabras, cães e gatos, búfalo da Índia, macacos, gamo e rena, e também em animais possuindo pele tais como marta, chinchila e raccoon, aves tais como galinhas, gansos, perus e patos e peixes tais como peixes de água doce e peixes de água salgada tais como

truta, carpa e enguias.

Infestações em animais de sangue quente e peixe incluem, mas não são limitadas a, piolhos, piolhos mordedores, carrapatos, bernes nasais, parasitas de ovinos, moscas mordedoras, moscas muscóides, moscas, larvas de mosca da miase, larvas parasitas de ácaros, mosquitos borrachudos, mosquitos e pulgas

Os compostos de fórmula I e Compostos compreendendo-os são adequados para controle sistêmico e/ou não-sistêmico de ecto- e/ou endoparasitas. São ativos contra todos ou alguns estágios de desenvolvimento.

Administração pode ser realizada tanto profilática quanto terapeuticamente. Administração dos compostos ativo é realizada diretamente ou na forma de preparações adequadas, oralmente, topicamente / dermalmente ou parenteralmente.

Para administração oral a animais de sangue quente, os Compostos de fórmula I podem ser formulados como rações animal, pré-misturas de ração animal, concentrados de ração animal, pílulas, soluções, pastas, suspensões, purgantes, geles, tabletes, bolos e cápsulas. Em adição, os Compostos de fórmula I podem ser administrados aos animais em sua água de beber. Para administração oral, a forma de dosagem escolhida deve proporcionar o animal com 0,01 mg/kg to 100 mg/kg de peso corporal de animal por dia de composto de fórmula I, preferivelmente com 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal de animal por dia.

Alternativamente, os compostos de fórmula I, seus N-óxidos e sais podem ser administrados aos animais parenteralmente, por exemplo, por injeção intrarruminal, intramuscular, intravenosa ou subcutânea. Os Compostos de fórmula I podem ser dispersados ou dissolvidos em um veículo fisiologicamente aceitável para injeção subcutânea. Alternativamente, os Compostos de fórmula I podem ser formulados em um implante para administração subcutânea. Em adição o composto de fórmula I pode ser

transdermalmente administrado aos animais. Para administração parenteral, a forma de dosagem escolhida deve proporcionar o animal com 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal de animal por dia de composto de fórmula I.

Os compostos de fórmula I também podem ser aplicados
 5 topicamente nos animais na forma de banhos, poeiras, pós, colares, medalhões, borrifos, xampus, formulações *de pingar sobre e de derramar sobre* e em ungüentos ou emulsões de óleo-em-água ou de água-em-óleo. Para aplicação tópica, banhos e borrifos normalmente contêm 0,5 ppm a 5.000 ppm e preferivelmente 1 ppm a 3.000 ppm de composto de fórmula I. Em adição,
 10 os Compostos de fórmula I podem ser formulados como brincos de orelha para animais, particularmente quadrúpedes tais como gado bovino e ovino.

Preparações adequadas são:

- Soluções tais como soluções orais, concentrados para administração oral após diluição, soluções para uso sobre a pele ou em
 15 cavidades corporais, ou formulações *para derramamento sobre*, geles;
- Emulsões e suspensões para administração oral ou dermal; preparações semi-sólidas;
- Formulações nas quais o composto ativo é processado em uma base de ungüento ou em uma base de emulsão de óleo-em-água ou base
 20 emulsão de água-em-óleo;
- Preparações sólidas tais como pós, pré-misturas ou concentrados, grânulos, pelotas, tabletes, bolos, cápsulas; aerossóis e inalantes, e artigos moldados contendo o composto ativo.

Geralmente é favorável aplicar os Compostos de fórmula I em
 25 quantidades totais de 10 mg/kg a 300 mg/kg por dia, preferivelmente 20 mg/kg a 200 mg/kg por dia. Os Compostos ativos também podem ser usados como uma mistura com sinergistas ou com outros Compostos ativos que atuam contra endo- e ectoparasitas patogênicos.

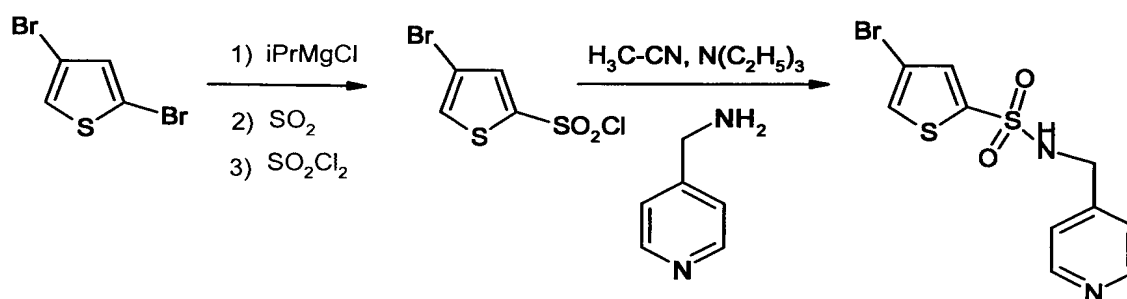
Em geral, os compostos de fórmula I são aplicados em

quantidade parasiticamente eficaz - significando uma quantidade de ingrediente ativo necessária para alcançar um efeito observável sobre o crescimento, incluindo os efeitos de necrose, morte, retardação, prevenção, e remoção, destruição, ou de outra maneira diminuição da ocorrência e da atividade do organismo alvo. A quantidade pesticidamente eficaz pode variar para vários(as) Compostos/composições usados(as) na invenção. Uma quantidade pesticidamente eficaz das composições também variará de acordo com as condições prevaletentes tais como o efeito parasiticida e a duração parasiticida desejados, espécie alvo, modo de aplicação, e semelhante.

