



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

**(11) PI 0709840-5 B1**

**(22) Data do Depósito:** 19/03/2007

**(45) Data de Concessão:** 15/03/2016

**(RPI 2358)**



---

**(54) Título:** ENAMINOCARBONILA SUBSTITUÍDAS, AGENTE, SEU USO, E PROCESSO PARA COMBATER PARASITAS

**(51) Int.Cl.:** C07D 405/12; A01N 43/40; A01P 7/00

**(30) Prioridade Unionista:** 31/03/2006 DE 10 2006 015 468.1

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

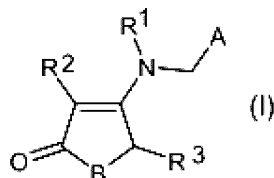
**(72) Inventor(es):** PETER JESCHKE, ROBERT VELTEN, THOMAS SCHENKE, OTTO SCHALLNER, MICHAEL EDMUND BECK, OLGA MALSAM, RALF NAUEN, THOMAS MÜLLER, CHRISTIAN ARNOLD, ERICH SANWALD, ULRICH GÖRGENS

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"ENAMINO-CARBONILA SUBSTITUÍDAS, AGENTE, SEU USO, E PROCESSO PARA COMBATER PARASITAS"**.

O presente pedido refere-se a novos compostos de enaminocar-  
5 bonila substituídos, processos para a sua produção e seu uso para combater parasitas animais, principalmente artrópodes, especialmente insetos.

Compostos de enaminocarbonila substituídos já são conhecidos como compostos com eficácia inseticida (compare a EP 0.539.588 A1, DE 102004047922 A1).

10 Foram desenvolvidos, então, novos compostos da fórmula (I)

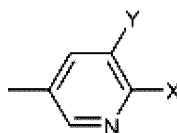


na qual

A representa um dos radicais pirimidinila, pirazolila, tiofenila, oxazolila, isoxazolila, 1,2,4-oxadiazolila, isotiazolila, 1,2,4-triazolila ou 1,2,5-tiadiazolila, as quais são eventualmente substituídas por flúor, cloro, bromo,  
15 ciano, nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila (a qual é eventualmente substituída por flúor e/ou cloro), C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquiltio (o qual é eventualmente substituído por flúor e/ou cloro), ou C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilsulfonila (a qual é eventualmente substituída por flúor e/ou cloro)

ou

20 A representa um radical



na qual

X representa halogênio, alquila ou halogenoalquila,

Y representa halogênio, alquila, halogenoalquila, halogenoalcóxi,  
25 azido ou ciano,

B representa oxigênio, enxofre ou metileno,

R<sup>1</sup> representa halogenoalquila, halogenoalquenila, halogenoci-

cloalquila ou halogenocicloalquilalquila,

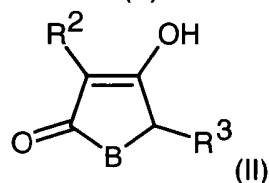
$R^2$  representa hidrogênio ou halogênio e

$R^3$  representa hidrogênio ou alquila.

Além disso, foi verificado, que os novos compostos da fórmula (I)

5 são obtidos, se

a) compostos da fórmula (II)



na qual

B,  $R^2$  e  $R^3$  têm os significados mencionados mais acima

são reagidos com compostos da fórmula (III)

10  $\text{HN}(R^1)\text{-CH}_2\text{-A}$  (III),

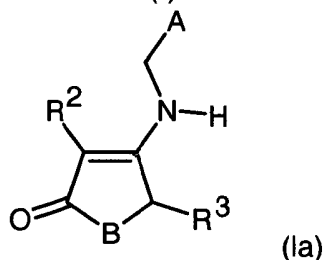
na qual

A e  $R^1$  têm os significados mencionados mais acima,

eventualmente na presença de um diluente adequado e eventu-

almente na presença de um coadjuvante ácido (processo 1) ou em que

15 b) compostos da fórmula (I)



na qual

A, B,  $R^2$  e  $R^3$  têm os significados mencionados mais acima

são reagidos com compostos da fórmula (IV)

$\text{E-R}^1$  (IV),

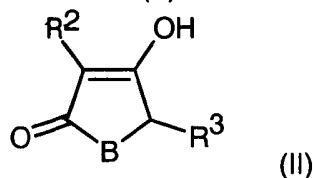
20 na qual

E representa um grupo de partida adequado, tal como, por exemplo, halogênio (especialmente bromo, cloro, iodo) ou O-sulfonilalquila e O-sulfonilarila (especialmente O-mesila, O-tosila),

eventualmente na presença de um diluente adequado e eventu-

almente na presença de um receptor de ácido (processo 2) ou em que

c) compostos da fórmula (II)



na qual

B, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> têm os significados mencionados mais acima

5 são reagidos em um primeiro estágio de reação com compostos da fórmula (V)

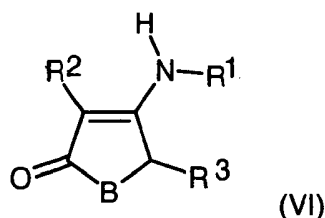
H<sub>2</sub>N-R<sup>1</sup> (V),

na qual

R<sup>1</sup> tem o significado mencionado mais acima

10 eventualmente na presença de um diluente adequado e eventualmente na presença de um coadjuvante ácido e em seguida,

em um segundo estágio de reação, os compostos formados da fórmula (VI)



na qual

15 B, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> têm os significados mencionados mais acima, são reagidos com compostos da fórmula (VII)

E-CH<sub>2</sub>-A (VII),

na qual

E e A têm os significados mencionados mais acima

20 eventualmente na presença de um diluente adequado e eventualmente na presença de um receptor de ácido (processo 3).

Finalmente, foi verificado, que os novos compostos da fórmula (I) possuem propriedades biológicas muito pronunciadas e que estes são adequados principalmente para combater parasitas animais, especialmente insetos, aracnídeos e nematódios, encontrados na agricultura, nas florestas,

25

na proteção de alimentos armazenados e de material, bem como no setor higiênico.

Dependendo eventualmente da natureza dos substituintes, os compostos da fórmula (I) podem estar presentes como isômeros geométricos e/ou como isômeros opticamente ativos ou como misturas de isômeros correspondentes em diferente composição. A invenção refere-se tanto aos isômeros puros, quanto também às misturas de isômeros.

Os compostos de acordo com a invenção, são definidos de modo geral, pela fórmula (I).

Substituintes ou âmbitos preferidos dos radicais citados nas fórmulas mencionadas acima e abaixo são esclarecidos a seguir.

A representa preferivelmente um radical pirimidin-5-ila, que é eventualmente substituído na posição 2 por halogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila, representa 1H-pirazol-4-ila, que é eventualmente substituída na posição 1 por C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila e na posição 3 por halogênio, representa 1H-pirazol-5-ila, que é eventualmente substituída na posição 2 por halogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila, representa isoxazol-5-ila, que é eventualmente substituída na posição 3 por halogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila, representa 1,2,4-oxadiazol-5-ila, que é eventualmente substituída na posição 3 por halogênio ou C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila, representa 1-metil-1,2,4-triazol-3-ila ou representa 1,2,5-tiadiazol-3-ila, além disso,

A representa preferivelmente um dos radicais 5,6-difluor-pirid-3-ila, 5-cloro-6-flúor-pirid-3-ila, 5-bromo-6-flúor-pirid-3-ila, 5-iodo-6-flúor-pirid-3-ila, 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila, 5,6-dicloro-pirid-3-ila, 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila, 5-iodo-6-cloro-pirid-3-ila, 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila, 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila, 5,6-dibromo-pirid-3-ila, 5-iodo-6-bromo-pirid-3-ila, 5-flúor-6-iodo-pirid-3-ila, 5-cloro-6-iodo-pirid-3-ila, 5-bromo-6-iodo-pirid-3-ila, 5,6-diiodo-pirid-3-ila, 5-metil-6-flúor-pirid-3-ila, 5-metil-6-cloro-pirid-3-ila, 5-metil-6-bromo-pirid-3-ila, 5-metil-6-iodo-pirid-3-ila, 5-difluormetil-6-flúor-pirid-3-ila, 5-difluor-metil-6-cloro-pirid-3-ila, 5-difluormetil-6-bromo-pirid-3-ila ou 5-difluormetil-6-iodo-pirid-3-ila.

B representa preferivelmente oxigênio ou metileno.

$R^1$  representa preferivelmente  $C_1$ - $C_5$ -alquila,  $C_2$ - $C_5$ -alquenila,  $C_3$ - $C_5$ -cicloalquila ou  $C_3$ - $C_5$ -cicloalquilalquila em cada caso substituída por flúor.

$R^2$  representa preferivelmente hidrogênio ou halogênio.

$R^3$  representa preferivelmente hidrogênio ou  $C_1$ - $C_3$ -alquila.

5 A representa de modo particularmente preferido um dos radicais 2-metil-pirimidin-5-ila, 2-cloro-pirimidin-5-ila, 1H-pirazol-4-ila, que é eventualmente substituído na posição 1 por metila, etila e na posição 3 por cloro, 1H-pirazol-5-ila, 2-metil-pirazol-5-ila, 2-bromo-tiazolila, isoxazol-5-ila, que é eventualmente substituído na posição 3 por metila, etila, cloro ou bromo, 3-  
10 metil-1,2,4-oxadiazol-5-ila, 1-metil-1,2,4-triazol-3-ila ou 1,2,5-tiadiazol-3-ila, além disso,

A representa de modo particularmente preferido um dos radicais 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila, 5,6-dicloro-pirid-3-ila, 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila, 5-  
15 flúor-6-bromo-pirid-3-ila, 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila, 5,6-dibromo-pirid-3-ila, 5-metil-6-cloro-pirid-3-ila ou 5-metil-6-bromo-pirid-3-ila.

B representa de modo particularmente preferido oxigênio ou metileno.

$R^1$  representa de modo particularmente preferido 2-flúor-etila, 2,2-difluor-etila ou 2-flúor-ciclopropila.

20  $R^2$  representa de modo particularmente preferido hidrogênio, flúor, cloro ou bromo.

$R^3$  representa de modo particularmente preferido hidrogênio ou metila.

A representa de modo muito particularmente preferido um dos radicais 2-metil-pirimidin-5-ila, 2-cloro-pirimid-5-ila, 3-metil-isoxazol-5-ila, 3-  
25 bromo-isoxazol-5-ila, 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila, 5,6-dicloro-pirid-3-ila ou 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila.

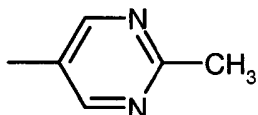
B representa de modo muito particularmente preferido oxigênio.

30  $R^1$  representa de modo muito particularmente preferido 2,2-difluor-etila.

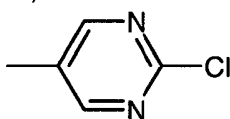
$R^2$  representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio.

$R^3$  representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio.

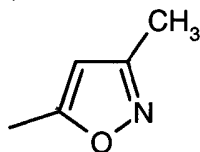
Em um grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 2-metil-pirimidin-5-ila,



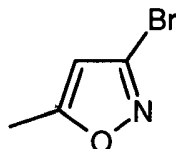
5 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 2-cloro-pirimidin-5-ila,



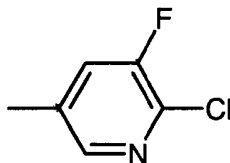
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 3-metil-isoxazol-5-ila,



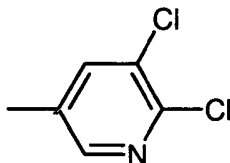
10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 3-bromo-isoxazol-5-ila,



Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila,

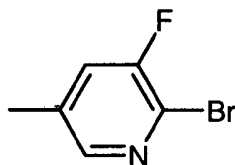


Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 5,6-dicloro-pirid-3-ila

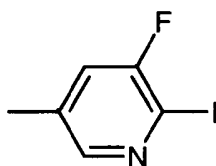


15 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A

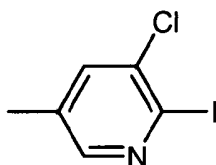
representa 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila



Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 5-flúor-6-iodo-pirid-3-ila



5 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), A representa 5-cloro-6-iodo-3-pirid-ila

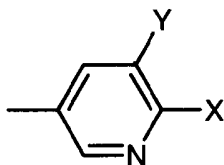


A seguir, é definido um outro grupo de compostos preferidos da fórmula (I), na qual

A representa um radical pirimidin-5-ila, que é substituída na posição por halogeno-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila,

10 ou

A representa um radical



na qual

X representa halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila, halogeno-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila

Y representa halogênio, halogeno-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila, halogeno-C<sub>1</sub>-

15 C<sub>4</sub>-alcóxi ou ciano,

B representa oxigênio, enxofre ou metileno,

R<sup>1</sup> representa halogeno-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquila, halogeno-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alquenila, halogenociclopropila (em que halogênio representa especialmente flúor ou cloro),

$R^2$  representa hidrogênio ou halogênio e

$R^3$  representa hidrogênio ou metila.

A representa preferivelmente 2-cloro-pirimidin-5-ila ou 2-trifluormetil-pirimidin-5-ila,

5 além disso,

A representa preferivelmente um radical 5,6-difluor-pirid-3-ila, 5-cloro-6-flúor-pirid-3-ila, 5-bromo-6-flúor-pirid-3-ila, 5-iodo-6-flúor-pirid-3-ila, 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila, 5,6-dicloro-pirid-3-ila, 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila, 5-iodo-6-cloro-pirid-3-ila, 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila, 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila, 10 5,6-dibromo-pirid-3-ila, 5-flúor-6-iodo-pirid-3-ila, 5-cloro-6-iodo-pirid-3-ila, 5-bromo-6-iodo-pirid-3-ila, 5-metil-6-flúor-pirid-3-ila, 5-metil-6-cloro-pirid-3-ila, 5-metil-6-bromo-pirid-3-ila, 5-metil-6-iodo-pirid-3-ila, 5-difluormetil-6-flúor-pirid-3-ila, 5-difluormetil-6-cloro-pirid-3-ila, 5-difluormetil-6-bromo-pirid-3-ila, 5-difluormetil-6-iodo-pirid-3-ila.

15 B representa preferivelmente oxigênio ou metileno.

$R^1$  representa preferivelmente  $C_1$ - $C_3$ -alquila,  $C_2$ - $C_3$ -alquenila ou ciclopropila em cada caso substituída por flúor.

$R^2$  representa preferivelmente hidrogênio ou halogênio (em que halogênio representa especialmente flúor ou cloro).

20  $R^3$  representa preferivelmente hidrogênio.

A representa de modo particularmente preferido 2-cloro-pirimidin-5-ila, 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila, 5,6-dicloro-pirid-3-ila, 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila, 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila, 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila, 5,6-dibromo-pirid-3-ila, 5-metil-6-cloro-pirid-3-ila, 5-cloro-6-iodo-pirid-3-ila ou 5- 25 difluormetil-6-cloro-pirid-3-ila.

B representa de modo particularmente preferido oxigênio.

$R^1$  representa de modo particularmente preferido 2-fluoretila, 2,2-difluoretila ou 2-flúor-ciclopropila.

$R^2$  representa de modo particularmente preferido hidrogênio.

