



REPÚBLICA FEDERATIVA DO BRASIL

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



CARTA PATENTE N.º PI 0610542-4

Patente de Invenção

O INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL concede a presente PATENTE, que outorga ao seu titular a propriedade da invenção caracterizada neste título, em todo o território nacional, garantindo os direitos dela decorrentes, previstos na legislação em vigor.

(21) Número do Depósito : PI 0610542-4

(22) Data do Depósito : 18/04/2006

(43) Data da Publicação do Pedido : 26/10/2006

(51) Classificação Internacional : C07D 401/04; A01N 43/56

(30) Prioridade Unionista : 20/04/2005 GB 05 07989.2; 08/12/2005 GB 05 25060.0

(54) Título : INSETICIDAS DE ANTRANILAMIDA DE CIANO, COMPOSIÇÃO PESTICIDA E MÉTODO PARA O CONTROLE DE PESTES

(73) Titular : SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, Sociedade Suíça. Endereço: Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Suíça (CH).

(72) Inventor : ANTHONY O'SULLIVAN. Endereço: a/c Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Suíça. Cidadania: Britânica.; MICHEL MUEHLEBACH. Endereço: A/C SYNGENTA CROP PROTECTION AG, SCHWARZWALDALLE 215, CH 4058 BASEL, Suíça. Cidadania: Suíça.; ANDRE JEANGUENAT. Endereço: a/c Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Suíça. Cidadania: Suíça.; STEPHAN TRAH. Endereço: a/c Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Suíça. Cidadania: Alemã.; ROGER GRAHAM HALL. Endereço: a/c Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Suíça. Cidadania: Britânica.

Prazo de Validade : 20 (vinte) anos contados a partir de 18/04/2006, observadas as condições legais.

Expedida em : 14 de Outubro de 2014.

Assinado digitalmente por
Júlio César Castelo Branco Reis Moreira
Diretor de Patentes

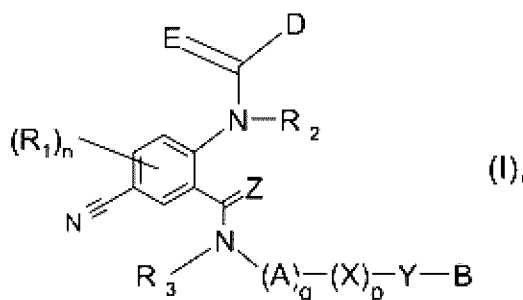


Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "INSETICIDAS DE ANTRANILAMIDA DE CIANO, COMPOSIÇÃO PESTICIDA E MÉTODO PARA O CONTROLE DE PESTES".

A presente invenção refere-se a novos derivados de antranilamida, aos processos para suas preparações, às composições compreendendo aqueles compostos, e ao seu uso para controlar insetos ou representantes da ordem *Acarina*.

Derivados de antranilamida com propriedades inseticidas são conhecidos na técnica e descritos, por exemplo, no WO 04/067528. Foram descobertos novos derivados de antranilamida substituídos por ciano com propriedades pesticidas, especialmente para o controle de insetos e membros da ordem *Acarina*.

A presente invenção conseqüentemente refere-se a compostos de fórmula I



em que

cada um de E e Z, que pode ser igual ou diferente, representam oxigênio ou enxofre;

A é C₁-C₆alquileno, C₂-C₆alquenileno, C₂-C₆alquinileno, ou um sistema de anel monocíclico ou bicíclico fundido de três a dez membros bivalentes propriamente ditos que pode ser parcialmente saturado ou completamente saturado e pode conter 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, não sendo possível para cada sistema de anel conter mais do que 2 átomos de oxigênio e mais do que 2 átomos de enxofre; e sendo possível para o sistema de anel de três a dez membros propriamente dito e também para os grupos C₁-C₆alquileno, C₂-C₆alquenileno e C₂-C₆alquinileno serem mono-, di- ou trissubstituídos por halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila,