Exemplos de síntese

Os procedimentos descritos nos exemplos de síntese abaixo foram usados para preparar outros Compostos I pela modificação apropriada dos Compostos iniciais. Os Compostos assim obtidos são listados nas tabelas abaixo, juntos com dados físicos.

Exemplo 1: Preparação de picolil-amida de ácido 4-bromo-tiofeno-2-sulfônico

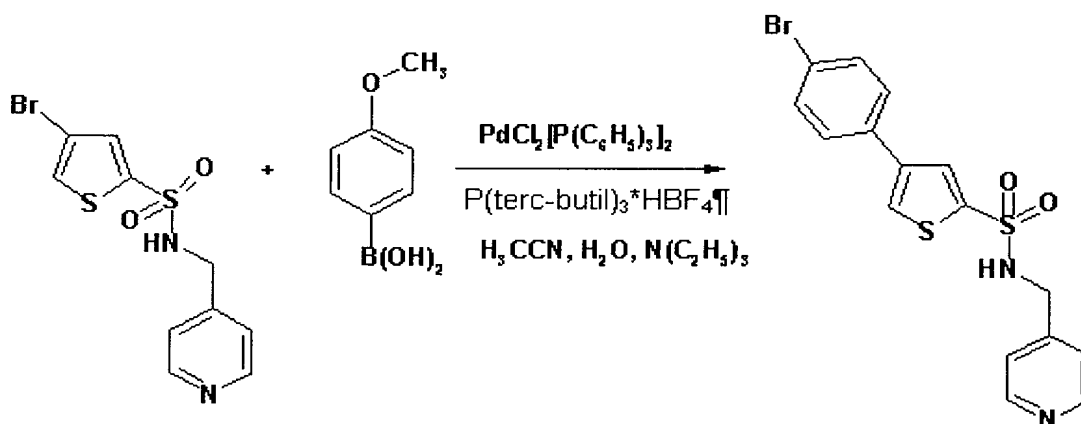


A 0°C uma solução de cloreto de isopropil-magnésio (18% em tetra-hidro-furano, 1,1 eq) foi lentamente adicionada em 2,4-dibromo-tiofeno (242 g, 1 mol) em tetra-hidro-furano (1.000 mL), mantendo deste modo a temperatura entre 0 a 10°C. Após agitação por 1 hora a cerca de 20°C, a solução foi esfriada para (-40)°C. SO₂ (200 g, 3 eq) foi adicionado mantendo a temperatura em (-40)°C com esfriamento intenso. Após 30 minutos nesta temperatura, SO₂Cl₂ (150 g, 1,1 eq) foi adicionado cuidadosamente e a mistura reacional foi aquecida para 0°C. Após 30 minutos, a mistura foi

aquecida para cerca de 20°C e HCl aquoso 10 % foi cuidadosamente adicionado. A mistura reacional bruta foi extraída com metil-terc-butil-éter (3 x 1.000 mL). As fases orgânicas combinadas foram lavadas com NaCl aquoso saturado (600 ml) e secas sobre Na₂SO₄.

5 O solvente foi removido e o sulfo-cloreto bruto foi dissolvido em acetonitrila (600 ml). Entrementes, picolil-amina (122 g, 1.1 eq) e trietil-amina (114 g, 1.1 eq) foram dissolvidas em cianeto de metila (1.400 mL) e esfriadas para 0°C. O sulfo-cloreto bruto em cianeto de metila foi adicionado via funil de adição mantendo a temperatura abaixo de 10°C. A solução foi
10 aquecida a cerca de 20°C e aditada durante a noite. O sólido precipitado foi filtrado e lavado com 100 mL de água. O produto desejado (193 g) foi obtido como um sólido branco-sujo.

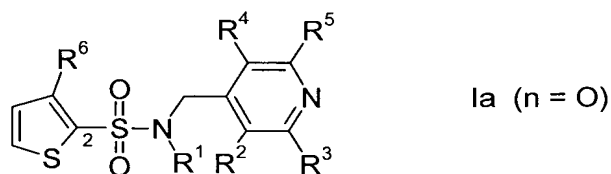
Exemplo 2: Preparação de picolil-amida de ácido 5-(4-metóxi-fenil)-piridina-2-sulfônico



15 Uma solução do brometo de tienila (0,41g, 1,2 mmoles), ácido borônico (0,22 g, 1,5 mmoles), PdCl₂[P(C₆H₅)₃]₂ (0,03 g), P(tert-butyl)₃*HBF₄ (0.020 g) e trietil-amina (0,42 g) foi dissolvida em cianeto de metila (5 ml) e água (2 mL). A mistura reacional foi refluxada para 2 horas. Após cromatografia do composto do título (0,23 g) foi obtido como um sólido
20 branco-sujo. P.f.: 150°C.