30  $R^3$  representa de modo particularmente preferido hidrogênio.

A representa de modo muito particularmente preferido 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila ou 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila.

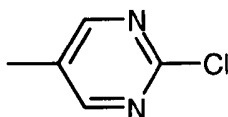
B representa de modo muito particularmente oxigênio.

R<sup>1</sup> representa de modo muito particularmente 2,2-difluor-etila.

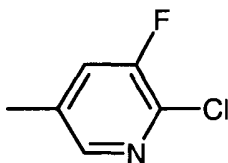
R<sup>2</sup> representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio.

5 R<sup>3</sup> representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio.

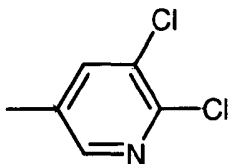
Em um grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 2-cloro-pirimidin-5-ila,



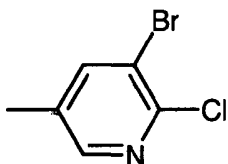
10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila



15 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5,6-dicloro-pirid-3-ila

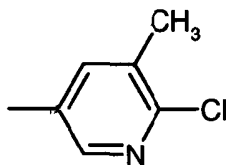


Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila

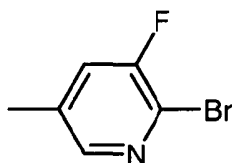


20 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-metil-6-cloro-

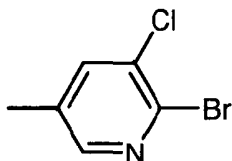
pirid-3-ila



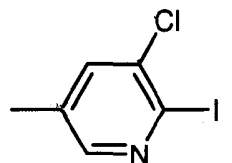
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila



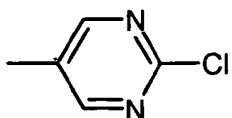
- 5 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila



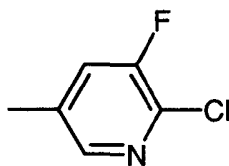
- 10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>3</sup> representa hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-cloro-6-iodo-pirid-3-ila



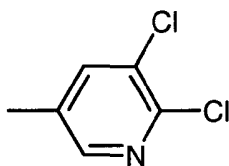
Em um grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 2-cloro-pirimidin-5-ila



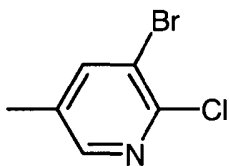
- 15 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila,



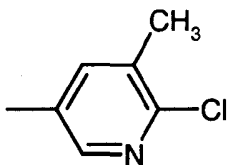
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5,6-dicloro-pirid-3-ila,



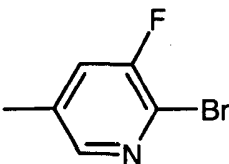
5 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila



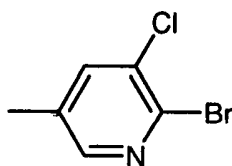
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-metil-6-cloro-pirid-3-ila



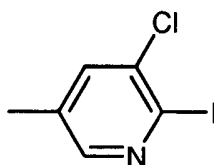
10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila



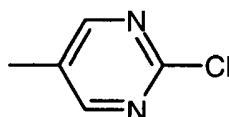
15 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila



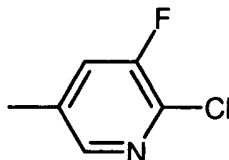
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa oxigênio e A representa 5-cloro-6-iodo-pirid-3-ila



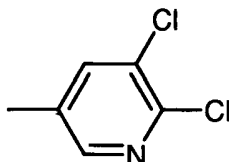
5 Em um grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 2-cloro-pirimidin-5-ila,



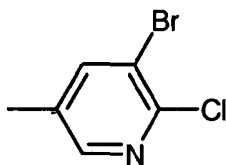
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5-flúor-6-cloro-pirid-3-ila,



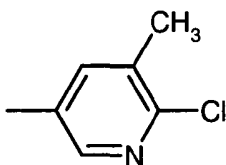
10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5,6-dicloro-pirid-3-ila



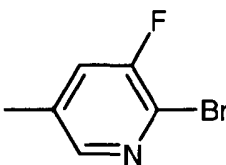
15 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5-bromo-6-cloro-pirid-3-ila



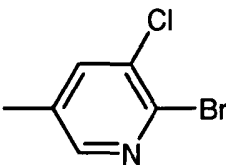
Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5-metil-6-cloro-pirid-3-ila



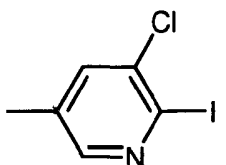
5 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5-flúor-6-bromo-pirid-3-ila



Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5-cloro-6-bromo-pirid-3-ila



10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio, B representa metileno e A representa 5-cloro-6-iodo-pirid-3-ila



15 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>1</sup> representa difluormetila, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam hidrogênio e B representa oxigênio.

Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I), R<sup>1</sup>

representa 2-fluoretila,  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio e B representa oxigênio.

5 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^1$  representa 2,2-difluoretila,  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio e B representa oxigênio.

Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^1$  representa difluormetila,  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio e B representa metileno.

10 Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^1$  representa 2-fluoretila,  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio e B representa metileno.

Em um outro grupo pronunciado de compostos da fórmula (I),  $R^1$  representa 2,2-difluoretila,  $R^2$  e  $R^3$  representam hidrogênio e B representa metileno.

15 As definições ou esclarecimentos de radicais gerais citados acima ou citados em âmbitos preferidos valem para os produtos finais e correspondentemente, para os produtos de partida e produtos intermediários. Essas definições de radicais podem ser combinadas entre si tal como desejado, isto é, também entre os respectivos âmbitos preferidos.

20 De acordo com a invenção, é dada preferência aos compostos da fórmula (I), nos quais há uma combinação dos significados enumerados acima como sendo preferidos.

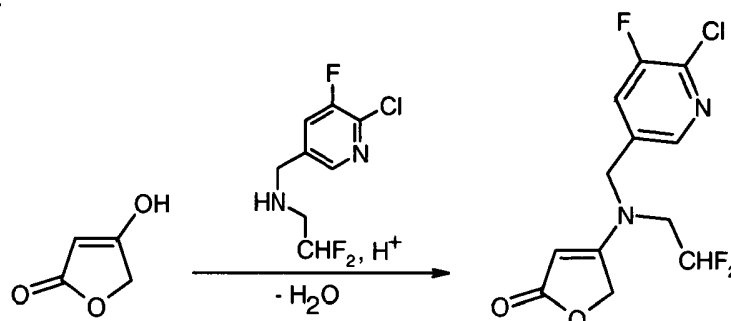
25 De acordo com a invenção, é dada particular preferência aos compostos da fórmula (I), nos quais há uma combinação dos significados enumerados acima como sendo particularmente preferidos.

De acordo com a invenção, é dada preferência muito particular aos compostos da fórmula (I), nos quais há uma combinação dos significados enumerados acima como sendo muito particularmente preferidos.

30 Utilizando-se no processo 1 de acordo com a invenção, para a preparação dos novos compostos da fórmula (I), como compostos da fórmula (II), por exemplo, o ácido tetrônico e como composto da fórmula (III) a N-[(6-cloro-5-flúor-piridin-3-il)metil]-2,2-difluoretan-1-amina, então o processo

de preparação 1 pode ser representado pelo seguinte esquema de reação I:

Esquema 1



Os compostos necessários como materiais de partida para a preparação do processo 1 de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (II).

Nessa fórmula (II), B, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam preferivelmente aqueles radicais, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, como substituintes preferidos.

Os compostos da fórmula (II) podem ser obtidos, em parte, comercialmente ou por métodos conhecidos da literatura (compare, por exemplo, compostos da fórmula geral (II), na qual B representa oxigênio: ácidos tetrônicos (Said, A. *Speciality Chemicals Magazine* (1984), 4(4), 7-8; Rao, Y. S. *Chem. Rev.* (1976), 76, 625-694; Tejedor, D.; Garcia-Tellado, F. *Org. Preparations and Procedures International* (2004), 36, 35-59; Reviews); B representa enxofre: ácidos tiotetrônicos (Thomas, E.J. *Special Publication – Royal Society of Chemistry* (1988), 65 (Top. Med. Chem.), 284-307, Review), B representa metileno: ciclopentan-1,3-diona (Schick, Hans; Eichhorn, Inge. *Synthesis* (1989), (7), 477-492, Review).

Os compostos a serem utilizados, além disso, como materiais de partida para a realização do processo 1 de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (III).

Na fórmula (III), A e R<sup>1</sup> têm os significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção.

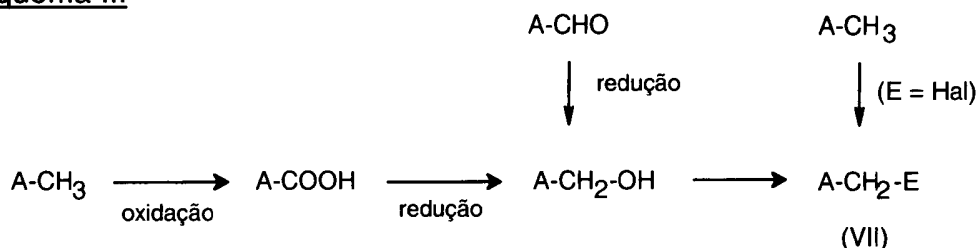
Os compostos da fórmula (III) podem ser obtidos, em parte, co-

mercialmente ou por métodos conhecidos da literatura (compare, por exemplo, S. Patai "The Chemistry of Amino Group", Interscience Publishers, Nova York, 1968; compostos da fórmula geral (III), na qual R<sup>1</sup> representa hidrogênio: aminas primárias, R<sup>1</sup> representa halogenoalquila, halogenoalquenila ou halogenocicloalquila: aminas secundárias).

Os compostos da fórmula (VII) podem ser obtidos, em parte, comercialmente, são parcialmente conhecidos ou podem ser obtidos por métodos conhecidos.

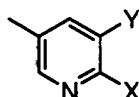
Rotas para a preparação de compostos da fórmula (VII) são representados no esquema de reação III.

### Esquema III



E = Hal, por exemplo, cloro, bromo, iodo; O-tosila, O-mesila

A = tal como definido acima, por exemplo,



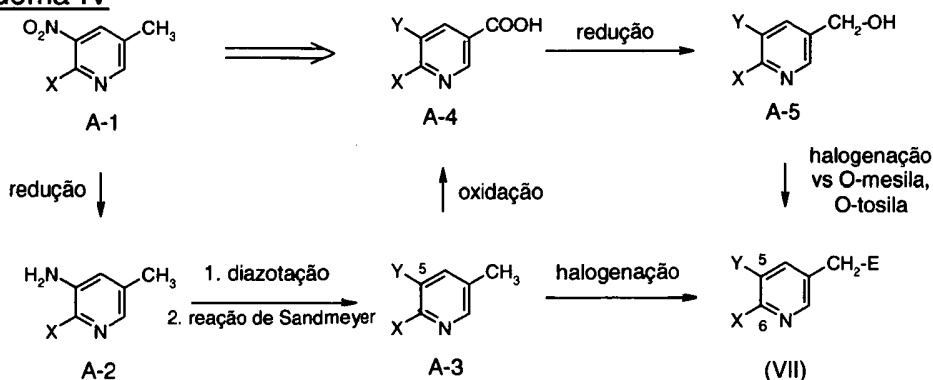
Compostos substituídos por metila (A-CH<sub>3</sub>), por exemplo, podem ser convertidos através de oxidação para os ácidos carboxílicos correspondentes (A-COOH, por exemplo, ácido 5-flúor-6-bromo-nicotínico; F. L. Setliff, G. O. Rankin, J. Chem. Eng. Data (1972), 17, 515-516; ácido 5-cloro-6-bromo-nicotínico e ácido 5,6-dibromo-nicotínico; F. L. Setliff e outros, J. Chem. Eng. Data (1981), 26, 332-333; ácido 5-iodo-6-bromo-nicotínico: F. L. Setliff e outros, J. Chem. Eng. Data (1978), 23, 96-97, ácido 5-flúor-6-iodo-nicotínico e ácido 5-bromo-6-iodo-nicotínico: F. L. Setliff e outros, J. Chem. Eng. Data (1973), 18, 449-450, ácido 5-cloro-6-iodo-nicotínico: F. L. Setliff, J. E. Lane J. Chem. Eng. Data (1976), 21, 246-247) ou éster de ácido carboxílico (por exemplo, éster metílico de ácido 5-metil-6-flúor-nicotínico: WO 9833772 A1, 1998, éster metílico de ácido 5-metil-6-bromo-nicotínico: WO

9730032 A1, 1997).

Os ácidos carboxílicos (A-COOH) podem ser convertidos, depois, por métodos conhecidos da literatura para os compostos hidroximetila correspondentes (A-CH<sub>2</sub>-OH) que, a seguir, são reagidos por métodos conhecidos da literatura, para compostos hidroximetila ativados (A-CH<sub>2</sub>-E, E = O-tosila, O-mesila) ou compostos halogenometila (A-CH<sub>2</sub>-E, E = Hal). Os últimos também podem ser obtidos a partir de compostos correspondentes, que contêm um grupo metila (A-CH<sub>3</sub>) utilizando agentes de halogenação adequados conhecidos da literatura. Como exemplos para esse procedimento sejam mencionados as sínteses dos seguintes como: 5-clorometil-2-metilpirimidina (U. Eiermann e outros, Chem. Ber. (1990), 123, 1885-9); 3-clorometil-5-bromo-6-cloro-piridina, 3-bromo-5-iodo-6-cloro-piridina (S. Kagabu e outros, J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413).

Do mesmo modo, compostos da fórmula (VII), nos quais A representa um radical pirid-3-ila 5,6-dissubstituído, podem ser obtidos por métodos conhecidos da literatura. Compostos de partida adequados conhecidos da literatura são, por exemplo, as 5-nitro-β-picolinas substituídas por 6-halogênio (A-1), que podem ser modificadas por instruções da literatura, tal como mostrado no esquema de reação IV.

#### 20 Esquema IV



X, Y = halogênio, por exemplo, flúor, cloro, bromo, iodo  
E = halogênio, O-mesila, O-tosila

A redução do grupo nitro em 5-nitro-β-picolinas substituídas por 6-halogênio (A-1) leva, por exemplo, às 5-amino-β-picolinas substituídas por 6-halogênio (A-2, por exemplo, 5-amino-6-cloro-β-picolina e 5-amino-6-bromo-β-picolina: Setliff, F. L. Org. Preparations and Preparations Int.