C₃-C₆cicloalquila, C₅-C₇cicloalquenila, C₅-C₈cicloalquinila, C₁-C₆haloalquila,
 C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₅-
 C₇halocicloalquenila, C₅-C₈halocicloalquinila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi,
 C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-
 5 C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-
 C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonila, C₂-
 C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonilóxi,
 C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi ou C₃-
 C₆trialquilsilila, ou por um sistema monocíclico ou bicíclico fundido de três a
 10 dez membros que pode ser aromático, parcialmente saturado ou totalmente
 saturado e pode conter 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo consis-
 tindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, não sendo possível para cada sis-
 tema de anel conter mais do que 2 átomos de oxigênio e mais do que 2 á-
 tomos de enxofre, e sendo possível para o sistema de anel de três a dez
 15 membros propriamente dito ser mono-, di- ou trissubstituído por halogênio,
 ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-
 C₆cicloalquila, C₅-C₇cicloalquenila, C₅-C₈cicloalquinila, C₁-C₆haloalquila, C₂-
 C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₅-
 C₇halocicloalquenila, C₅-C₈halocicloalquinila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi,
 20 C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-
 C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-
 C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonila, C₂-
 C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonilóxi,
 C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆trialquilsilila
 25 ou fenila, sendo possível para o grupo fenila sucessivamente ser substituído
 por hidróxi, C₁-C₆alquila, C₁-C₆haloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-C₆haloalquiltio,
 C₃-C₆alqueniltio, C₃-C₆haloalqueniltio, C₃-C₆alquiniltio, C₁-C₃alcóxi-C₁-
 C₃alquiltio, C₂-C₄alquilcarbonil-C₁-C₃alquiltio, C₂-C₄alcoxicarbonil-C₁-C₃-
 alquiltio, ciano-C₁-C₃alquiltio, C₁-C₆alquilsufinila, C₁-C₆haloalquilsufinila, C₁-
 30 C₆alquilsulfonila, C₁-C₆haloalquilsulfonila, aminossulfonila, C₁-C₂alquilamino-
 ssulfonila, N,N-di(C₁-C₂alquil)aminossulfonila, di(C₁-C₄alquil)amino, halogê-
 nio, ciano ou nitro; e substituintes em átomos de nitrogênio nos sistemas de

anéis sendo diferentes de halogênio;

X é oxigênio, NH ou C₁-C₄alquil-N;

Y é um sistema de anel bicíclico ou monocíclico fundido de três a dez membros que pode ser parcialmente saturado ou totalmente saturado e pode conter 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, não sendo possível para cada sistema de anel conter mais do que 2 átomos de oxigênio e mais do que 2 átomos de enxofre;

e sendo possível para o sistema de anel de três a dez membros propriamente dito ser mono-, di- ou trissubstituído por halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-C₆cicloalquila, C₅-C₇cicloalquenila, C₅-C₈cicloalquinila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₅-C₇halocicloalquenila, C₅-C₈halocicloalquinila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonila, C₂-C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonilóxi, C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi ou C₃-C₆trialquilsilila, ou por um sistema de anel monocíclico ou bicíclico fundido de três a dez membros que pode ser aromático, parcialmente saturado ou totalmente saturado e pode conter 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, não sendo possível para cada sistema de anel conter mais do que 2 átomos de oxigênio e mais do que 2 átomos de enxofre, e sendo possível para o sistema de anel de três a dez membros propriamente dito ser mono-, di- ou trissubstituído por halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-C₆cicloalquila, C₅-C₇cicloalquenila, C₅-C₈cicloalquinila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₅-C₇halocicloalquenila, C₅-C₈halocicloalquinila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆al-

- coxicarbonila, C₂-C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonilóxi, C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆trialquilsilila ou fenila, sendo possível para o grupo fenila sucessivamente ser substituído por hidróxi, C₁-C₆alquila, C₁-C₆haloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-C₆haloalquiltio, C₃-C₆alqueniltio, C₃-C₆haloalqueniltio, C₃-C₆alquiniltio, C₁-C₃alcóxi-C₁-C₃alquiltio, C₂-C₄alquilcarbonil-C₁-C₃alquiltio, C₂-C₄alcoxicarbonil-C₁-C₃alquiltio, ciano-C₁-C₃alquiltio, C₁-C₆alquilsufinila, C₁-C₆haloalquilsufinila, C₁-C₆alquilsulfonila, C₁-C₆haloalquilsulfonila, aminossulfonila, C₁-C₂alquilaminossulfonila, N,N-di(C₁-C₂alquil)aminossulfonila, di(C₁-C₄alquil)amino, halogênio, ciano ou nitro; e substituintes em átomos de nitrogênio nos sistemas de anéis sendo diferentes de halogênio;

p é 0 ou 1;

q é 0 ou 1;