Compostos I listados em Tabela C e Tabela D foram preparados em uma maneira análoga.

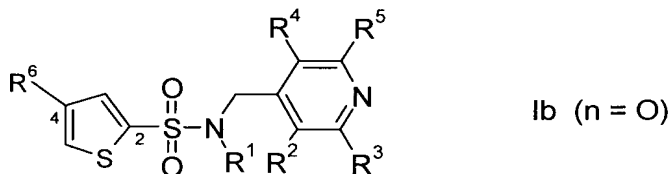
Tabela C



Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Dados físicos: p.f.
Ia.1	H	H	H	H	H	p-(CH ₂ -C ₂ H ₅)-fenila	115-117°C
Ia.2	H	H	H	H	H	p-C ₂ H ₅ -fenila	158-160°C
Ia.3	H	H	H	H	H	p-F-fenila	182-184°C
Ia.4	H	H	H	H	H	p-CH(CH ₃) ₂ -fenila	142°C
Ia.5	H	H	H	H	H	p-Cl-fenila	140-148°C
Ia.6	H	H	H	H	H	m-Cl-fenila	175-177°C

p.f. ponto de fusão

Tabela D



Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Dados físicos: p.f.
Ib.1	H	H	H	H	H	p-C ₂ H ₅ -fenila	158-160°C
Ib.2	H	H	H	H	H	p-F-fenila	156-158°C
Ib.3	H	H	H	H	H	m-Cl-fenila	102°C
Ib.4	H	H	H	H	H	p-CF ₃ -fenila	158-160°C
Ib.5	H	H	H	H	H	p-CH(CH ₃) ₂ -fenila	172°C
Ib.6	H	H	H	H	H	p-OCF ₃ -fenila	116-118°C
Ib.7	H	H	H	H	H	p-Cl-fenila	184-186°C
Ib.8	H	H	H	H	H	p-CH ₂ -C ₂ H ₅ -fenila	152°C
Ib.9	H	H	H	H	H	p-(CO-CH ₃)-fenila	182-184°C
Ib.10	H	H	H	H	H	p-(C(CH ₃)=NOCH ₃)-fenila	175-176°C
Ib.11	H	H	H	H	H	p-(C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅)-fenila	212-215°C
Ib.12	H	H	H	H	H	m-Cl, p-(OCH ₃)-fenila	140-145°C
Ib.13	H	H	H	H	H	m,p-(O-CH ₂ -O)-fenila	140-145°C
Ib.14	H	H	H	H	H	o-Cl-fenila	112-115°C
Ib.15	H	H	H	H	H	m-Cl, p-F-fenila	180-182°C
Ib.16	H	H	H	H	H	p-CN-fenila	210-213°C
Ib.17	H	H	H	H	H	m-CN-fenila	168-172°C
Ib.18	H	H	H	H	H	m-F, p-F-fenila	185°C
Ib.19	H	H	H	H	H	m-Cl, p-Cl-fenila	165-168°C
Ib.20	H	H	H	H	H	o-CH ₃ , p-F-fenila	156-157°C
Ib.21	H	H	H	H	H	p-CH ₃ -fenila	165°C
Ib.22	H	H	H	H	H	o-CH ₃ -fenila	134°C
Ib.23	H	H	H	H	H	m-CH ₃ -fenila	93°C
Ib.24	H	H	H	H	H	m-F-fenila	
Ib.25	H	H	H	H	H	o-F-fenila	107°C
Ib.26	H	H	H	H	H	m-CF ₃ -fenila	153°C
Ib.27	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	p-OCF ₃ -fenil	¹ H-RMN (em

Composto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	Dados físicos: p.f.
							d ⁶ -dimetil-sulfóxido): δ [ppm] = 8.8 (m,1H), 8.1-7.9 (m,4H), 7.8 (m,2H), 7.7-7.5 (m,4H), 7.4 (m,1H), 7.3 (m,2H), 4.6 (d,2H)
Ib.28	H	H	H	H	H	p-OCH ₃ -fenila	150°C
Ib.29	H	H	H	H	H	m-OCH ₃ -fenila	63°C
Ib.30	H	H	H	H	H	o-OCH ₃ -fenila	65 °C
Ib.31	H	H	H	H	H	o-(CO-NH ₂)-fenila	187°C
Ib.32	H	H	H	H	H	o-CF ₃ -fenila	
Ib.33	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	o-Cl, p-Cl-fenil	155-156°C
Ib.34	H	-CH=CH-CH=CH-	H	H	H	o-CF ₃ , p-CF ₃ -fenil	160-161°C

Exemplos da ação contra fungos nocivos

A ação fungicida dos Compostos de fórmula I foi demonstrada pelos seguintes experimentos:

As soluções de borrifo foram preparadas em várias etapas:

- 5 - uma solução de estoque foi preparada: uma mistura de acetona e/ou dimetil-sulfóxido e o agente umectante/emulsificador Uniperol[®] EL, que é baseado em alquil-fenóis etoxilados, em uma relação (volume) de solvente-emulsificador de 99 a 1 foi adicionada em 25 mg de composto ativo para dar um total de 10 mL.