(1971), 3, 217-222; Kagabu, S. e outros, *J. Pestic. Sci.* (2005), 30, 409-413).  
Através de subsequente diazotação, bem como reação de Sandmeyer (C. F. H. Allen, J. R. Thirtle, *Org. Synth.*, Coll. Vol. III, 1955, página 136), é possível a introdução de substituintes halogênio na posição 5 (A-3, por exemplo, 5-  
5 flúor-6-cloro- $\beta$ -picolina e 5-flúor-6-bromo- $\beta$ -picolina: Setliff; F. L. *Org. Preparations and Preparations Int.* (1971), 3, 217-222; 5-iodo-6-cloro- $\beta$ -picolina: Kagabu, S. e outros, *J. Pestic. Sci.* (3005), 30, 409-413; 5,6-dicloro-picolina: Setliff, F. L. Lane, J. E. *J. Chem. Engineering Data* (1976), 21, 246-247). A oxidação do grupo metila nas  $\beta$ -picolinas 5,6-dissubstituídas (A-3), leva aos  
10 ácidos nicotínicos 5,6-dissubstituídos correspondentes (A-4, por exemplo, ácido 5-flúor-6-cloro-nicotínico e ácido 5-flúor-6-bromo-nicotínico; Setliff F. L., Rankin G. O. *J. Chem. Engineering Data* (1972), 17, 515-516; ácido 5-bromo-6-flúor-nicotínico, ácido 5-bromo-6-cloro-nicotínico e ácido 5-bromo-6-bromo-nicotínico; F. L. Setliff *J. Chem. Engineering Data* (1970), 15, 590-  
15 591; ácido 5-cloro-6-bromo-nicotínico e ácido 5-iodo-6-bromo-nicotínico: Setliff, F. L., Greene, J. S. *J. Chem. Engineering Data* (1978), 23, 96-97; o ácido 5-cloro-6-trifluormetil-nicotínico também é conhecido: F. Cottet e outros, *Synthesis* (2004), 10, 1619-1624), que na presença de agentes de redução podem ser convertidos para as piridinas hidroximetiladas (A-5) correspondentes (por exemplo, 5-bromo-6-cloro-3-hidroximetil-piridina: Kagabu, S. e  
20 outros, *J. Pestic. Sci.* (2005), 30, 409-413).

A partir de ácido 6-cloro-5-nitro-nicotínico (A-4, X=Cl, Y=NO<sub>2</sub>; Boyer, J. H.; Schoen, W., *J. Am. Chem. Soc.* (1956), 78, 423-425) por meio de redução, é possível formar a 6-cloro-3-hidroximetil-5-nitro-piridina (A-5,  
25 X=Cl, Y=NO<sub>2</sub>; Kagabu, S. e outros, *J. Med. Chem.* (2000), 43, 5003-5009), que em seguida, é reduzida para a 6-cloro-3-hidroximetil-5-amino-piridina (A-5, X=Cl, Y=NH<sub>2</sub>; Kagabu, S. e outros, *J. Med. Chem.* (2000), 43, 5003-5009) e através de diazotação e reação com hidroxilamina é convertida para a 6-cloro-3-hidroximetil-5-azido-piridina (A-5, X=Cl, Y=N<sub>3</sub>; Kagabu, S. e outros, *J.*  
30 *Med. Chem.* (2000), 43, 5003-5009). Subsequente halogenação com cloreto de tionila resulta na 6-cloro-3-clorometil-5-azido-piridina (VII, X=Cl, Y=N<sub>3</sub>, E=Cl; Kagabu, S. e outros, *J. Med. Chem.* (2000), 43, 5003-5009).

Alternativamente, a halogenação do grupo metila na posição 3 de (A-3) leva a compostos da fórmula (VII), na qual E representa halogênio (por exemplo: 3-bromometil-6-cloro-5-flúor-piridina, 3-bromometil-6-cloro-5-iodo-piridina: Kagabu, S. e outros, J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413). Nesse caso, ao utilizar 5-nitro- $\beta$ -picolininas (A-3; Y=NO<sub>2</sub>) substituídas por 6 halogênio, efetua-se inicialmente a halogenação do grupo metila na posição 3 (por exemplo, 3-bromometil-6-cloro-5-nitro-piridina; Kagabu, S. e outros, J. Pestic. Sci. (2005), 30, 409-413). Eventualmente também, o grupo nitro pode ser inicialmente reduzido em um momento posterior da seqüência de reação.

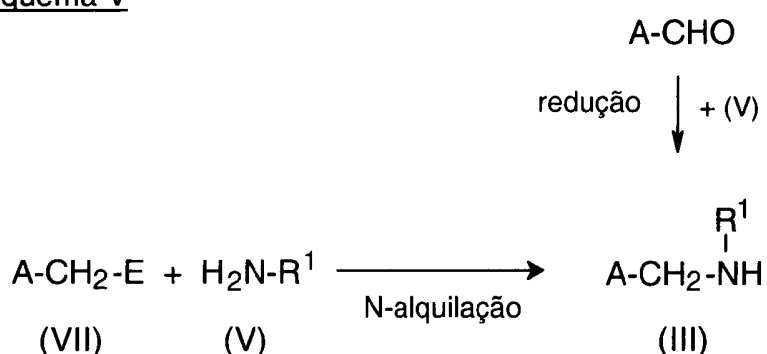
Do mesmo modo, a introdução de substituintes na posição 5 (por exemplo, Y=N<sub>3</sub>) em compostos da fórmula (VII), na qual E representa N-morfolino, é conhecida da literatura. Em seguida, este radical pode ser substituído de maneira muito simples por halogênio (E=Hal) (compare S. Kagabu e outros, J. Med. Chem. 2000, 43, 5003-5009; condições de reação: éster etílico de ácido clorofórmico, tetrahidrofurano, 60°C).

Em geral, consegue-se substituir átomos de halogênio na proximidade do nitrogênio de piridina por outros átomos de halogênio ou grupos halogenados, tal como, por exemplo, trifluormetila (transhalogenação, por exemplo: cloro por bromo ou iodo; bromo por iodo ou flúor; iodo por flúor ou trifluormetila). Por isso, um outro processo de síntese alternativo consiste em substituir o átomo de halogênio (por exemplo, X=Cl) na posição 6 do radical pirid-5-ila (por exemplo, em A-4 com X, Y=Cl; ácido 5,6-dicloro-nicotínico: Setliff, F. L.; Lane, J. E. J. Chem. Engineering Data (1976), 21, 246-247) por um outro átomo de halogênio, por exemplo, iodo ou flúor (por exemplo: A-4 com X=I; ácido 5-bromo-6-iodo-nicotínico e A-4 com X=F; ácido 5-bromo-6-flúor-nicotínico: Setliff, F. L.; Price, D. W. J. Chem. Engineering Data (1973), 18, 449-450). Eventualmente, contudo, essa trans-halogenação também pode ser efetuada inicialmente em compostos adequados da fórmula (I), tal como evidenciado abaixo no esquema de reação X e com base nos exemplos de concretização.

Para preparar compostos da fórmula (III), por exemplo, os compostos da fórmula (VII), na qual A e E têm os significados mencionados mais

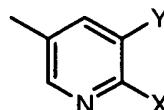
acima, são reagidos com compostos da fórmula (V), na qual R<sup>1</sup> tem os significados mencionados mais acima, eventualmente na presença de diluentes e eventualmente na presença dos agentes auxiliares de reação básicos mencionados na descrição do processo de preparação 2 (compare N-alquilação, esquema V).

Esquema V



E = Hal, por exemplo, cloro, bromo, iodo; O-tosila, O-mesila,

A = tal como definido acima, por exemplo,



Em certos casos, alternativamente também é possível a preparação de compostos da fórmula (III) dos aldeídos (A-CHO) correspondentes e compostos da fórmula (V) por meio de aminação redutora (compare Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, volume XI/1, Georg Thieme Verlag, Stuttgart, página 602).

Em geral, é vantajoso efetuar o processo de preparação 1 de acordo com a invenção, na presença de diluentes. Os diluentes são usados de maneira vantajosa em uma quantidade tal, que a mistura de reação continue bem agitada durante todo o processo. Como diluentes para efetuar o processo 1 de acordo com a invenção, tomam-se em consideração todos os solventes orgânicos inertes.

Como exemplos são mencionados: hidrocarbonetos halogenados, especialmente hidrocarbonetos clorados, tais como tetracloretileno, tetracloreto, dicloropropano, cloreto de metileno, diclorobutano, clorofór-

mio, tetracloreto de carbono, tricloroetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorbenzeno, 1,2-dicloroetano, clorobenzeno, bromobenzeno, diclorobenzeno, clorotolueno, triclorobenzeno; álcoois, tais como metanol, etanol, isopropanol, butanol; éteres, tais como éter etilpropílico, éter metil-terc-butílico, 5 éter n-butílico, anisol, fenetol, éter clorohexilmetílico, éter dimetílico, éter dietílico, éter dipropílico, éter diisopropílico, éter di-n-butílico, éter diisobutílico, éter diisoamílico, éter etilenoglicoldimetílico, tetrahidrofurano, dioxano, éter diclorodietílico e poliéter do óxido de etileno e/ou óxido de propileno; aminas, tais como trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, N-metilmorfolina, piridina e 10 tetrametilenodiamina; hidrocarbonetos nitrogenados, tais como nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenzeno, cloronitrobenzeno, o-nitrotolueno; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, butironitrila, isobutironitrila, benzonitrila, m-clorobenzonitrila, bem como compostos, tais como dióxido de tetrahidrotiofeno e dimetilsulfóxido, tetrametilenossulfóxido, dipropilsulfóxido, 15 benzilmetilsulfóxido, diisobutilsulfóxido, dibutilsulfóxido, diisoamilsulfóxido; sulfonas, tais como dimetil-, dietil-, dipropil-, dibutil-, difenil-, dihexil-, metil-etil-, etilpropil-, etilisobutil- e pentametilenossulfona; hidrocarbonetos alifáticos, cicloalifáticos ou aromáticos, tais como pentano, hexano, heptano, octano, nonano e hidrocarbonetos técnicos; por exemplo, os chamados "white 20 spirits" com componentes com pontos de ebulição na faixa de, por exemplo, 40°C até 250°C, cymol, frações de benzina dentro de um intervalo de ebulição de 70°C até 190°C, ciclohexano, metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, octano, benzeno, tolueno, clorobenzeno, bromobenzeno, nitrobenzeno, xileno; ésteres, tais como acetato de metila, etila, butila, isobutila, bem 25 como dimetil-, dibutil-, etilenocarbonato; amidas, tais como triamina de ácido hexametilenofosfórico, formamida, N-metil-formamida, N,N-dimetil-formamida, N,N-dipropil-formamida, N,N-dibutil-formamida, N-metil-pirrolidina, N-metil-caprolactama, 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahydro-2(1H)-pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactama, 1,3-dimetil-2-imidazolinodiona, 30 N-formil-piperidina, N,N'-1,4-diformil-piperazina; cetonas, tais como acetona, acetofenona, metiletilcetona, metilbutilcetona.

No processo de acordo com a invenção, também podem ser u-

sadas misturas dos solventes e diluentes mencionados.

Diluentes preferidos para efetuar o processo de acordo com a invenção, contudo, são hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, clorobenzeno, bromobenzeno, nitrobenzeno ou xileno, especialmente  
5 benzeno e tolueno.

Em geral, a preparação de compostos da fórmula (I) de acordo com o processo de preparação 1 é efetuada de maneira tal, que compostos da fórmula (II) são reagidos com compostos da fórmula (III) na presença de um coadjuvante ácido em um diluente.

10 A duração da reação importa geralmente em 10 minutos até 48 horas.

A reação é efetuada a temperaturas entre  $-10^{\circ}\text{C}$  e  $+200^{\circ}\text{C}$ , preferivelmente entre  $+10^{\circ}\text{C}$  e  $180^{\circ}\text{C}$ , de modo particularmente preferido, entre  $20^{\circ}\text{C}$  e  $140^{\circ}\text{C}$ . Preferivelmente, trabalha-se sob condições de reação, que  
15 possibilitam a separação ou remoção de água, por exemplo, com auxílio de um separador de água ou com adição de peneiras moleculares adequadas, que permitem, igualmente, a remoção de água.

Fundamentalmente, é possível trabalhar sob pressão normal. Preferivelmente, trabalha-se a pressão normal ou em pressões de até 15 bar  
20 e eventualmente sob atmosfera de gás protetor (nitrogênio, hélio ou argônio).

Para efetuar o processo 1 de acordo com a invenção, utiliza-se por mol de composto da fórmula (II), em geral, 0,5 a 4,0 mol, preferivelmente 0,7 a 3,0 mol, de modo particularmente preferido, 1,0 a 2,0 mol de composto  
25 amino da fórmula (III).

Além disso, para efetuar o processo 1 de acordo com a invenção, acrescentam-se, em geral, quantidades catalíticas de um coadjuvante ácido.

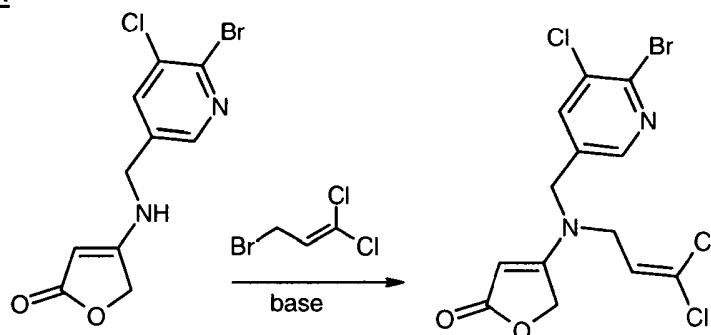
Como coadjuvantes ácidos tomam-se em consideração, por exemplo, ácido p-toluenossulfônico ou ácido acético.  
30

Após a conclusão da reação, concentra-se toda a preparação de reação. Os produtos obtidos após o processamento podem ser purificados

de maneira convencional através de recristalização, destilação a vácuo ou cromatografia de coluna (compare também os exemplos de preparação).

Se no processo 2 de acordo com a invenção, para a preparação dos novos compostos da fórmula (I), são utilizados como composto da fórmula (Ia), por exemplo, 4-[[[6-bromo-5-cloro-piridin-3-il)metil]amino]furan-2(5H)-ona e como composto da fórmula (IV), 1-bromo-1,1-dicloro-prop-1-eno, então o processo de preparação 2 pode ser representado pelo seguinte esquema de reação VI:

Esquema VI:



Os compostos necessários como materiais de partida para a realização do processo 2 de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (Ia).

Nessa fórmula (Ia), A, B, R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> representam preferivelmente aqueles radicais, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula geral (I) de acordo com a invenção, como substituintes preferidos.

Os compostos da fórmula (Ia) podem ser obtidos pelo processo de preparação 1 descrito mais acima, por exemplo, através da reação de compostos da fórmula (II) com compostos da fórmula (III), na qual R<sup>1</sup> representa hidrogênio.

Outros compostos a serem usados como materiais de partida para a realização do processo 2 de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (IV).

Na fórmula (IV), E e R<sup>1</sup> têm os significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção.

Os compostos da fórmula (IV) podem ser obtidos, em parte, comercialmente ou por métodos conhecidos da literatura (compare, por exemplo, 1-bromo-1,1-dicloro-propeno: WO 8800183 A1 (1988); compostos da fórmula (IV), na qual E representa halogênio, tal como cloro, bromo e iodo:

5 Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, volume V/3, Georg Thieme Verlag Stuttgart, página 503 e volume V/4, página 13, 517; E representa mesilato; Crossland, R. K., Servis, K. L. J. Org. Chem. (1970), 35, 3195; E representa tosilato: Roos, A. T. e outros, Org. Synth., Coll. Vol. I, (1941), 145; Marvel, C. S., Sekera, V. C. Org. Synth. Coll. Vol. III, (1955), 366.