- B é um sistema de três a quatro membros que é totalmente ou parcialmente saturado e pode conter um heteroátomo do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, e sendo possível para o sistema de anel de três a quatro membros propriamente dito ser mono-, di- ou trissubstituído por halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-C₆cicloalquila, C₅-C₇cicloalquenila, C₅-C₈cicloalquinila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₅-C₇halocicloalquenila, C₅-C₈halocicloalquinila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonila, C₂-C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxicarbonilóxi, C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆trialquilsilila, ou por um sistema de anel monocíclico ou bicíclico fundido de três a dez membros que pode ser aromático, parcialmente saturado ou totalmente saturado e pode conter 1 a 4 heteroátomos selecionados do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, não sendo possível para cada sistema de anel conter mais do que 2 átomos de oxigênio e mais do que 2 átomos de enxofre, e sendo possível para o sistema de anel de três a dez

- membros propriamente dito ser mono-, di- ou trissubstituído por halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-C₆cicloalquila, C₅-C₇cicloalquenila, C₅-C₈cicloalquinila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₅-C₇halocicloalquenila, C₅-C₈halocicloalquinila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxycarbonila, C₂-C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxycarbonilóxi, C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆trialquilsilila ou fenila, sendo possível para o grupo fenila sucessivamente ser substituído por hidróxi, C₁-C₆alquila, C₁-C₆haloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-C₆haloalquiltio, C₃-C₆alqueniltio, C₃-C₆haloalqueniltio, C₃-C₆alquiniltio, C₁-C₃alcóxi-C₁-C₃alquiltio, C₂-C₄alquilcarbonil-C₁-C₃alquiltio, C₂-C₄alcoxycarbonil-C₁-C₃alquiltio, ciano-C₁-C₃alquiltio, C₁-C₆alquilsufinila, C₁-C₆haloalquilsufinila, C₁-C₆alquilsulfonila, C₁-C₆haloalquilsulfonila, aminossulfonila, C₁-C₂alquilaminossulfonila, N,N-di(C₁-C₂alquil)aminossulfonila, di(C₁-C₄alquil)amino, halogênio, ciano ou nitro; e substituintes em átomos de nitrogênio nos sistemas de anéis sendo diferentes de halogênio;
- 20 cada R₁ independentemente é halogênio, nitro, ciano, hidróxi, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄haloalquilsufinila, C₁-C₄haloalquilsulfonila, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxycarbonila, C₂-C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxycarbonilóxi, C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi ou C₃-C₆trialquilsilila, fenila, benzila ou fenóxi, ou fenila, benzila ou fenóxi mono-, di- ou trissubstituído por halogênio, ciano, nitro, halogênio, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆haloalquenila, C₂-C₆haloalquinila, C₃-C₆halocicloalquila, C₁-C₄alcóxi, C₁-

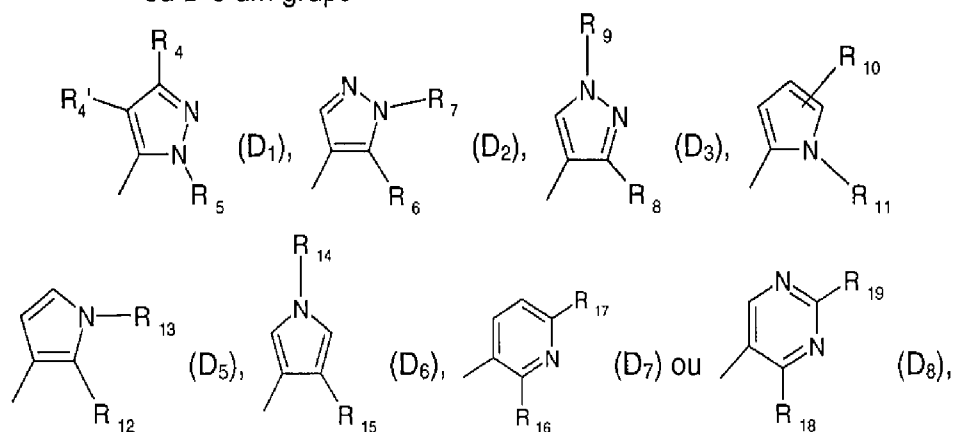
C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino, C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino, C₂-C₄alquilcarbonila, C₂-C₆alcoxycarbonila, C₂-C₆alquilaminocarbonila, C₃-C₆dialquilaminocarbonila, C₂-C₆alcoxycarbonilóxi, C₂-C₆alquilaminocarbonilóxi, C₃-C₆dialquilaminocarbonilóxi ou C₃-C₆trialquilsilila;