- 10 - Água foi então adicionada para volume total de 100 mL.
- Esta solução de estoque foi diluída com a mistura de solvente-emulsificador-água para a concentração dada.

- 15 Os Compostos ativos foram formulados separadamente ou juntos como uma solução de estoque com 0,25% em peso de composto ativo em acetona ou dimetil-sulfóxido. 1% em peso de emulsificador Uniperol[®] EL (agente umectante tendo ação emulsificante e dispersante baseada em alquil-fenóis etoxilados) foi adicionado nesta solução e diluído com água para a concentração desejada.

Exemplo de uso 1 – Controle fungicida preventivo de mancha

de Alternária do tomateiro causada por *Alternaria solani*

Mudas jovens de plantas de tomateiro foram crescidas em potes. Estas plantas foram borrifadas até escorrimento com uma suspensão aquosa, contendo a concentração de ingrediente ativo indicada abaixo. No dia seguinte, as plantas tratadas foram inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos de *Alternaria solani* contendo $0,17 \times 10^6$ esporos por mL. Então as plantas de teste foram imediatamente transferidas para uma câmara úmida. Após 5 dias a 20 e 22°C e uma umidade relativa próxima a 100 %, a extensão de ataque fúngico sobre as folhas foi visualmente avaliada como % de área foliar doente.

Neste teste as plantas que têm sido tratadas com 250 ppm de composto ativo Ib.1, Ib.3, Ib.4, Ib.5, Ib.6, Ib.10, Ib.11, Ib.13, Ib.14, Ib.17, Ib.21, Ib.23 e Ib.26, respectivamente, mostraram uma infecção não maior do que 20%, enquanto que as plantas não tratadas foram 90% infectadas.

Exemplo de uso 2: Controle de requeima em tomateiros causada por *Fytofthora infestans*, tratamento protetor

Mudas jovens de plantas de tomateiro foram crescidas em potes. As plantas foram borrifadas até escorrimento com uma suspensão aquosa contendo a concentração de ingrediente ativo indicada abaixo. No dia seguinte, as plantas tratadas foram inoculadas com uma suspensão aquosa de esporângios de *Fytofthora infestans*. Após inoculação, as plantas de teste foram imediatamente transferidas para uma câmara úmida. Após seis dias a 18 a 20°C e uma umidade relativa próxima a 100%, a extensão de ataque fúngico sobre as folhas foi visualmente avaliada como % de área foliar doente.

Neste teste as plantas que têm sido tratadas com 250 ppm de composto ativo Ib.4, Ib.10, Ib.12, Ib.13, Ib.14, Ib.21 e Ib.23, respectivamente, mostraram uma infecção não maior do que 20%, enquanto que as plantas não tratadas foram 90% infectadas.

Exemplo de uso 3 – Controle protetor de míldio pulverulento em pepineiro causado por *Sphaerotheca fuliginea*

Mudas de pepineiro foram crescidas em potes para o estágio de cotilédone. As plantas foram borrifadas até escorrimento com uma
 5 suspensão aquosa, contendo a concentração de ingrediente ativo como indicada abaixo. No dia seguinte as plantas tratadas foram inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos de míldio pulverulento (*Sphaerotheca fuliginea*) de pepineiro. Então as plantas de teste foram cultivadas em uma estufa em temperaturas entre 20 e 24°C e uma umidade relativa entre 60 e 80
 10 %. Após 8 dias a extensão de ataque fúngico sobre as folhas foi visualmente avaliada como % de área foliar doente.

A ação dos Compostos de fórmula I contra pestes fúngicas foi demonstrada pelos seguintes experimentos:

1. Atividade contra Bicudo (*Anthonomus grandis*)

15 Os compostos ativos foram formulados em dimetil-sulfóxido/água 1:3. 10 a 15 ovos foram posicionados em placas de microtítulo com 2% de ágar-ágar em água e 300 ppm de formalina. Os ovos foram pulverizado com 20 µL de solução de teste, e as placas foram cobertas com folhas perfuradas e mantidas a 24-26°C e em umidade relativa de 75-85%
 20 com um ciclo de dia/noite por 3 a 5 dias. Mortalidade foi avaliada baseando-se nos ovos não-chocados restantes ou larvas sobre a superfície de ágar e/ou quantidade e profundidade dos canais de escavação causados pelas larvas chocadas. Testes foram repetidos 2 vezes.

Neste teste os ovos têm sido tratados com 2.500 ppm de
 25 Compostos ativos Ib.7, Ib.13, Ib.18, Ib.19, Ib.33 e Ib.34, respectivamente, mostraram uma mortalidade de pelo menos 75%.