10 Em geral, é vantajoso, efetuar o processo de preparação 2 de acordo com a invenção, na presença de um diluente e eventualmente na presença de um agente auxiliar de reação básico.

De maneira vantajosa, os diluentes são usados em uma quantidade tal, que a mistura de reação continue bem agitada durante todo o processo. Como diluentes para realizar o processo 2 de acordo com a invenção,

15 tomam-se em consideração todos os solventes orgânicos inertes.

Diluentes preferidos para realizar o processo 2 de acordo com a invenção, são éteres, tais como éter metil-*terc*-butílico, éter *n*-butílico, anisol, fenetol, éter ciclohexilmetílico, éter diisopropílico, éter diisobutílico, éter diisobutílico, éter etilenoglicoldimetílico, tetrahidrofurano, dioxano, éter dicloro-

20 dietílico e poliéter do óxido de etileno e/ou óxido de propileno; amidas, tais como triamida de ácido hexametileno-fosfórico, formamida, *N*-metil-formamida, *N,N*-dimetil-formamida, *N,N*-dipropil-formamida, *N,N*-dibutil-formamida; hidrocarbonetos aromáticos, tais como *N*-metil-benzeno, tolueno,

25 clorobenzeno, bromobenzeno, nitrobenzeno, xileno; cetonas, tais como acetona, acetofenona, metiletilcetona ou metilbutilcetona.

No processo 2 de acordo com a invenção, também podem ser usadas misturas dos solventes e diluentes mencionados.

Diluentes preferidos para realizar o processo 2 de acordo com a

30 invenção, são, contudo, éteres, tais como éter metil-*terc*-butílico ou éteres cíclicos, tais como tetrahidrofurano e dioxano, amidas, tal como *N,N*-dimetil-formamida, hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno ou tolueno; ce-

tonas, tais como acetona, metiletilcetona ou metilbutilcetona.

Como agentes auxiliares de reação básicos para realizar o processo 2 de acordo com a invenção, podem ser usados todos os agentes ligantes de ácidos adequados, tais como aminas, especialmente aminas terciárias, bem como compostos de metal alcalino e alcalino-terroso.

Para esse fim, sejam mencionados, por exemplo, os hidróxidos, hidretos, óxidos e carbonatos do lítio, sódio, potássio, magnésio, cálcio e bário, além disso, outros compostos básicos, tais como bases de amidina ou bases de guanidina, tais como 7-metil-1,5,7-triaza-biciclo(4,4,0)dec-5-eno (MTBD), diazabicyclo(4,3,0)noneno (DBN), diazabicyclo(2,2,2)octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo(5,4,0)undeceno (DBU), ciclohexiltetrabutyl-guanidina (CyTBG), ciclohexiltetrametil-guanidina (CuTMG), N,N,N,N-tetrametil-1,8-naftalenodiamina, pentametilpiperidina, aminas terciárias, tais como trietilamina, trimetilamina, tribenzilamina, triisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-toluidina, N,N-dimetil-p-aminopiridina, N-metil-pirrolidina, N-metil-piperidina, N-metilimidazol, N-metil-pirazol, N-metil-morfolina, N-metil-hexametilenodiamina, piridina, 4-pirrolidino-piridina, 4-dimetilamino-piridina, quinolina,  $\alpha$ -picolina,  $\beta$ -picolina, isoquinolina, pirimidina, acridina, N,N,N',N'-tetrametilenodiamina, N,N,N',N'-tetraetilenodiamina, quinoxalina, N-propil-diisopropilamina, N-etil-diisopropilamina, N,N'-dimetil-ciclohexilamina, 2,6-lutidina, 2,4-lutidina ou trietildiamina.

Preferivelmente, utilizam-se hidretos do lítio ou sódio.

Em geral, a duração da reação importa em 10 minutos a 48 horas.

A reação é efetuada a temperaturas entre  $-10^{\circ}\text{C}$  e  $+200^{\circ}\text{C}$ , preferivelmente entre  $+10^{\circ}\text{C}$  e  $180^{\circ}\text{C}$ , de modo particularmente preferido, entre  $60^{\circ}\text{C}$  e  $140^{\circ}\text{C}$ . Fundamentalmente, é possível trabalhar sob pressão normal. Preferivelmente, trabalha-se a pressão normal ou a pressões de até 15 bar e eventualmente sob atmosfera de gás protetor (nitrogênio, hélio ou argônio).

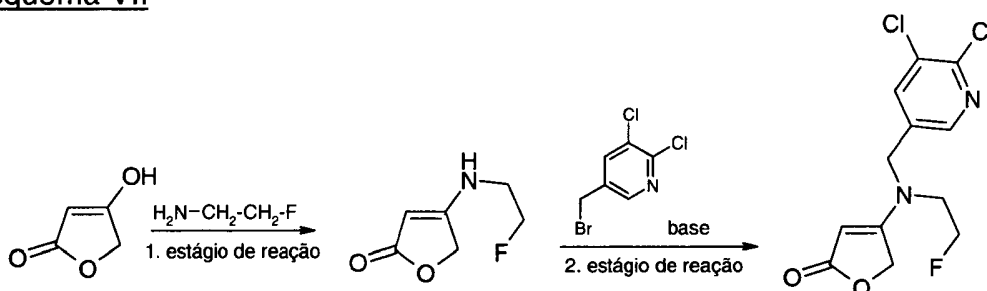
Para realizar o processo 2 de acordo com a invenção, utilizam-se por mol de composto da fórmula (II), geralmente 0,5 a 4,0 mol, preferi-

velmente 0,7 a 3,0 mol, de modo particularmente preferido, 1,0 a 2,0 mol de agente de alquilação da fórmula geral (IV).

Após a conclusão da reação, concentra-se toda a preparação da reação. Os produtos obtidos após o processamento, podem ser purificados de maneira convencional através de cristalização, destilação a vácuo ou  
5 cromatografia de coluna (compare também os exemplos de preparação).

Se no processo 3 de acordo com a invenção, para a preparação dos novos compostos da fórmula (I) em um primeiro estágio de reação é utilizado, por exemplo, o ácido tetrônico como composto da fórmula (II) e como  
10 composto da fórmula (V) o cloridrato de 2-fluoretilamina e em um segundo estágio de reação a 4-[(2-fluoretil)amino]furan-2(5H)-ona como composto formado da fórmula geral (VI), que é N-alquilada com compostos da fórmula (VII), por exemplo, 3-bromometil-5,6-dicloro-piridina, então o processo de preparação 3 pode ser representado pelo seguinte esquema de reação VII:

15 Esquema VII



Os compostos necessários como materiais de partida para a realização o processo 3 de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (II) e já detalhadamente descritos no contexto com o processo 1 mencionado mais acima.

20 Outros compostos a serem usados como materiais de partida para a realização do processo 3 de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (V).

Na fórmula (V), R<sup>1</sup> tem o significado que já foi mencionado no contexto com a descrição das substâncias da fórmula geral (I) de acordo  
25 com a invenção.

Os compostos amino da fórmula (V) são definidos de modo geral e em muitos casos podem ser obtidos, em parte, comercialmente ou de ma-

neira em si conhecida de acordo com a reação de "Leuckart-Wallach (por exemplo, 2-flúor-etilamina: patente US 4030994 (1977); compostos da fórmula geral V, na qual R<sup>1</sup> representa alquila, aminas primárias: compare, por exemplo, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, volume XI/1" 4<sup>a</sup> edição 1957, G. Thieme Verlag, Stuttgart, página 648; M. L. Moore em "The Leuckart Reaction" em: Organic Reactions, volume 5, 2<sup>a</sup> edição 1952, Nova York, John Wiley & Sons, Inc. Londres).

Em geral, é vantajoso, efetuar o primeiro estágio de reação do processo de preparação 3 de acordo com a invenção, na presença de dilu-  
10 entes. De maneira vantajosa, os diluentes são usados em uma quantidade tal, que a mistura de reação continua bem agitável durante todo o processo. Como diluentes para realizar o processo 3 de acordo com a invenção, tomam-se em consideração todos os solventes orgânicos inertes.

Diluentes preferidos para a realização do processo 3 de acordo com a invenção, são hidrocarbonetos aromáticos, tais como benzeno, tolueno, clorobenzeno, bromobenzeno, nitrobenzeno ou xileno, especialmente benzeno e tolueno.

No segundo estágio de reação, os compostos da fórmula (VI) são N-alquilados com compostos da fórmula (VII).

Em geral, é vantajoso, efetuar o segundo estágio de reação do processo de preparação 3 de acordo com a invenção, na presença de dilu-  
20 entes e na presença de agentes auxiliares de reação básicos.

De maneira vantajosa, os diluentes são usados em uma quantidade tal, que a mistura de reação continue bem agitável durante todo o pro-  
25 cesso. Como diluentes para realizar o processo 3 de acordo com a invenção, tomam-se em consideração todos os solventes orgânicos inertes.

Como diluentes para o segundo estágio de reação, tomam-se em consideração, por exemplo, éteres, tais como tetrahidrofurano ou dioxano.

Como agentes auxiliares de reação básicos para o segundo estágio de reação, tomam-se em consideração bases fortes, tal como, por exemplo, hidreto de sódio.

Em geral, a duração da reação importa em 10 minutos a 48 horas.

A reação é efetuada a temperaturas entre  $-10^{\circ}\text{C}$  e  $+200^{\circ}\text{C}$ , preferivelmente entre  $+10^{\circ}\text{C}$  e  $180^{\circ}\text{C}$ , de modo particularmente preferido entre 5  $60^{\circ}\text{C}$  e  $140^{\circ}\text{C}$ . Preferivelmente, trabalha-se sob condições de reação, que possibilitam a separação ou remoção de água, por exemplo, com auxílio de um separador de água.

Após a conclusão da reação, toda a preparação de reação é concentrada. Os produtos obtidos após o processamento podem ser purifi- 10 cados de maneira convencional através de recristalização, destilação a vácuo ou cromatografia de coluna (compare também os exemplos de preparação).

Os compostos da fórmula (I) podem estar eventualmente presentes em diversas formas polimorfas ou como mistura de diversas formas 15 polimorfas. Tanto os polimorfos puros, como também as misturas de polimorfos são objeto da invenção e podem ser usados de acordo com a invenção.

As substâncias ativas de acordo com a invenção, com boa tolerância pelas plantas, toxicidade favorável para animais de sangue quente e 20 boa tolerância pelo meio ambiente, são adequadas para proteger plantas e órgãos de plantas, para aumentar o rendimento da colheita, melhorar a qualidade do material colhido e para combater parasitas animais, especialmente insetos, aracnídeos, helmintos, nematódios e moluscos, que ocorrem na a- gricultura, na horticultura, na pecuária, em florestas, em jardins e instalações 25 de lazer, na proteção de alimentos armazenados e material, bem como no setor higiênico. Elas podem ser preferivelmente usadas como preparados para proteger plantas. Elas são eficazes contra espécies normalmente sensíveis e resistentes, bem como contra todos ou alguns estágios de desenvolvimento. Nos parasitas mencionados acima incluem-se:

30 Da ordem dos Anoplura (Phthiraptera), por exemplo, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

Da classe dos Arachnida, por exemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

Da classe dos Bivalva, por exemplo, *Dreissena* spp.

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

Da ordem dos Coleoptera, por exemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

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

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

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

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

Da classe dos Gastropoda, por exemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

Da classe dos helmintos, por exemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosomen* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudospiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

Além disso, é possível combater protozoários, tal como *Eimeria*.

Da ordem dos Heteroptera, por exemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Helipeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*,

Lygus spp., *Macropes excavatus*, Miridae, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., Pentomidae, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

- 5 Da ordem dos Homoptera, por exemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*,
- 10 *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneoccephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, Cercopidae, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina*
- 15 spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*,
- 20 *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*,
- 25 *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*,
- 30 *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Triozza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.

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

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

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

Da ordem dos Lepidoptera, por exemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis*  
 10 *blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.  
 15

Da ordem dos Orthoptera, por exemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Grylloblatta* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.  
 25

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

Da ordem dos Symphyla, por exemplo, *Scutigera* spp.

Da ordem dos Thysanoptera, por exemplo, *Baliothrips biformis*,  
 30 *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphoro* spp., *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

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

Os nematódios fitoparasitários incluem, por exemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Helicotylenchus* spp., *Heterodera* spp.,  
5 *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*,  
*Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus*  
spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

Os compostos de acordo com a invenção, podem ser usados, eventualmente em certas concentrações ou quantidades de aplicação, tam-  
10 bém como herbicidas, protetores, reguladores do crescimento ou agentes  
para melhorar as propriedades próprias das plantas ou como microbicidas,  
por exemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (inclusive  
agentes contra viróides) ou como agentes contra MLO (mycoplasma-like-  
organism) e RLO (Rickettsia-like-organism). Eventualmente, eles podem ser  
15 aplicados, também, como produtos intermediários ou pré-produtos para a  
síntese de outras substâncias ativas.

As substâncias ativas podem ser convertidas para as formula-  
ções usuais, tais como soluções, emulsões, pós de pulverização, suspen-  
sões à base de água e óleo, pós, pós de espalhamento, pastas, pós solú-  
20 veis, granulados solúveis, granulados de espalhamento, concentrados de  
suspensão-emulsão, substâncias naturais impregnadas de substância ativa,  
substâncias sintéticas impregnadas de substância ativa, adubos, bem como  
encapsulamentos finíssimos em substâncias polímeras.

Essas formulações são preparadas de maneira conhecida, por  
25 exemplo, misturando as substâncias ativas com diluentes, isto é, solventes  
líquidos e/ou veículos sólidos, eventualmente com o uso de agentes tensoa-  
tivos, isto é, emulsificantes e/ou agentes de dispersão e/ou agentes produ-  
tores de espuma. A preparação das formulações é efetuada ou em instalações  
adequadas ou também antes ou durante a aplicação.

30 Como coadjuvantes podem ser usadas aquelas substâncias, que  
são adequadas, para conferir propriedades particulares à própria combina-  
ção e/ou às preparações derivadas da mesmas (por exemplo, caldos de pul-

verização, desinfecção de semente), tais como determinadas propriedades técnicas e/ou também propriedades biológicas particulares. Como coadjuvantes típicos tomam-se em consideração: diluentes, solventes e veículos.

Como diluentes prestam-se, por exemplo, água, líquidos químicos orgânicos polares e apolares, por exemplo, das classes dos hidrocarbonetos aromáticos e não aromáticos (tais como parafinas, alquilbenzenos, alquilnaftalenos, clorobenzenos), dos álcoois e polióis (que também podem ser eventualmente substituídos, eterificados e/ou esterificados), das cetonas (tais como acetona, ciclohexanona), ésteres (também lipídios e óleos) e (poli-)éteres, das aminas simples e substituídas, amidas, lactamas (tais como N-alquilpirrolidonas) e lactonas, das sulfonas e sulfóxidos (tal como dimetilsulfóxido).

No caso de usar água como diluente, por exemplo, solventes orgânicos também podem ser usados como solventes auxiliares. Como solventes líquidos tomam-se essencialmente em consideração: compostos aromáticos, tais como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, compostos aromáticos clorados e hidrocarbonetos alifáticos clorados, tais como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno, hidrocarbonetos alifáticos, tais como ciclohexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, óleos minerais e vegetais, álcoois, tais como butanol ou glicol, bem como seus éteres e ésteres, cetonas, tais como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona ou ciclohexanona, solventes fortemente polares, tal como dimetilsulfóxido, bem como água.