n é 0, 1, 2 ou 3;

cada de R₂ e R₃, que pode ser igual ou diferente, representa hidrogênio, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila ou C₃-C₈cicloalquila; ou C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆alquinila ou C₃-C₈cicloalquila substituída por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, nitro, ciano, hidróxi, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino, C₃-C₆cicloalquilamino e C₁-C₆alquil-C₃-C₆cicloalquilamino;

D é fenila, 2-piridila, 3-piridila ou 4-piridila; ou fenila, 2-piridila, 3-piridila ou 4-piridila mono-, di- ou trissubstituído por C₁-C₆alquila, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆haloalquila, halogênio, ciano, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄haloalquilsufinila ou C₁-C₄haloalquilsulfonila;

ou D é um grupo



R₄, R₄', R₁₀, R₁₇, e R₁₉ independentemente um do outro, são hidrogênio, C₁-C₆alquila, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆haloalquila, halogênio, ciano, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₂-C₄alcoxycarbonila, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄haloalquilsufinila ou

C₁-C₄haloalquilsulfonila;

R₅, R₆, R₈, R₁₁, R₁₂, R₁₅, R₁₆ e R₁₈ independentemente um do outro, são C₁-C₆alquila, ou C₁-C₆alquila mono-, di- ou trissubstituído por halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₄alcóxi, C₂-C₄alcoxicarbonila, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alquilamino, C₂-C₄dialquilamino ou C₃-C₆cicloalquilamino; ou são fenila, 2-piridila, 3-piridila, 4-piridila; ou são ou fenila, 2-piridila, 3-piridila ou 4-piridila mono-, di- ou trissubstituído por C₁-C₆alquila, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆haloalquila, halogênio, ciano, C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄haloalquilsufinila ou C₁-C₄haloalquilsulfonila;

R₇, R₉, R₁₃ e R₁₄ independentemente um do outro, são hidrogênio, C₁-C₆alquila, C₁-C₆haloalquila, C₂-C₆alquenila, C₂-C₆haloalquenila, C₃-C₆alquenila ou C₃-C₆haloalquenila e sais/isômeros/enantiômeros/tautômeros/N-óxidos agronomicamente aceitáveis destes compostos.

Os compostos I, que têm pelo menos um centro básico podem formar, por exemplo, sais de adição de ácido, por exemplo, com ácidos inorgânicos fortes, tais como ácidos minerais, por exemplo, ácido perclórico, ácido sulfúrico, ácido nítrico, ácido nitroso, um ácido fosforoso ou um ácido hidroalílico, com ácidos carboxílicos orgânicos, tais como ácidos C₁-C₄alcanocarboxílicos que são não substituídos ou substituídos, por exemplo, por halogênio, por exemplo, ácido acético, tal como ácidos dicarboxílicos saturados ou insaturados, por exemplo, ácido oxálico, ácido malônico, ácido succínico, ácido fumárico ou ácido ftálico, tal como ácidos hidroxicarboxílicos, por exemplo, ácido ascórbico, ácido láctico, ácido málico, ácido tartárico ou ácido cítrico, ou tal como ácido benzóico, ou com ácidos sulfônicos orgânicos, tais como ácidos C₁-C₄alcano- ou arilsulfônicos que são substituídos ou não substituídos, por exemplo, por halogênio, por exemplo, ácido metano- ou p-toluenossulfônico. Os compostos I, que têm pelo menos um grupo ácido podem formar, por exemplo, sais com bases, por exemplo, sais minerais tais como sais de metais de álcali ou alcalinos-terrosos, por exemplo, sais de sódio, potássio, ou magnésio, ou sais com amônia ou uma amina orgânica, tal como morfolina, piperidina, pirolidina, uma mono-, di- ou tri-