2. Atividade contra a Mosca-da-fruta do Mediterrâneo (*Ceratitis capitata*)

Os Compostos ativos foram formulados em dimetil-

sulfóxido/água 1:3. 50 a 80 ovos foram posicionados em placas de microtítulo cheias com 0,5% de ágar-ágar e 14% de dieta em água. Os ovos foram borrifados com 5 µL de solução de teste, as placas foram cobertas com folhas perfuradas e mantidas a 27-29°C e umidade relativa de 75-85% sob luz fluorescente por 6 dias. Mortalidade foi avaliada baseando-se na agilidade das larvas chocadas. Testes foram repetidos 2 vezes.

Neste teste os ovos que têm sido tratados com 2.500 ppm de Compostos ativos Ia.6, Ib.6 e Ib.11, respectivamente, mostraram uma mortalidade de pelo menos 75%.

3. Atividade contra a lagarta do tabaco (*Heliothis virescens*)

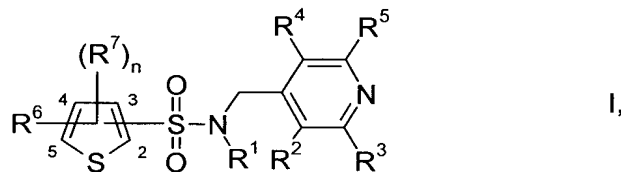
Os Compostos ativos foram formulados em dimetil-sulfóxido/água 1:3. 15 a 25 ovos foram posicionados em placas de microtítulo cheias com dieta. Os ovos foram borrifados com 10 µL de solução de teste, as placas foram cobertas com folhas perfuradas e mantidas a 27-29°C e umidade relativa de 75-85% sob luz fluorescente por 6 dias. Mortalidade foi avaliada baseando-se na agilidade e na alimentação comparativa das larvas chocadas. Testes foram repetidos 2 vezes. Neste teste os ovos que têm sido tratados com 2.500 ppm de Compostos ativos Ib.7, Ib.19, Ib.20 e Ib.33, respectivamente, mostraram uma mortalidade de pelo menos 75%.

4. Atividade contra afídeo de ervilhaca (*Megoura viciae*)

Os Compostos ativos foram formulados em dimetil-sulfóxido/água 1:3. Discos foliares de ervilhaca foram posicionados dentro de placas de microtítulo cheias com 0,8% de ágar-ágar e 2,5 ppm de OPUS®. Os discos foliares foram borrifados com 2,5 µL de solução de teste e 5 a 8 afídeos adultos foram posicionados dentro das placas de microtítulo que foram então cobertas e mantidas a 22-24°C e 35-45% sob luz fluorescente por 6 dias. Mortalidade foi avaliada baseando-se nos afídeos vitais, reproduzidos. Testes foram repetidos 2 vezes.

REIVINDICAÇÕES

1. Compostos sendo picolil amidas de ácido tiofeno-sulfônico, caracterizados pelo fato de serem de fórmula I



onde:

5 R^1 é hidrogênio, radical C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, ciano- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_6 -ciclo-
alquil- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_6 -halo-ciclo-alquil- C_1 - C_4 -alquila, (C_1 - C_4 -alquil)-
carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonila, C_2 - C_4 -alquenila, ciano- C_2 - C_4 -alquenila,
10 C_2 - C_4 -halo-alquenila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_2 - C_4 -alquenila, C_1 - C_4 -halo-alcóxi- C_2 - C_4 -
alquenila, (C_1 - C_4 -alquil)-carbonil- C_2 - C_4 -alquenila, (C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonil-
 C_2 - C_4 -alquenila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino- C_2 - C_4 -alquenila, C_2 - C_4 -alquinila, C_2 -
 C_4 -halo-alquinila, C_1 - C_4 -alquil- C_2 - C_4 -alquinila, C_1 - C_4 -halo-alquil- C_2 - C_4 -
alquinila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_2 - C_4 -alquinila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino, ou benzila
15 que pode possuir no anel fenila um ciano, halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -
halo-alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, C_1 - C_4 -halo-alcoxila, (C_1 - C_4 -alquil)-carbonila,
(C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonila ou di(C_1 - C_4 -alquil)-amino;

R^2 , R^3 independentemente um do outro são selecionados de
hidrogênio, tiol, amino, halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -
20 alcoxila, C_1 - C_4 -halo-alcoxila, C_1 - C_4 -alquil-tio, C_1 - C_4 -halo-alquil-tio, C_1 - C_4 -
alquil-sulfinila, C_1 - C_4 -halo-alquil-sulfinila, C_1 - C_4 -alquil-sulfonila, C_1 - C_4 -
halo-alquil-sulfonila, (C_1 - C_4 -alquil)-amino, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino, tri- C_1 - C_4 -
alquil-silila C_2 - C_4 -alquenila, C_2 - C_4 -alquinila ou anel heterociclila de 5 ou 6
membros contendo um átomo de nitrogênio e opcionalmente um segundo
25 heteroátomo selecionado de oxigênio, enxofre, NH ou N(C_1 - C_4 -alquila);