Como veículos sólidos tomam-se em consideração: por exemplo, sais de amônio e pós de pedras naturais, tais como caulim, aluminas, talco, giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terra de infusórios e pós de pedras sintéticas, tais como ácido silícico altamente disperso, óxido de alumínio e silicatos, como veículos sólidos para granulados tomam-se em consideração: por exemplo, pós de pedras naturais quebradas e fracionadas, tais como calcita, mármore, pedra-pomes, sepiolita, dolomita, bem como granulados sintéticos de farinhas inorgânicas e orgânicas, bem como granulados de material orgânico, tal como papel, serragem, cascas de coco,

espigas de milho e caules de tabaco; como emulsificantes e/ou agentes produtores de espuma, tomam-se em consideração: por exemplo, emulsificantes não-ionogêneos e aniônicos, tais como éster de ácido polioxietileno-graxo, éter de álcool polioxietileno-graxo, por exemplo, éter alquilaril-poliglicólico, sulfonatos de alquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de arila, bem como hidrolisados de albumina; como agentes de dispersão tomam-se em consideração substâncias não-iônicas e/ou iônicas, por exemplo, das classes dos éteres de álcool-POE e/ou POP, ésteres de ácido e/ou ésteres de POP-POE, éteres alquil-arílicos e/ou POP-POE, produtos de adição de lipídios e/ou POP-POE, derivados POE- e/ou POP-poliol, produtos de adição de POE- e/ou POP-sorbitano ou açúcar, sulfatos de alquila ou arila, sulfonatos e fosfatos ou os produtos de adição de PO-éteres correspondentes. Oligopolímeros ou polímeros adequados são, além disso, por exemplo, partindo de monômeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO e/ou PO individuais ou em combinação com, por exemplo, (poli-) álcoois ou (poli-)aminas. Além disso, podem ser usados a lignina e seus derivados de ácido sulfônico, celuloses simples e modificadas, ácidos sulfônicos aromáticos e/ou alifáticos, bem como seus produtos de adição com formaldeído.

Nas formulações podem ser usados adesivos, tais como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos, pulverizados, granulados ou em forma de látex, tais como goma arábica, álcool polivinílico, acetato de polivinila, bem como fosfolipídios naturais, tais como cefalinas e lecitinas e fosfolipídios sintéticos.

É possível usar corantes, tais como pigmentos inorgânicos, por exemplo, óxido de ferro, óxido de titânio, azul de ferrociano e corantes orgânicos, tais como corantes de alizarina, azocorantes e corantes de ftalocianina de metal e traços de substâncias nutritivas, tais como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

Outros aditivos podem ser perfumes, óleos minerais ou vegetais eventualmente modificados, ceras e nutrientes (também oligonutrientes), tais como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

Além disso, podem estar contidos estabilizadores, tais como es-

tabilizadores de baixa temperatura, conservantes, agentes de proteção contra oxidação, agentes de proteção solar ou outros agentes químicos e/ou físicos aperfeiçoadores de estabilidade.

Em geral, as formulações contêm entre 0,01 e 98 % em peso, de substância ativa, preferivelmente entre 0,5 e 90 %.

A substância ativa de acordo com a invenção, pode estar presente em suas formulações disponíveis comercialmente bem como nas formas de aplicação preparadas a partir dessas formulações em mistura com outras substâncias ativas, tais como inseticidas, engodos, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematicidas, fungicidas, substâncias reguladoras do crescimento, herbicidas, protetores, adubos ou semioquímicos.

Participantes de mistura particularmente favoráveis são, por exemplo, os seguintes:

Fungicidas:

- 15                    inibidores da síntese do ácido nucléico  
                           benalaxil, benalaxil-M, bupirimat, quiralexil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico,
- Inibidores da mitose e divisão celular
- 20                    benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicluron, tiabendazol, tiofanato-metila, zoxamida
- Inibidores do complexo da cadeia respiratória I  
                           diflumentorim
- Inibidores do complexo da cadeia respiratória II
- 25                    boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxin, pentiopirad, tifuluzamid
- Inibidores do complexo da cadeia respiratória III  
                           azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadon, fenamidon, fluoxastrobin, kresoxim-metila, metominostrobin, orisastrobin,
- 30                    piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin
- Desacopladores  
                           dinocap, fluazinam

- Inibidores da produção de ATP  
acetato de fentina, cloreto de fentina, hidróxido de fentina, siltio-  
fam
- 5 Inibidores da biossíntese de aminoácidos e proteína  
andoprim, blasticidin-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrato de clo-  
ridrato de kasugamicina, mepanipirim, pirimetanil
- Inibidores da transdução de sinais  
fenciclonil, fludioxonil, quinoxifen
- 10 Inibidores da síntese lipídica e membrana  
clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin  
ampropilfos, potássio-ampropilfos, edifenfos, iprobenfos (IBP),  
isoprotiolan, pirazofos  
tolclofos-metila, bifenila  
iodocarb, propamocarb, cloridrato de propamocarb
- 15 Inibidores da biossíntese do ergosterol  
fenexamida,  
azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutra-  
zol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol,  
fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis,  
20 hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobu-  
trazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol,  
tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol,  
imazalila, sulfato de imazalila, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol,  
pirifenox, triforin, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,  
25 aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tride-  
morf, fenpropidin, spiroxamina,  
naftifin, piributicarb, terbinafin.
- Inibidores da síntese da parede celular  
bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polio-  
30 xins, polioxorim, validamicina A
- Inibidores da biossíntese de melanina  
capropamida, diclocimet, fenoxanil, ftalid, piroquilon, triciclazol

## Indução de resistência

acibenzolar-S-metila, probenazol, tiadinil

## Multisite

captafol, captan, clorotalonil, sais de cobre, tais como: hidróxido  
 5 de cobre, naftenato de cobre, oxicloreto de cobre, sulfato de cobre, óxido de  
 cobre, oxin-cobre e mistura de Bordeaux, diclofluanid, ditianon, dodin, base  
 livre de dodin, ferbam, folpet, fluorofolpet, guazatina, acetato de guazatina,  
 iminocadin, iminocadinalbesilato, triacetato de iminocadin, mancobre,  
 mancozeb, maneb, metiram, metiram zinco, propineb, enxofre e preparados  
 10 de enxofre contendo polissulfeto de cálcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram.

## Mecanismo desconhecido

amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvon, quinome-  
 tionato, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb,  
 diclomezina, diclorofeno, dicloran, difenzoquat, sulfato de difenzoquat metila,  
 15 difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, flu-  
 oroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, me-  
 tassulfocarb, metrafenona, metil isotiocianato, mildiomicina, natamicina, di-  
 metilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropila, octilnon, oxamocarb, oxi-  
 fentiina, pentaclorofenol e sais, 2-fenilfenol e sais, piperalina, propanosin-  
 20 sódio, proquinazida, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazen, triazóxi-  
 do, triclamida, zarilamida e 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-  
 cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-benzenossulfonamida, 2-amino-4-metil-N-  
 fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-  
 3-piridinocarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina,  
 25 cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-  
 metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluormetil)-fenil]-etiliden]-amino]-oxi]-metil]-fenil]-  
 3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-  
 il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metila, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinodicarbonitrila,  
 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)-imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetilen)-  
 30 benzacetato de metila, 4-cloro-alfa-propiniloxi-N-[2-[3-metoxi-4-(2-  
 propiniloxi)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-  
 propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-

cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorfenil)[1,2,4]triazolo[1,5-  
 a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorfenil)-N-[(1R)-1,2,2-  
 trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2,2-  
 dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorfenil) [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-  
 5 (5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-  
 cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-  
 benzopiranon-4-ona, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)-imino][6-(difluormetoxi)-2,3-  
 difluorfenil]metil}-2-benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-  
 formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3(1-flúor-2-feniletil)oxi] fenil] etili-  
 10 den]amino]oxi]metil]-alfa-(metoximino)-N-metil-alfaE-benzacetamida, N-{2-[3-  
 cloro-5-(trifluormetil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluormetil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-  
 5-fluorbifenil-2-il)-3-(difluormetil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-  
 metoxi-3-piridinil)-ciclopropan carboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-  
 2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-  
 15 metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotióico, 2-(2-[[6-(3-  
 cloro-2-metilfenoxi)-5-fluorpirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoximino)-N-  
 metilacetamida.

Bactericidas:

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de ní-  
 20 quel, kasugamicina, octilnon, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probe-  
 nazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de  
 cobre.

Inseticidas / acaricidas / nematicidas:

Inibidores de acetilcolinesterase (AChE)  
 25 carbamatos,  
 por exemplo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, amino-  
 carb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxi-  
 carboxim, carbarila, carbofuran, carbossulfan, cloetocarb, dimetilan, etiofen-  
 carb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoproc carb, metam-  
 30 sódio, metiocarb, metomila, metolcarb, oxamila, pirimicarb, promecarb, pro-  
 poxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamato

Organofosfatos,

por exemplo, acefato, azametifos, azinfos (-metila, -etila), bromo-  
 fos-etila, bromofenvinfos (-metila), butatiofos, cadusafos, carbofenotion, clo-  
 retoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metila/-etila), coumafos, ciano-  
 fenfos, cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metila, demeton-S-metilsulfona,  
 5 dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dime-  
 tilvinfos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, famfur,  
 fenamifos, fenitrothion, fensulfotion, fention, flupirazofos, fonofos, formotion,  
 fosmetilan, fostiazato, heptenofos, iodofenfos, iprobenfos, isazofos, isofen-  
 fos, O-salicilato de isopropila, isoxation, malation, mecarbam, metacrifos,  
 10 metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxide-  
 meton-metila, paration (-metila/-etila), fentoato, forato, fosalon, fosmet, fos-  
 famidon, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metila/-etila), profenofos, propafos, pro-  
 petamfos, protiofos, protoato, piraclufos, piridafention, piridation, quinalfos,  
 sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos,  
 15 tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion.

Moduladores do canal de sódio / bloqueadores do canal de sódio dependentes de tensão

Piretróides,

por exemplo, acrinatrin, aletrin (d-cis-trans, d-trans), beta-  
 20 ciflutrin, bifentrin, bioaletrin, isômero de bioaletrin-S-ciclopentila, bioetanome-  
 trin, biopermetrin, bioresmetrin, clovaportrin, cis-cipermetrin, cis-resmetrin,  
 cis-permetrin, clocitrin, cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cipermetrin (alfa, beta,  
 teta, zeta), cifenotrin, deltametrin, empentrin (isômero 1R), esfenvalerato,  
 etofenprox, fenflutrin, fenpropatrin, fenpiritrin, fenvalerato, flubrocitrinato, flu-  
 25 citrinato, flufenprox, flumetrin, fluvalinato, fubfenprox, gama-cihalotrin, impro-  
 trin, kadetrin, lambda-cihalotrin, metoflutrin, permetrin (cis-, trans-), fenotrin  
 (isômero 1R-trans), praletrin, proflutrin, protrifenbuto, piresmetrin, resmetrin,  
 RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinate, teflutrin, teraletrin, tetrametrin (isômero  
 1R), tralometrin, transflutrin, ZXI 8901, piretrins (piretrum)

30 DDT

Oxadiazinas,

por exemplo, indoxacarb,

- Semicarbazonas,  
 por exemplo, metaflumizona (BAS 3201)
- Agonistas/antagonistas do receptor acetilcolina  
 cloronicotinilas,  
 5 por exemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid,  
 nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, imidacloriz, AKD-1022, tiametoxam.
- Nicotina, bensultap, cartap
- Moduladores do receptor acetilcolina  
 spinosina,  
 10 por exemplo, spinosad, spinetoram (XDE-175)
- Antagonistas do canal de cloreto regulado por GABA  
 organoclorinas,  
 por exemplo, camfeclor, clordano, endosulfan, gama-HCH, HCH,  
 heptacloro, lindano, metoxiclor
- 15 Fipróis  
 por exemplo, acetoprol, etiprol, fipronil, pirafloprol, piriprolo, vaniliprolo
- Ativadores do canal de cloreto  
 mectinas,  
 20 por exemplo, avermectina, emamectina, benzoatos de emamectina,  
 ivermectina, lepimectina, milbemicina.
- Miméticos do hormônio juvenil,  
 por exemplo, diofenolan, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno,  
 kinopreno, metopreno, piriproxifen, tripreno.
- 25 Agonistas/disruptores de ecdison  
 diacil-hidrazinas,  
 por exemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebu-  
 fenozida
- Inibidores da biossíntese de quitina  
 30 benzoiluréias,  
 por exemplo, bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluazuron,  
 flucicloخورon, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumu-

- ron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron
- buprofezina
- ciromazina
- Inibidores da fosforilação oxidativa, disruptores de ATP
- 5 diafentiuron
- Compostos organoestanho,  
por exemplo, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina
- Desacopladores da fosforilação oxidativa mediante interrupção  
do gradiente do próton H
- 10 pirróis,  
por exemplo, clorfenapir
- Dinitrofenóis,  
por exemplo, binapacril, dinobuton, dinocap, DNOC
- Inibidores do transporte de elétrons do lado I
- 15 METI'S,  
por exemplo, fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben,  
tebufenpirad, tolfenpirad
- Hidrametilnon
- Dicofol
- 20 Inibidores do transporte de elétrons do lado II
- rotenona
- Inibidores do transporte de elétrons do lado III
- acequinocil, fluacripirim
- Disruptores microbianos da membrana intestinal de insetos
- 25 cepas de *Bacillus thuringiensis*
- Inibidores da síntese de lipídios
- ácidos tetrônicos,  
por exemplo, spirodiclofen, spiromesifen
- Ácidos tetrâmicos,
- 30 por exemplo, spirotetramato
- Carboxamidas,  
por exemplo, flonicamid

- Agonistas octopaminérgicos,  
por exemplo, amitraz
- Inibidores da ATPase estimulada pelo magnésio,  
por exemplo, propargite
- 5 Análogos de nereistoxina  
por exemplo, hidrogeno oxalato de tiociclâm, tiossultap-sódio
- Agonistas do receptor rianodina,  
dicarboxamidas de ácido benzóico,  
por exemplo, flubendiamida
- 10 antranilamidas,  
por exemplo, rinaxapir (3-bromo-N-{4-cloro-2-metil-6-  
[(metilamino)carbonil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida)
- Biológicos, hormônios ou feromônios  
azadiractin, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, Codlemone, *Metar-*  
15 *rhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, *Thuringiensin*, *Verticillium spec.*
- Substâncias ativas com mecanismos de ação desconhecidos ou  
não específicos
- Agentes de gaseificação,  
por exemplo, fosfetos de alumínio, brometos de metila, fluoretos
- 20 de sulfurila
- Inibidores de devoração,  
por exemplo, criolita, flonicamid, pimetrozina
- Inibidores do crescimento de ácaros,  
por exemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox
- 25 amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropila-  
to, buprofezin, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrin, clo-  
tiazoben, ciclopreno, cifluometofeno, diciclanil, fenoxacrim, fentrifanil, fluben-  
zimina, flufenerim, flutenzin, Gossylplure, hidrametilnona, japonilure, meto-  
xadiazinona, petróleo, butóxido de piperonila, oleato de potássio, piridalil,
- 30 sulfluramid, tetradifon, tetrasul, triaratene, verbutin.
- Também é possível uma mistura com outras substâncias ativas  
conhecidas, tais como herbicidas, adubos, reguladores do crescimento, pro-

tetores, produtos semi-químicos ou também com agentes para melhorar as características próprias das plantas.