R^4 , R^5 independentemente um do outro são selecionados de

hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo alcoxila;

ou

R² e R³ juntos com os átomos de carbono nos quais estão ligados, podem formar um anel fenila, ciclo-pentila, ciclo-hexila ou heterociclila de 5 ou 6 membros contendo um a três heteroátomos selecionados do grupo consistindo de 2 átomos de nitrogênio, 1 átomo de oxigênio e 1 átomo de enxofre, sendo possível que todos estes anéis tragam um ou dois grupos R⁸ e/ou R⁹,

10 R⁸, R⁹ independentemente um do outro são halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo-alcoxila;

R⁶ é halogênio, ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcoxila, C₁-C₆-halo-alcoxila, (C₁-C₄-alquil)-carbonila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, -C(R¹⁰)=NOR¹¹, (C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila, di(C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila, fenila ou fenoxila, onde o anel nos últimos dois radicais mencionados pode trazer um, dois ou três grupos R¹²;

15 R⁷ ciano, formila, halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcoxila, C₁-C₄-halo-alcoxila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, (C₁-C₄-alcóxi)-carbonila, amino-carbonila, C₁-C₄-alquil-amino-carbonila ou di(C₁-C₄-alquil)-amino-carbonila;

n é zero ou um;

ou

25 R⁶ e R⁷ juntos com os átomos de carbono nos quais estão ligados, podem formar um anel fenila condensado, sendo possível que o anel fenila traga um grupo C₁-C₄-alquila;

R¹⁰ é hidrogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halo-alcóxi-C₁-C₄-alquila, fenila que pode possuir um radical ciano, halogênio, C₁-C₄-alcoxila ou C₁-C₄-halo-alcoxila, ou benzila que pode possuir um radical ciano, halogênio ou C₁-C₄-alquila;

R^{11} é C_1 - C_6 -alquila, benzila, C_2 - C_4 -alquenila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_2 - C_4 -halo-alquenila, C_2 - C_4 -alquinila ou C_2 - C_4 -halo-alquinila;

R^{12} é nitro, ciano, halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, C_1 - C_4 -halo-alcoxila, (C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonila, C_1 - C_4 -alquil-tio, C_1 - C_4 -halo-alquil-tio, C_1 - C_4 -alquil-sulfonila, C_1 - C_4 -halo-alquil-sulfonila, (5 C_1 - C_4 -alquil)-amino, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino, tri(C_1 - C_4 -alquil)-silila, $-CH=NO(C_1$ - C_4 -alquil), $-C(C_1$ - C_4 -alquil)= $NO(C_1$ - C_4 -alquil), C_2 - C_4 -alquenila ou C_3 - C_4 -alquinila;

ou dois radicais R^{12} podem formar uma cadeia C_3 - C_4 -alquilenos ou C_4 -alquenilenos que, junta com dois membros de anel adjacentes do anel arila no qual está ligada, forma um anel que pode estar substituído com um a 10 3 grupos R^{13} ;

R^{13} é halogênio, ciano, nitro, C_1 - C_8 -alquila, C_1 -halo-alquila, C_1 - C_8 -alcoxila, C_1 - C_8 -halo-alcoxila, (C_1 - C_4 -alquil)-carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi)-carbonila, $-C(R^{14})=NOR^{15}$, (C_1 - C_4 -alquil)-amino-carbonila, di(C_1 - C_4 -alquil)-amino-carbonila ou fenila ou fenoxila, onde o anel nos últimos dois radicais mencionados pode trazer um, dois ou três grupos R^{16} ;

R^{14} é hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, fenila que pode possuir 20 um radical ciano, halogênio, C_1 - C_4 -alcoxila ou C_1 - C_4 -halo-alcoxila, ou benzila que pode possuir um radical ciano, halogênio ou C_1 - C_4 -alquila;

R^{15} é C_1 - C_6 -alquila, benzila, C_2 - C_4 -alquenila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_2 - C_4 -halo-alquenila, C_2 - C_4 -alquinila ou C_2 - C_4 -halo-alquinila;

R^{16} é halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, C_1 -halo-alquila 25 ou C_1 -halo-alcoxila;

e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis e os sais veterinariamente aceitáveis dos compostos I,

desde que se o anel tiofeno estiver ligado no grupo sulfonila via posição 2, R^6 não poderá estar na posição 5.

2. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são hidrogênio.

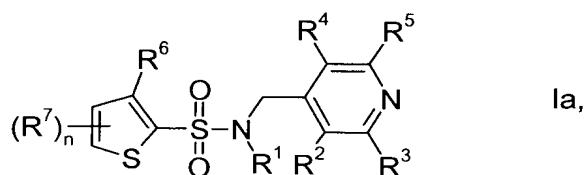
3. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que R^2 e R^3 , independentemente um do outro, são selecionados de hidrogênio, amino, halogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halo-alquila, C_1 - C_4 -alcoxila, C_1 - C_4 -halo-alcoxila, C_1 - C_4 -alquil-tio, C_1 - C_4 -halo-alquil-tio, C_1 - C_4 -alquil-sulfinila, C_1 - C_4 -halo-alquil-sulfinila, C_1 - C_4 -alquil-sulfonila, C_1 - C_4 -halo-alquil-sulfonila, $(C_1$ - C_4 -alquil)-amino, $di(C_1$ - C_4 -alquil)-amino, C_2 - C_4 -alquenila, C_2 - C_4 -alquinila ou tri- C_1 - C_4 -alquil-silila e R^4 e R^5 são hidrogênio, sendo que pelo menos um dos radicais R^2 e R^3 é diferente de hidrogênio.

4. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que R^2 e R^3 , juntos com os átomos de carbono nos quais estão ligados, formam um anel benzeno fundido, sendo possível que o anel benzeno fundido traga um ou dois radicais R^8 e/ou R^9 , e sendo que R^4 e R^5 são hidrogênio.

5. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que R^1 é hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_4 -alquenila, C_3 - C_4 -alquinila ou benzila.

6. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I de acordo com a reivindicação 1, caracterizados pelo fato de que R^6 é fenila, que pode trazer 1, 2 ou 3 radicais R^{12} .

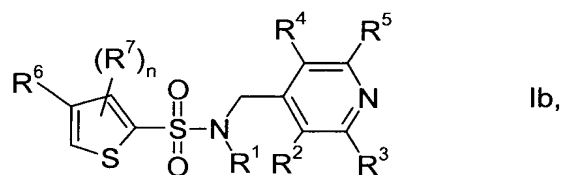
7. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico, caracterizados pelo fato de serem de fórmula Ia



sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 e R^7 e n são como definidos na

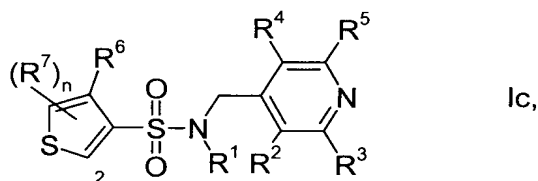
reivindicação 1, e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis dos Compostos Ia.

8. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico, caracterizados pelo fato de serem de fórmula Ib



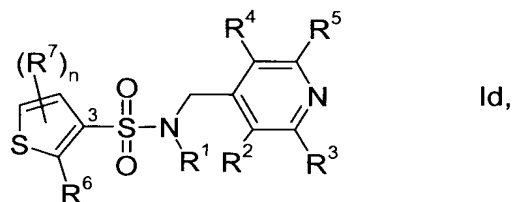
5 sendo que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ e n são como definidos na reivindicação 1, e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis dos compostos Ib.

9. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico, caracterizados pelo fato de serem de fórmula Ic



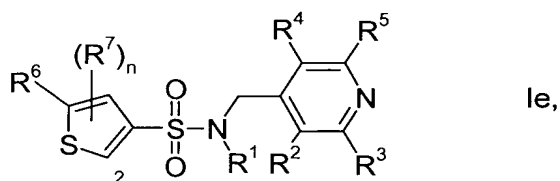
10 sendo que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ e n são como definidos na reivindicação 1, e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis dos compostos Ic.

10. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico, caracterizados pelo fato de serem de fórmula Id



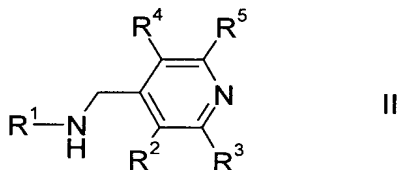
15 sendo que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ e n são como definidos na reivindicação 1, e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis dos compostos Id.

11. Compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico, caracterizados pelo fato de serem de fórmula Ie



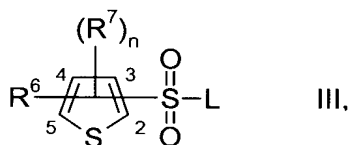
sendo que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e n são como definidos na reivindicação 1, e os N-óxidos e os sais agriculturalmente aceitáveis dos compostos Ie.

12. Processo para a preparação de compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I como definidos na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de compreender reagir um composto 4-amino-metil-piridina de fórmula II



na qual R^1 a R^5 são como definidos na reivindicação 1,
sob condições básicas com um composto de ácido tiofeno-

10 sulfônico de fórmula III



na qual R^6 , R^7 e n são como definidos na reivindicação 1 e L é hidroxila ou halogênio.

13. Composição agrícola, caracterizada pelo fato de compreender um veículo sólido ou líquido e pelo menos uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I ou um seu N-óxido ou um seu sal agriculturalmente aceitável, como definido na reivindicação 1.

14. Processo para o tratamento de fungos nocivos fitopatogênicos, caracterizado pelo fato de compreender tratar os fungos ou os materiais, plantas, o solo ou sementes a serem protegidos contra o ataque fúngico, com uma quantidade eficaz de pelo menos uma picolil-amida de

ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I ou um seu N-óxido ou um seu sal
agriculturalmente aceitável, como definido na reivindicação 1

15. Uso de compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-
sulfônico de fórmula I, seus N-óxidos e seus sais agriculturalmente aceitáveis,
5 como definidos na reivindicação 1, e de composições compreendendo
compostos de fórmula I, caracterizado pelo fato de ser para combater fungos
nocivos fitopatogênicos.