Quando usadas como inseticidas, as substâncias ativas de acordo com a invenção, podem estar presentes, além disso, em suas formulações disponíveis no comércio, bem como nas formas de aplicação preparadas a partir dessas formulações em mistura com sinergistas. Sinergistas são compostos, através dos quais o efeito das substâncias ativas aumenta, sem que o próprio sinergista acrescentado precise ser ativamente eficaz.

Quando usadas como inseticidas, as substâncias ativas de acordo com a invenção, podem estar presentes, além disso, em suas formulações disponíveis no comércio, bem como nas formas de aplicação preparadas a partir dessas formulações em mistura com substâncias inibidoras, que reduzem uma degradação da substância ativa após a aplicação nos arredores da planta, na superfície de partes da planta ou em tecidos vegetais.

O teor da substância ativa das formas de aplicação preparadas a partir das formulações disponíveis no comércio pode variar em amplos limites. A concentração da substância ativa das formas de aplicação pode encontrar-se de 0,00000001 até 95 % em peso, de substância ativa, preferivelmente entre 0,00001 e 1 % em peso.

A aplicação ocorre de maneira usual adaptada a uma das formas de aplicação.

De acordo com a invenção, todas as plantas e partes das plantas podem ser tratadas. Neste caso, entendem-se por plantas, todas as plantas e populações de plantas, como plantas selvagens ou plantas cultivadas desejáveis e indesejáveis (inclusive plantas cultivadas de origem natural). Plantas cultivadas podem ser plantas, obtidas por métodos de cultivo e otimização convencionais ou por métodos biotecnológicos e genéticos ou combinações destes métodos, inclusive das plantas transgênicas e inclusive das espécies de plantas protegíveis ou não-protegíveis por leis de proteção de espécie. Por partes de plantas devem ser entendidas todas as partes aéreas e subterrâneas e órgãos das plantas, tais como broto, folha, flor e raiz, sendo enumerados por exemplo, folhas, espinhos, caules, troncos, flores, corpo

do fruto, frutos e sementes, bem como raízes, tubérculos e rizomas. Nas partes das plantas incluem-se também material de colheita bem como material de crescimento vegetativo e generativo, por exemplo, estacas, tubérculos, rizomas, tanchões e sementes.

5 O tratamento das plantas e partes das plantas com as combinações de substâncias ativas de acordo com a invenção, é efetuado diretamente ou pela ação sobre seu meio, espaço vital ou depósito conforme os métodos de tratamento usuais, por exemplo, por imersão, pulverização, evaporação, nebulização, espalhamento, revestimento e no caso do material de  
10 crescimento, especialmente no caso das sementes, além disso, através do revestimento de uma ou mais camadas.

As misturas de acordo com a invenção, são especialmente adequadas para o tratamento da semente. Nesse caso, mencionam-se preferivelmente as combinações de acordo com a invenção, mencionadas acima  
15 como preferidas ou particularmente preferidas. Dessa maneira, uma grande parte do dano causado pelos parasitas nas plantas cultivadas já ocorre através da infestação da semente durante o armazenamento ou após a introdução da semente no solo, bem como durante e imediatamente após a germinação das plantas. Essa fase é particularmente crítica, pois as raízes e re-  
20 bentos da planta em crescimento são particularmente sensíveis e já um pequeno dano pode levar à morte de toda a planta. Conseqüentemente, há um interesse especialmente grande em proteger a semente e a planta em germinação através do uso de composições adequadas.

O combate de parasitas através do tratamento da semente de  
25 plantas é conhecido há muito tempo e é objeto de constantes aperfeiçoamentos. Contudo, no tratamento da semente há uma série de problemas, que nem sempre podem ser satisfatoriamente resolvidos. Dessa maneira, é desejável desenvolver processos para proteger a semente e a planta em germinação, que tornem a aplicação adicional de preparados para proteger  
30 plantas supérflua após a sementeação ou após a emergência das plantas. Além disso, é desejável otimizar a quantidade da substância ativa usada de maneira tal, que a semente e planta em germinação seja protegida o melhor

possível contra a infestação por parasitas, sem, contudo, danificar a própria planta através da substância ativa usada. Especialmente os processos para o tratamento da semente deveriam incluir também as propriedades inseticidas intrínsecas de plantas transgênicas, para obter uma ótima proteção da semente e também da planta em germinação com um consumo mínimo de preparados para proteger plantas.

Por conseguinte, a presente invenção refere-se especialmente também a um processo para proteger semente e plantas em germinação contra a infestação de parasitas, em que a semente é tratada com uma composição de acordo com a invenção. Do mesmo modo, a invenção refere-se ao uso das composições de acordo com a invenção, para o tratamento de semente para proteger a semente e as plantas originadas das mesmas contra parasitas. Além disso, a invenção refere-se à semente, a qual foi tratada com uma composição de acordo com a invenção, para a proteção contra parasitas.

Uma das vantagens da presente invenção, é que com base nas propriedades sistêmicas particulares das composições de acordo com a invenção, o tratamento da semente com essas composições não protege somente a própria semente contra parasitas, mas sim, também as plantas originadas das mesmas após a emergência. Dessa maneira, o tratamento direto da cultura pode ser desnecessário no momento da sementeira ou pouco depois.

Do mesmo modo, considera-se como vantajoso, que as misturas de acordo com a invenção, podem ser usadas especialmente também na semente transgênica, sendo que as plantas originadas dessa semente são capazes para a expressão de uma proteína voltada contra os parasitas. Através do tratamento dessa semente com as composições de acordo com a invenção, certos parasitas já podem ser controlados através da expressão, por exemplo, da proteína inseticida e adicionalmente ser protegidas contra danos pelas composições de acordo com a invenção.

As composições de acordo com a invenção, são adequadas para proteger semente de qualquer espécie de planta, tal como já foi mencio-

nado acima, que é usada na agricultura, na estufa, em florestas ou na horticultura. Nesse caso, trata-se especialmente de semente de milho, amendoim, canola, colza, papoula, soja, algodão, nabo (por exemplo, beterraba sacarina e beterraba), arroz, painço, trigo, cevada, aveia, centeio, girassol, tabaco, batatas ou hortaliças (por exemplo, tomates, plantas de couve). Do mesmo modo, as composições de acordo com a invenção, são adequadas para o tratamento da semente de plantas frutíferas e hortaliças, tal como já citado acima. O tratamento da semente de milho, soja, algodão, trigo e canola ou colza assume um significado particular.

10 Tal como já citado acima, o tratamento de semente transgênica com uma composição de acordo com a invenção, também assume um significado particular. Nesse caso, trata-se da semente de plantas, que geralmente contêm pelo menos um gene heterólogo, que regula a expressão de um polipeptídeo com propriedades especialmente inseticidas. Os genes heterólogos na semente transgênica podem ser provenientes, nesse caso, de microorganismos, tais como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* ou *Gliocladium*. A presente invenção é particularmente adequada para o tratamento de semente transgênica, que contém pelo menos um gene heterólogo, que se origina de *Bacillus sp.* e cujo  
15 produto genético mostra eficácia contra *Ostrinia nubilalis* e/ou broca de raízes de milho. Nesse caso, trata-se de modo particularmente preferido, de um gene heterólogo, que se origina de *Bacillus thuringiensis*.

No âmbito da presente invenção, a composição de acordo com a invenção, é aplicada na semente sozinha ou em uma formulação adequada.  
25 Preferivelmente, a semente é tratada em um estado, no qual é tão estável, que não ocorrem danos no tratamento. Em geral, o tratamento da semente pode ser efetuado em qualquer momento entre a colheita e a semeadura. Normalmente, utiliza-se semente, que foi separada da planta e libertada de tubérculos, cascas, caules, invólucros, lã ou polpa de frutos.

30 Em geral, deve-se observar no tratamento da semente, para que a quantidade da composição de acordo com a invenção e/ou outras substâncias aditivas aplicada na semente seja selecionada de maneira tal, que a

germinação da semente não seja prejudicada ou a planta nascida da mesma não seja danificada. Isso deve ser observado principalmente em substâncias ativas, que podem mostrar efeitos fitotóxicos em determinadas quantidades de aplicação.

5                   Tal como já foi citado acima, de acordo com a invenção, é possível tratar todas as plantas e suas partes. Em uma forma de concretização preferida, tipos de plantas e espécies de plantas selvagens ou aquelas obtidas por métodos de cultivo biológicos convencionais, tais como cruzamento ou fusão de protoplastos, bem como suas partes, são tratados. Em uma outra forma de concretização preferida, plantas transgênicas e espécies de plantas, que foram obtidas por métodos de engenharia genética, eventualmente em combinação com métodos convencionais (Genetically Modified Organisms) e suas partes, são tratadas. Os termos "partes" ou "partes de plantas" ou "partes das plantas" foram explicados acima.

15                   De modo particularmente preferido, plantas das espécies de plantas em cada caso são usuais no comércio ou que estão em uso são tratadas de acordo com a invenção. Por espécies de plantas entendem-se plantas com novas propriedades ("traits"), que foram cultivadas tanto através de cultivo convencional, através de metagênese ou por técnicas de DNA recombinantes. Essas podem ser espécies, biótipos e genótipos.

25                   Dependendo dos tipos de plantas ou das espécies de plantas, seu local e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, nutrição) podem ocorrer também efeitos superaditivos ("sinérgicos") através do tratamento de acordo com a invenção. Dessa maneira, por exemplo, são possíveis quantidades de aplicação reduzidas e/ou aumentos do espectro de ação e/ou um reforço do efeito das substâncias e composições aplicáveis de acordo com a invenção, melhor crescimento das plantas, alta tolerância contra altas ou baixas temperaturas, alta tolerância contra seca ou contra teor de sal na água ou no solo, alto poder de florescência, colheita facilitada, aceleração do amadurecimento, maior rendimento da colheita, maior qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior capacidade de armazenagem e/ou capacidade de beneficiamento dos produtos

colhidos, que ultrapassam os efeitos a serem propriamente esperados.

As plantas ou espécies de plantas transgênicas (obtidas através de engenharia genética) que devem ser preferivelmente tratadas de acordo com a invenção, incluem todas as plantas, que em virtude da modificação genética, receberam material genético, que confere propriedades ("traits") valiosas particularmente vantajosas a essas plantas. Exemplos de tais propriedades são melhor crescimento da planta, alta tolerância contra altas ou baixas temperaturas, alta tolerância contra seca ou contra teor de sal na água ou solo, alto poder de florescência, colheita facilitada, aceleração do amadurecimento, maior rendimentos da colheita, maior qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior capacidade de armazenagem e/ou capacidade de beneficiamento dos produtos colhidos. Outros exemplos e particularmente destacados de tais propriedades são uma alta defesa das plantas contra parasitas animais e microbianos, tais como contra insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e/ou vírus, bem como uma alta tolerância das plantas contra determinadas substâncias ativas herbicidas. Como exemplos de plantas transgênicas mencionam-se as plantas cultivadas importantes, tais como cereais (trigo, arroz), milho, soja, batata, beterrabas sacarinas, tomates, ervilhas e outras espécies de hortaliças, algodão, tabaco, colza, bem como plantas frutíferas (com os frutos maçã, pêra, frutos cítricos e uvas), destacando-se particularmente o milho, soja, batata, algodão, tabaco e colza. Como propriedades ("traits") destacam-se particularmente a alta defesa das plantas contra insetos, aracnídeos, nematódios e caracóis devido as toxinas formadas nas plantas, especialmente aquelas, que são produzidas nas plantas pelo material genético de *Bacillus Thuringiensis* (por exemplo, pelos genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF, bem como suas combinações) (a seguir, "plantas BT"). Como propriedades ("traits") destacam-se também particularmente a alta defesa das plantas contra fungos, bactérias e vírus através da resistência sistêmica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores, bem com genes de resistência e proteínas e toxinas expressadas de maneira correspondente. Como propriedades ("traits") destacam-se, além disso, particu-

larmente a alta tolerância das plantas contra determinadas substâncias ativas herbicidas, por exemplo, imidazolinonas, sulfoniluréias, glifosato ou fosfinotricina (por exemplo, gene "PAT"). Os genes que conferem as propriedades desejadas em questão, também podem ocorrer em combinações uns com os outros nas plantas transgênicas. Como exemplos de "plantas Bt", sejam mencionadas espécies de milho, espécies de algodão, espécies de soja e espécies de batata, que são vendidas sob os nomes comerciais YIELD GARD® (por exemplo, milho, algodão, soja), KnockOut® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), NuCoton® (algodão) e NewLeaf® (batata). Como exemplos de plantas tolerantes aos herbicidas mencionam-se espécies de milho, espécies de algodão e espécies de soja, que são vendidas sob os nomes comerciais Roundup Ready® (tolerância contra glifosato, por exemplo, milho, algodão, soja), Liberty Link® (tolerância contra fosfinotricina, por exemplo, colza), IMI® (tolerância contra imidazolinonas) e STS® (tolerância contra sulfoniluréias, por exemplo, milho). Como plantas resistentes aos herbicidas (cultivadas convencionalmente para tolerância aos herbicidas) sejam mencionadas também as espécies vendidas sob o nome Clearfield® (por exemplo, milho). Naturalmente, estas informações valem também para as espécies de plantas a serem desenvolvidas no futuro ou que chegarão futuramente no mercado com estas propriedades genéticas ou a serem futuramente desenvolvidas ("traits").

As plantas listadas podem ser tratadas de maneira particularmente vantajosa de acordo com a invenção, com os compostos da fórmula geral I ou com as misturas de substâncias ativas de acordo com a invenção. As escalas preferidas indicadas acima para as substâncias ativas ou misturas, valem também para o tratamento dessas plantas. Destaque particular é dado ao tratamento de plantas com os compostos ou misturas especialmente listados no presente texto.

As substâncias ativas de acordo com a invenção, não agem somente contra parasitas de plantas, higiene e alimentos armazenados, mas sim, também no setor de medicina veterinária contra parasitas animais (ecto- e endoparasitas), tais como carrapatos de couraça, carrapatos do couro,

sarnas, ácaros corredores, moscas (picadoras e lambedoras), larvas de moscas parasitárias, piolhos, lêndeas, lêndeas de penas e pulgas. Nesses parasitas incluem-se:

5 Da ordem dos Anoplurida, por exemplo, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phtirus spp.*, *Solenopotes spp.*

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

10 Da ordem dos Diptera e das subordens Nematocera bem como Brachycera, por exemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*, *Melophagus spp.*

20 Da ordem dos Siphonaptera, por exemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*

Da ordem dos Heteroptera, por exemplo, *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*

Da ordem dos Blattaria, por exemplo, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, *Supella spp.*

25 Da subclasse dos Acari (Acarina) e das ordens dos Meta- bem como Mesostigmata, por exemplo, *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp.*, *Dermacentor spp.*, *Haemaphysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*

30 Da ordem dos Actinidia (Prostigmata) e Acaridida (Astigmata) por exemplo, *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*,

Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

As substâncias ativas da fórmula (I) de acordo com a invenção,  
5 também são adequadas para o combate de artrópodes, que atacam animais domésticos agrícolas, tais como, por exemplo, bovinos, carneiros, cabras, cavalos, porcos, burros, camelos, búfalos, coelhos, galinhas, perus, patos, gansos, abelhas, outros animais domésticos, tais como, por exemplo, cães, gatos, pássaros de gaiolas, peixes de aquários, bem como as chamadas  
10 cobaias, tais como, por exemplo, hamster, porquinhos-da-Índia, ratos e camundongos. Através do combate destes artrópodes devem ser diminuídos óbitos e reduções de rendimento (no caso da carne, leite, lã, peles, ovos, mel e outros), de maneira que através do emprego das substâncias ativas de acordo com a invenção, seja possível uma pecuária mais econômica e mais  
15 simples.