16. Uso de compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-
sulfônico de fórmula I, seus N-óxidos, seus sais agriculturalmente aceitáveis e
10 seus sais veterinariamente aceitáveis, como definido na reivindicação 1, e de
composições compreendendo pelo menos um composto de fórmula I,
caracterizado pelo fato de ser para combater pestes artrópodes.

17. Uso de compostos sendo picolil-amidas de ácido tiofeno-
sulfônico de fórmula I e dos N-óxidos e dos sais agriculturalmente aceitáveis,
15 como definidos na reivindicação 1, e de composições compreendendo pelo
menos um composto de fórmula I, caracterizado pelo fato de ser para proteger
semente, os brotos e as raízes de mudas da infestação pelos fungos nocivos
fitopatogênicos e/ou pelas pestes artrópodes.

18. Método para combater pestes artrópodes, caracterizado
20 pelo fato de compreender contatar ditas pestes, seu habitat, sua região de
geração, sua fonte de alimento, planta, semente, solo, área, material ou
ambiente no qual as pestes artrópodes estão crescendo ou podem crescer, ou
os materiais, plantas, sementes, solos, superfícies ou espaços a serem
protegidos de um ataque ou infestação por ditas pestes, com uma quantidade
25 pesticidamente eficaz de pelo menos uma picolil-amida de ácido tiofeno-
sulfônico de fórmula I, um seu N-óxido, um seu sal agriculturalmente
aceitável ou um seu sal veterinariamente aceitável, de acordo com a
reivindicação 1, ou com uma composição compreendendo pelo menos uma
picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I, um seu N-óxido, um

seu sal agriculturalmente aceitável ou um seu sal veterinariamente aceitável.

19. Método de acordo com a reivindicação 18, caracterizado pelo fato de que as pestes são insetos.

20. Método de acordo com a reivindicação 18, caracterizado pelo fato de que as pestes são aracnídeos.

21. Método para proteger colheitas do ataque ou da infestação por pestes artrópodes, caracterizado pelo fato de compreender contatar uma colheita com uma quantidade pesticidamente eficaz de pelo menos uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I ou de um seu N-óxido ou de um seu sal agriculturalmente aceitável, como definido na reivindicação 1.

22. Método para proteger semente da infestação por pestes artrópodes e da infestação de brotos e raízes de mudas por pestes artrópodes, caracterizado pelo fato de compreender contatar a semente ou os brotos e raízes de mudas com uma quantidade pesticidamente eficaz de pelo menos uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I, ou de um seu N-óxido ou de um seu sal agriculturalmente aceitável, como definido na reivindicação 1.

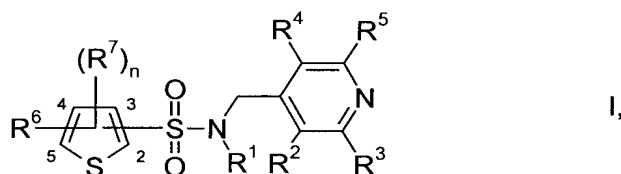
23. Método para proteger materiais não-vivos do ataque ou da infestação por pestes artrópodes, caracterizado pelo fato de compreender contatar o material não-vivo com uma quantidade pesticidamente eficaz de pelo menos uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I, ou de um seu N-óxido ou de um seu sal agriculturalmente aceitável, de acordo com a reivindicação 1.

24. Semente, caracterizada pelo fato de compreender uma picolil-amida de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I, ou um seu N-óxido ou um seu sal agriculturalmente aceitável, como definido na reivindicação 1, em uma quantidade de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de sementes.

RESUMO

“COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO AGRÍCOLA, PROCESSO PARA O TRATAMENTO DE FUNGOS NOCIVOS FITOPATOGÊNICOS, USO DE COMPOSTOS, MÉTODOS PARA COMBATER PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER COLHEITAS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, PARA PROTEGER SEMENTE DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES E DA INFESTAÇÃO DE BROTO E RAÍZES DE MUDAS POR PESTES ARTRÓPODES, E PARA PROTEGER MATERIAIS NÃO-VIVOS DO ATAQUE OU DA INFESTAÇÃO POR PESTES ARTRÓPODES, E, SEMENTE”

A presente invenção refere-se às picolil-amidas de ácido tiofeno-sulfônico de fórmula I



onde R^1 a R^7 e n são como definidos nas reivindicações e aos N-óxidos, sais agriculturalmente aceitáveis e sais veterinariamente aceitáveis dos Compostos (I), desde que se o anel tiofeno estiver ligado no grupo sulfonila via posição 2, R^6 não poderá estar na posição 5. A invenção também se refere a um processo para preparar estes compostos. Ademais, a invenção refere-se ao uso dos compostos I e dos seus N-óxidos e de seus sais agriculturalmente aceitáveis para combater fungos fitopatogênicos (daqui em diante chamados de fungos nocivos). Adicionalmente, os compostos (I), seus N-óxidos e sais podem ser usados para controlar pestes artrópodes. Além disso, a invenção refere-se à semente compreendendo um composto (I) ou um seu N-óxido ou sal agriculturalmente aceitável.