A aplicação das substâncias ativas de acordo com a invenção, no setor veterinário e na pecuária é efetuada de maneira conhecida através de administração entérica na forma, por exemplo, de comprimidos, cápsulas, bebidas, drenos, granulados, pastas, bolos, do processo "feed-through", de  
20 supositórios, através de administração parenteral, tal como, por exemplo, por injeções (intramuscular, subcutânea, intravenosa, intraperitoneal e outros), implantes, através da aplicação nasal, através da aplicação dérmica na forma, por exemplo, da imersão ou banho (mergulho), pulverização (spray), infusão ("pour-on" e "spot-on"), da lavagem, do polvilhamento bem como  
25 com auxílio de artigos moldados contendo substância ativa, tais como coleira, marcas nas orelhas, marcas nas caudas, faixas articulares, cabrestos, dispositivos de marcação e outros.

Para a aplicação no gado, aves, animais domésticos e outros, as substâncias ativas da fórmula (I) podem ser empregadas como formulações  
30 (por exemplo, pós, emulsões, agentes escoáveis), que contêm as substâncias ativas em uma quantidade de 1 até 80 %, em peso, diretamente ou após diluição de 100 até 10.000 vezes ou elas podem ser aplicadas como

banho químico.

Além disso, foi verificado que os compostos de acordo com a invenção, mostram um alto efeito contra insetos, que destroem materiais técnicos.

5 Por exemplo e preferivelmente – sem contudo, limitar – sejam mencionados os insetos abaixo:

besouros tais como

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

Himenópteros, tais como

15 Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur.

Térmites tais como

Kaloterme flavicollis, Cryptoterme brevis, Heteroterme indicola, Reticuliterme flavipes, Reticuliterme santonensis, Reticuliterme lucifugus, Mastoterme darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptoterme formosanus.  
20

Traças tal como Lepisma saccharina.

Por materiais técnicos no presente contexto, entendem-se os materiais não viventes, tais como preferivelmente, materiais plásticos, adesivos, colas, papéis e papelões, couro, madeira, produtos de beneficiamento da madeira e produtos para pintura.  
25

Os agentes prontos para o uso podem conter eventualmente ainda outros inseticidas e eventualmente ainda um ou mais fungicidas.

30 Com respeito aos possíveis participantes de mistura adicionais, seja feita referência aos inseticidas e fungicidas mencionados acima.

Ao mesmo tempo, os compostos de acordo com a invenção, podem ser usados para a proteção contra incrustações de objetos, especial-

mente de corpos de navios, peneiras, redes, edifícios, ancoradouros e sinalleiras, os quais entram em contato com água do mar ou água salobre.

Além disso, os compostos de acordo com a invenção, podem ser usados sozinhos ou em combinações com outras substâncias ativas como agentes "antifouling".

As substâncias ativas também são adequadas para combater parasitas animais na proteção doméstica, higiênica e de alimentos armazenados, especialmente de insetos, aracnídeos e ácaros, que ocorrem em ambientes fechados, tais como, por exemplo, residências, pátios de fábricas, escritórios, cabinas de automóveis e outros. Elas podem ser usadas individualmente ou em combinação com outras substâncias ativas e coadjuvantes em produtos inseticidas domésticos para combater esses parasitas. Elas são eficazes contra espécies sensíveis e resistentes, bem como contra todos os estágios de desenvolvimento. Nesses parasitas incluem-se:

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

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

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

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

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

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

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

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

Da ordem dos Blattaria, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parco-*

blatta spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

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

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

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

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

Da ordem dos Coleoptera, por exemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp.,  
10 *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

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

Da ordem dos Lepidoptera, por exemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.  
20

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

Da ordem dos Hymenoptera, por exemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.  
25

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

Da ordem dos Heteroptera, por exemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma infestans*.  
30

A aplicação no âmbito dos inseticidas domésticos é efetuada isoladamente ou em combinação com outras substâncias ativas adequadas,

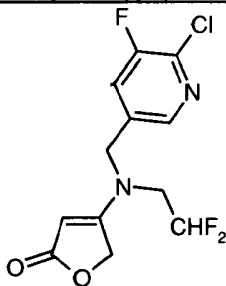
tais como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretróides, neonicotinóides, reguladores do crescimento ou substâncias ativas de outras classes de inseticidas conhecidos.

A aplicação é efetuada em aerossóis, agentes de atomização sem pressão, por exemplo, sprays bombeadores e pulverizadores, nebulizadores automáticos, nebulizadores, espumas, géis, produtos evaporadores com plaquetas evaporadoras de celulose ou material plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de géis e de membranas, evaporadores acionados com hélices, sistemas de evaporação sem energia ou passivos, papéis para traças, saquinhos para traças e géis para traças, como granulados ou pós, em engodos de espalhar ou estações de engodo.

Exemplos de preparação:

Processo 1

4-[[6-cloro-5-fluorpiridin-3-il)metil[(2,2-difluoretil)amino]furan-2(5H)-ona



Exemplo (1)

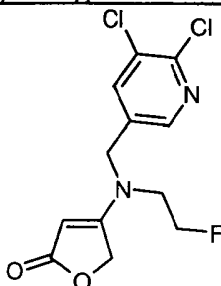
A 173 mg (1,69 mmol) de ácido tetrônico em 400 µl de ácido acético, acrescentam-se 317 mg (1,41 mmol) de N-[(6-cloro-5-fluorpiridin-3-il)metil]-2,2-difluoretilamina (III-1) e agita-se por 6 horas à temperatura ambiente. Após a concentração da mistura de reação no vácuo, o resíduo é dividido entre diclorometano e água. A fase aquosa é extraída mais duas vezes com diclorometano. As fases orgânicas combinadas são lavadas com solução aquosa de hidróxido de sódio 1 N e concentradas no vácuo. Após a purificação do resíduo por cromatografia de coluna em sílica-gel (sílica-gel 60 – Merck, tamanho do grão: 0,04 a 0,063 mm) com a mistura da fase móvel éster etílico de ácido acético : ciclohexano (3:1), obtêm-se 316 mg (64 % da teoria) de 4-[[6-cloro-5-fluorpiridin-3-il)metil[(2,2-difluoretil)amino]furan-2(5H)-ona.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 3.60 (td, 2 H), 4.54 (s, 2 H), 4.75 (s,

1 H), 4.80 (s, 2 H), 6.04 (tt, 1 H), 7.54 (d, 1 H), 8.15 (s, 1 H).

Processo 3:

4-[[5,6-dicloropiridin-3-il)metil](2-fluoretil)amino]furan-2(5H)-ona



exemplo (2)

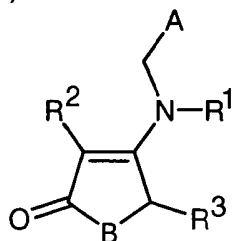
217 mg (1,49 mmol) de 4-[(2-fluoretil)amino]furan-2(5H)-ona (VI-  
 5 1) e 90 mg (2,24 mmol) de uma dispersão a 60 % de hidreto de sódio em  
 óleo mineral são aquecidos em 100 ml de tetrahydrofurano por 2 horas ao  
 refluxo. Depois de resfriar à temperatura ambiente, são acrescentados 360  
 mg (1,49 mmol) de 3-(bromometil)-5,6-dicloropiridina e aquecidos por mais 3  
 horas ao refluxo. Depois de resfriar a mistura de reação à temperatura ambi-  
 10 ente e adicionar metanol, concentra-se no vácuo. O resíduo é retomado com  
 éster etílico de ácido acético, lavado sucessivamente duas vezes com ácido  
 clorídrico aquoso 1 N, duas vezes com solução aquosa de hidróxido de só-  
 dio 1 N e solução saturada de cloreto de sódio e secado sobre sulfato de  
 sódio. Após a concentração da fase orgânica no vácuo e purificação do resí-  
 15 duo por cromatografia de coluna em sílica-gel (sílica-gel 60 – Merck, tama-  
 nho do grão: 0,04 a 0,63 mm) com a mistura da fase móvel éster etílico de  
 ácido acético : ciclohexano (5:1), obtêm-se 260 mg (56 % da teoria) de 4-  
 [[(5,6-dicloropiridin-3-il)metil](2-fluoretil)amino]furan-2(5H)-ona.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 3.50 (dt, 2 H), 4.49 (s, 2 H), 4.55  
 20 (dt, 2 H), 4.64 (s, 1 H), 4.80 (s, 2 H), 7.80 (s, 1 H), 8.22 (s, 1 H).

Os compostos (3) a (7) da fórmula (I) listados na tabela 1 abaixo,  
 também foram preparados de maneira análoga a essa instrução.

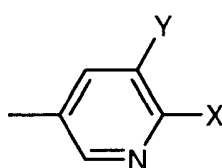
Tabela 1

Compostos da fórmula (I)



(I)

na qual A =



Ex. Nº	B	R1	R2	R3	X	Y	dados físicos: RMN- <sup>1</sup> H, δ [ppm]
3	O		H	H	Cl	Cl	CD <sub>3</sub> CN, δ = 3,59 (td, 2H), 4,52 (s, 2H), 4,75 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 6,04 (tt, 1H), 7,80 (s, 1H), 8,22 (s, 1H)
4	O		H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CD <sub>3</sub> CN, δ = 2,35 (s, 3H), 3,57 (td, 2H), 4,48 (s, 2H), 4,75 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 6,02 (tt, 1H), 7,54 (s, 1H), 8,11 (s, 1H)
5	O		H	H	Cl	Br	CD <sub>3</sub> CN, δ = 3,60 (td, 2H), 4,50 (s, 2H), 4,75 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 6,04 (tt, 1H), 7,95 (s, 1H), 8,25 (s, 1H)
6	O		H	H	Br	Cl	CD <sub>3</sub> CN, δ = 3,60 (td, 2H), 4,50 (s, 2H), 4,75 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 6,04 (tt, 1H), 7,75 (s, 1H), 8,20 (s, 1H)
7	O		H	H	Br	F	CD <sub>3</sub> CN, δ = 3,61 (td, 2H), 4,53 (s, 2H), 4,75 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 6,04 (tt, 1H), 7,47 (d, 1H), 8,14 (s, 1H)

Preparação dos compostos de partida5 Compostos da fórmula (HN(R<sup>1</sup>)-CH<sub>2</sub>-A) (III)III-1

N-[(6-cloro-5-fluorpiridin-3-il)metil]-2,2-difluoretilamina

520 mg (2,89 mmols) de 6-cloro-3-clorometil-5-fluorpiridina (VII-3), 1,05 ml (14,44 mmols) de 2,2-difluoretilamina e 400 µl (2,89 mmols) de trietilamina são agitados em 50 ml de acetonitrila por cerca de 48 horas a 45°C. Com isso, após cerca de 16 e 32 horas, em cada caso, são acrescentados mais 0,42 ml (5,78 mmols) de 2,2-difluoretilamina. Após a concentração da mistura de reação no vácuo, retoma-se com ácido clorídrico aquoso 1 N e lava-se com éster etílico de ácido acético. A fase aquosa é alcalinizada com solução aquosa de hidróxido de sódio 2,5 N e extraída várias vezes com éster etílico de ácido acético. A secagem das fases orgânicas combinadas sobre sulfato de sódio e concentração no vácuo, fornecem 370 mg (57 % da teoria) de N-[(6-cloro-5-fluorpiridin-3-il)metil]-2,2-difluoretilamina.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 2.95 (td, 2 H), 3.87 (s, 2 H), 5.87 (tt, 1 H), 7.62 (d, 1 H), 8.17 (s, 1 H).

15 Compostos da fórmula (VI)VI-14-[(2-fluoretil)amino]furan-2(5H)-ona

550 mg (4,97 mmols) de cloridrato de 2-fluoretilamina, 547 mg (5,47 mmols) de ácido tetrônico, 408 mg (4,97 mmols) de acetato de sódio e 9 mg (0,05 mmol) de ácido 4-toluenossulfônico em 50 ml de tolueno são aquecidos no por 5 horas ao refluxo no separador de água. Após a concentração da mistura de reação no vácuo, retoma-se com éster etílico de ácido acético e lava-se com solução aquosa de hidróxido de sódio 1 N. A fase aquosa é extraída várias vezes com éster etílico de ácido acético e a fase orgânica combinada é secada sobre sulfato de sódio. Após a concentração da fase orgânica no vácuo e purificação do resíduo por cristalização a partir de éster etílico de ácido acético/ciclohexano, obtêm-se 300 mg (42 % da teoria) de 4-[(2-fluoretil)amino]furan-2(5H)-ona.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN, δ, ppm) = 3.40 (dq, 2 H), 4.52 (dt, 2H), 4.61 (s, 1 H), 4.62 (s, 2 H), 5.80 (br. s, 1 H).

O composto (VI-2) também foi preparado de maneira análoga a essa instrução:

VI-24-[(2,2-difluoretil)amino]furan-2(5H)-ona

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN, δ, ppm) = .50 (tm, 2 H), 4.65 (s, 2 H), 4.71 (s, 1 H), 5.78 (br. s, 1 H), 5.98 (tt, 1 H).

5 Compostos da fórmula (E-CH<sub>2</sub>-A) (VII)VII-1

(5,6-dicloropiridin-3-il)metanol (E = OH, A = 5,6-dicloro-pirid-3-ila) (compare R. Graf e outros J. Prakt. Chem. 1932, 134 177-87).

A 110 g (573 mmol) de ácido 5,6-dicloro-nicotínico em 250 ml de tetrahidrofurano, acrescentam-se por gotejamento a 0°C, 859 ml (859 mmol) de uma solução 1 M de complexo de borano-tetrahidrofurano em tetrahidrofurano. Aquece-se à temperatura ambiente e nesta temperatura agita-se por 3 horas. Após resfriar a 0°C, alcaliniza-se a mistura de reação com solução aquosa saturada de carbonato de potássio, centrifuga-se o tetrahidrofurano amplamente e extrai-se o resíduo várias vezes com éster etílico de ácido acético. As fases orgânicas combinadas são lavadas com água e solução aquosa saturada de cloreto de sódio e secadas sobre sulfato de sódio. Após a concentração da fase orgânica no vácuo e purificação do resíduo por cromatografia de coluna em sílica-gel (sílica-gel 60 – Merck, tamanho do grão: 0,04 a 0,063 mm) com a mistura da fase móvel éster etílico de ácido acético : ciclohexano (1:2), obtêm-se 62 g (61 % da teoria) de (5,6-dicloropiridin-3-il)metanol.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 3.31 (t, 1 H), 4.60 (d, 2 H), 7.85 (s, 1 H), 8.26 (s, 1 H).

25 O composto (VII-5) da tabela (3) também foi preparado de maneira análoga à instrução do composto (VII-1).

VII-2

3-bromometil-5,6-dicloropiridina (E = Br, A = 5,6-dicloro-pirid-3-ila) (compare a WO 2000046196 A1).

30 Uma solução de 10,60 g (59,55 mmols) de (5,6-dicloropiridin-3-il)metanol (VII-1) em 100 ml de diclorometano é adicionada a 0°C, a 16,40 g (62,52 mmols) de trifetilfosfina e 11,66 g (65,50 mmols) de N-

bromossuccinimida. Após 2 horas, a mistura de reação é amplamente concentrada e o resíduo é purificado por cromatografia de coluna em sílica-gel (sílica-gel 60 – Merck, tamanho do grão: 0,04 a 0,063 mm) com a mistura da fase móvel éster etílico de ácido acético : ciclohexano (1:5). Obtêm-se 12,4 g (86 % da teoria) de 3-bromometil-5,6-dicloropiridina.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 4,53 (s, 2 H), 7,97 (s, 1 H), 8,35 (s, 1 H).

Os compostos (VII-6) a (VII-8) da (tabela 3) também foram preparados de maneira análoga à instrução do composto (VII-2).

### 10 VII-3

6-cloro-3-clorometil-5-fluorpiridina (E = Cl, A = 6-cloro-5-flúor-pirid-3-ila)

1,00 g (6,87 mmols) de 6-cloro-5-flúor-3-metilpiridina (compare F. L. Setliff, Organic Preparations and Procedures International 1971, 3, 217-222), 1,01 g (7,56 mmols) de N-clorossuccinimida e 0,11 g (0,69 mmol) de 2,2'-azo-bis(2-metilpropanonitrila) em 100 ml de clorobenzeno são fervidos por 2 dias ao refluxo. Com isso, depois de aproximadamente 16 e 32 horas, em cada caso são acrescentados mais 1,01 g (7,56 mmols) de N-clorossuccinimida e 0,11 g (0,69 mmol) de 2,2'-azobis(2-metilpropanonitrila). Após lavar a mistura de reação com solução aquosa saturada de sulfito de sódio e solução de bicarbonato de sódio, seca-se sobre sulfato de sódio e concentra-se no vácuo. Cromatografia de coluna do resíduo em sílica-gel (sílica-gel 60 – Merck, tamanho do grão: 0,04 a 0,063 mm) com a mistura de reação da fase móvel éster etílico de ácido acético : ciclohexano (1:20) fornece 0,65 g (53 % da teoria) de 6-cloro-3-clorometil-5-fluorpiridina.

25 RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 4,68 (s, 2 H), 7,69 (d, 1 H), 8,27 (s, 1 H).

### VII-4

6-bromo-3-bromometil-5-fluorpiridina (E = Br, A = 6-bromo-5-flúor-pirid-3-ila)

10,00 g (52,63 mmols) de 6-bromo-5-flúor-3-metilpiridina (compare F. L. Setliff, Organic Preparations and Procedures International 1971, 3, 217-222), 12,18 g (68,42 mmols) de N-bromossuccinimida e 0,86 g (5,26 mmols) de 2,2'-azo-bis(2-metilpropanonitrila) em 1 litro de clorobenzeno, são

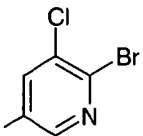
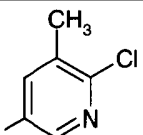
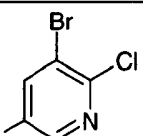
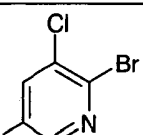
fervidos por 6 horas ao refluxo. Após lavar a mistura de reação com solução aquosa saturada de sulfito de sódio e solução de bicarbonato de sódio, seca-se sobre sulfato de sódio e concentra-se no vácuo. Cromatografia de coluna do resíduo em sílica-gel (sílica-gel 60 Merck, tamanho do grão: 0,04 a 0,063 mm) com a mistura de reação da fase móvel éster etílico de ácido acético : ciclohexano (1:20), fornecem 6,0 g (42 % da teoria) de 6-bromo-3-clorometil-5-fluorpiridina.

RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN): δ [ppm] = 4,55 (s, 2 H), 7,65 (d, 1 H), 8,27 (s, 1 H).

Na seguinte tabela 3 são listados outros compostos (VII-5) a (VII-8) da fórmula (VII).

Tabela 3

E-CH<sub>2</sub>-A (VII)

Ex. n°	E	A	dados físicos <sup>a)</sup>
VII-5	OH		3,30 (t, 1H), 4,59 (d, 2H), 7,83 (s, 1H), 8,26 (s, 1H)
VII-6	Br		2,37 (s, 3H), 4,52 (s, 2H), 7,70 (s, 1H), 8,24 (s, 1H)
VII-7	Br		4,52 (s, 2H), 8,10 (s, 1H), 8,38 (s, 1H)
VII-8	Br		4,52 (d, 2H), 7,92 (s, 1H), 8,35 (s, 1H)

<sup>a)</sup> RMN-<sup>1</sup>H (CD<sub>3</sub>CN), δ [ppm]

15 Exemplos biológicos

Exemplo n° 1

Teste com Myzus (MYZUPE tratamento por borrifação)

Solvente: 78 partes em peso, de acetona

1,5 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 0,5 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada.

Discos de couve da China (*Brassica pekinensis*), que estão infestados por todos os estágios do pulgão verde do pessegueiro (*Myzus persicae*), são borrifados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, determina-se o efeito em %. Neste caso, 100 % significam que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em g/ha	grau de mortalidade em % após 5 dias
exemplo 1	500	100
exemplo 2	500	100
exemplo 3	500	100
exemplo 4	500	100
exemplo 5	500	100
exemplo 6	500	100
exemplo 7	500	100

#### 15 Exemplo nº 2

##### Teste com Nilaparvata lugens (NILALU) tratamento hidropônico

Solvente: 78 partes em peso, de acetona

1,5 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 0,5 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada.

A preparação da substância ativa é pipetada em água. A con-

concentração indicada refere-se à quantidade de substância ativa por unidade de volume (mg/l = ppm), em seguida, infesta-se com a cigarra do arroz de dorso marrom (*Nilaparvata lugens*).

Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todas as cigarras do arroz foram mortas; 0 % significa, que as cigarras do arroz não foram mortas.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em g/ha	grau de mortalidade em % após 7 dias
exemplo 2	100	80
exemplo 3	100	100

### Exemplo nº 3

#### 10 Bemisia tabaci (BEMITA tratamento por borrifação)

Solvente: 78 partes em peso, de acetona

1,5 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 0,5 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada.

Discos de folhas de algodão (*Gossypium hirsutum*), que estão infestados por larvas da mosca branca (*Bemisia tabaci*), são borrifados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todas as moscas brancas foram mortas; 0 % significa, que nenhuma mosca branca foi morta.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em g/ha	grau de mortalidade em % após 7 dias
exemplo 1	500	100

Exemplo nº 4Teste com Meloidogyne (MELGIN tratamento por borrifação)

Solvente: 80 partes em peso, de acetona

5 Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com a quantidade de solvente e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

10 Vasos são enchidos com areia, solução de substância ativa, suspensão de larvas de ovos de Meloidogyne incognita e sementes de salada. As sementes de salada germinam e as plantículas desenvolvem-se. Nas raízes, desenvolvem-se as vesículas.

Após o tempo desejado, o efeito nematicida é determinado em % com base na formação de vesículas. Neste caso, 100 % significam, que não foram encontradas vesículas; 0 % significa, que o número das vesículas nas plantas tratadas corresponde ao do controle não tratado.

15 Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 14 dias
exemplo 2	20	100

Exemplo nº 5Teste com Myzus persicae, tratamento hidropônico (MYZUPE, sis.)

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

20 Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

25 A preparação de substância ativa é misturada com água. A concentração indicada refere-se à quantidade de substância ativa por unidade de volume de água (mg/l = ppm). A água tratada é envasada em vasos com uma planta de ervilha (*Pisum sativum*), em seguida, infesta-se com o pulgão verde do pêssego (*Myzus persicae*).

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %. Neste caso, 100 % significam que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

5 Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 6 dias
exemplo 2	20	100

#### Exemplo nº 6

##### Teste com *Aphis gossypii* (APHIGO)

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

10 Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada.

15 Folhas de algodão (*Gossypium hirsutum*), que estão fortemente infestadas pelo pulgão do algodão (*Aphis gossypii*), são tratadas por imersão na preparação da substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %. Neste caso, 100 % significam que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

20 Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 6 dias
exemplo 2	100	95

#### Exemplo nº 7

##### Teste com *Myzus persicae*; (MYZUPE G)

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

25 Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de sol-

vente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

Plantas de couve (*Brassica oleracea*), que estão fortemente infestadas pelo pulgão verde do pêssigo (*Myzus persicae*), são regadas com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %. Neste caso, 100 % significam que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 10 dias
exemplo 2	4	98

#### Exemplo nº 8

#### Teste com *Aphis gossypii*; (APHIGO G)

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

Plantas de algodão (*Gossypium hirsutum*), que estão fortemente infestadas pelo pulgão verde do algodão (*Aphis gossypii*), são regadas com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %. Neste caso, 100 % significam que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 10 dias
exemplo 2	4	100

Exemplo nº 9Teste com *Myzus persicae* (aplicação no solo)

Solvente: 4 partes em peso, de acetona

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

5 Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

10 A preparação da substância ativa é misturada com terra. A concentração indicada refere-se à quantidade de substância ativa por unidade de volume de terra (mg/l = ppm). A terra tratada é enchida em vasos e plantada com uma planta de pimentão (*Capsicum annuum*). Após uma semana, infesta-se com o pulgão verde do pêssigo (*Myzus persicae*).

15 Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %. Neste caso, 100 % significam que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram boa eficácia: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 35 dias
exemplo 4	0,25	90

Exemplo nº 10

20 Ctenophalides felis; oral (CTECFE)

Solvente: dimetilsulfóxido

25 Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com a quantidade de água indicada. Uma parte do concentrado é diluído com sangue bovino citratado e a concentração desejada é preparada.

20 pulgas adultas em jejum (*Ctenocephalides felis*) são colocadas em uma câmara, que está fechada em cima e em baixo com gaze. Sobre a câmara é colocado um cilindro de metal, cujo lado inferior é fechado com parafina. O cilindro contém a preparação de sangue-substância ativa,

que pode ser absorvida pelas pulgas através da membrana do filme de parafina. Enquanto o sangue é aquecido a 37°C, na área da câmara a temperatura é a ambiente.

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %.

- 5 Neste caso, 100 % significam, que todas as pulgas foram mortas; 0 % significa, que nenhuma pulga foi morta.

Nesse teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um bom efeito: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 2 dias
exemplo 1	100	80
exemplo 3	100	80
exemplo 4	100	80
exemplo 6	100	80

#### Exemplo nº 11

- 10 Teste com *Lucilia cuprina* (LUCICU)

Solvente: dimetilsulfóxido

Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com a quantidade de água indicada e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

- 15 Vasos, que contêm carne de cavalo, que foi tratada com a preparação da substância ativa da concentração desejada, são infestados com larvas de *Lucilia cuprina*.

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %.

- 20 Neste caso, 100 % significam, que todas as larvas foram mortas; 0 % significa, que nenhuma larva foi morta.

Nesse teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um bom efeito: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade em % após 2 dias
exemplo 1	100	100
exemplo 7	100	100

Exemplo nº 12Teste com *Boophilus microplus* (injeção BOOPMI)

Solvente: dimetilsulfóxido

5 Para produzir uma preparação conveniente de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com a quantidade de solvente indicada e dilui-se o concentrado com solvente para a concentração desejada.

10 A preparação de substância ativa é injetada no abdômen (*Boophilus microplus*), os animais são transferidos para cápsulas e guardados em um ambiente climatizado.

Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que nenhum dos carrapatos depositou ovos férteis.

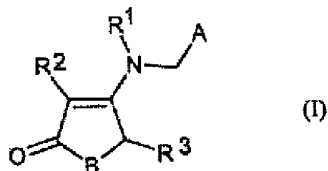
Nesse teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um bom efeito: vide tabela.

exemplo	concentração da substância ativa em µg/animal	grau de mortalidade em % após 7 dias
exemplo 2	20	100

## REIVINDICAÇÕES

1. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula

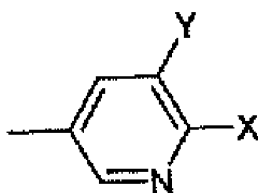
(I)



na qual

5

A representa um radical



no qual

X representa halogênio, alquila ou haloalquila,

Y representa halogênio, alquila ou haloalquila,

B representa oxigênio,

10

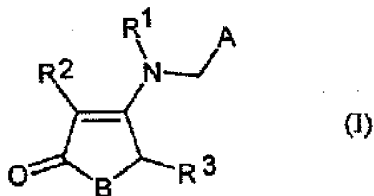
R<sup>1</sup> representa haloalquila, haloalquenila, halocicloalquila ou halocicloalquilalquila,

R<sup>2</sup> representa hidrogênio ou halogênio, e

R<sup>3</sup> representa hidrogênio ou alquila.

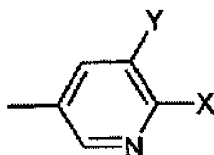
2. Composto, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado

15 pelo fato de que apresenta a fórmula (I)



na qual

A representa um radical



no qual

X representa halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila ou halo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila,

Y representa halogênio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila ou halo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquila,

B representa oxigênio,

R<sup>1</sup> representa halo-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquila, halo-C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-alquenila, haloci-

5 clopropila,

R<sup>2</sup> representa hidrogênio ou halogênio, e

R<sup>3</sup> representa hidrogênio ou alquila.

3. Agente, caracterizado pelo fato de que compreende pelo me-  
nos um composto da fórmula (I), como definido na reivindicação 1 ou 2, e  
10 diluentes e/ou tensoativos.

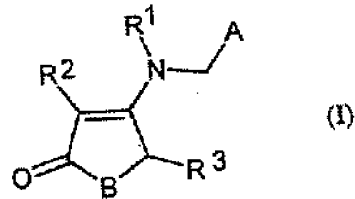
4. Processo para combater parasitas, caracterizado pelo fato de  
que um composto da fórmula (I), como definido na reivindicação 1 ou 2, ou  
um agente, como definido na reivindicação 3, é deixado agir nos parasitas  
e/ou seu habitat.

15 5. Uso de compostos da fórmula (I), como definidos na reivindi-  
cação 1 ou 2, ou de agentes, como definidos na reivindicação 3, caracteriza-  
do pelo fato de que é para combater parasitas.

## RESUMO

Patente de Invenção: **"ENAMINOCARBONILA SUBSTITUÍDAS, AGENTE, SEU USO, E PROCESSO PARA COMBATER PARASITAS"**.

A presente invenção refere-se a novos compostos de enamino-  
5 carbonila substituídos da fórmula (I),



processos para a sua produção e seu uso para combater parasitas animais, principalmente artrópodes, especialmente insetos.