quilamina inferior, por exemplo, etil-, dietil-, trietil- ou dimetilpropilamina, ou uma mono-, di- ou triidróxi-alquilamina inferior, por exemplo, mono-, di- ou trietanolamina. Onde apropriado, os sais internos correspondentes podem também ser formados. Os sais agroquimicamente vantajosos são os preferidos no escopo da invenção; entretanto, a invenção também abrange sais que têm desvantagem para o uso agroquímico, por exemplo, sais que são tóxicos para abelhas ou peixes, e que são empregados, por exemplo, para a isolamento ou purificação de compostos I livres, ou sais agroquimicamente utilizáveis destes. Devido à ligação íntima entre os compostos I na forma livre e na forma de seus sais, para os propósitos da invenção dos compostos I livres ou seus sais aqui anteriormente e a seguir devem respectivamente ser entendidos como incluindo, onde apropriado, os sais correspondentes ou os compostos I livres. O mesmo aplica-se aos tautômeros de compostos I e sais destes. Em geral, a forma livre é preferida em cada caso.

Os grupos alquila que ocorrem nas definições dos substituintes podem ser de cadeia linear ou ramificada e são, por exemplo, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, sec-butila, iso-butila, terc-butila, pentila, hexila, heptila e octila e seus isômeros ramificados. Radicais de alcóxi, alquenila e alquinila são derivados dos radicais de alquila mencionados. Os grupos alquenila e alquinila podem ser mono- ou poliinsaturados.

O halogênio é geralmente flúor, cloro, bromo ou iodo. Isto também aplica-se correspondentemente, ao halogênio em combinação com outros significados, tal como haloalquila ou halofenila.

Os grupos haloalquila preferivelmente têm um comprimento de cadeia de 1 a 6 átomos de carbono. Haloalquila é, por exemplo, fluorometila, difluorometila, trifluorometila, clorometila, diclorometila, triclorometila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-fluoroetila, 2-cloroetila, pentafluoroetila, 1,1-diflúor-2,2,2-tricloroetila, 2,2,3,3-tetrafluoroetila e 2,2,2-tricloroetila; preferivelmente triclorometila, difluoroclorometila, difluorometila, trifluorometila e diclorofluorometila.

Os grupos haloalquenila adequados que são mono- ou polisubstituídos por halogênio, o halogênio sendo flúor, cloro, bromo e iodo e

em particular flúor e cloro, por exemplo, 2,2-diflúor-1-metilvinila, 3-fluoropropenila, 3-cloropropenila, 3-bromopropenila, 2,3,3-trifluoropropenila, 2,3,3-tricloropropenila e 4,4,4-trifluorobut-2-en-1-ila. Entre os grupos C_3 - C_{20} alquenila que são grupos mono-, di- ou trissubstituídos por halogênio, a preferência é dada àqueles tendo um comprimento de cadeia de 3 a 5 átomos de carbono.

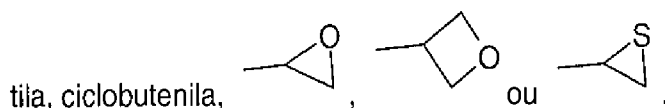
Os grupos haloalquinila adequados são, por exemplo, grupos alquinila que são mono- ou polissubstituídos por halogênio, o halogênio sendo bromo, iodo e em particular flúor e cloro, por exemplo, 3-fluoropropinila, 3-cloropropinila, 3-bromopropinila, 3,3,3-trifluoropropinila e 4,4,4-trifluorobut-2-in-1-ila. Entre os grupos alquinila que são mono- ou polissubstituídos por halogênio, a preferência é dada àqueles tendo um comprimento de cadeia de 3 a 5 átomos de carbono.

Os grupos alcóxi preferivelmente tem um comprimento de cadeia preferido de 1 a 6 átomos de carbono. Alcóxi é, por exemplo, metóxi, etóxi, propóxi, i-propóxi, n-butóxi, isobutóxi, sec-butóxi e terc-butóxi e também radicais de pentilóxi e hexilóxi isoméricos; preferivelmente metóxi e etóxi.

Alcoxycarbonila é, por exemplo, metoxycarbonila, etoxycarbonila, propoxycarbonila, isopropoxycarbonila, n-butoxycarbonila, isobutoxycarbonila, sec-butoxycarbonila ou terc-butoxycarbonila; preferivelmente metoxycarbonila ou etoxycarbonila. Os grupos haloalcóxi preferivelmente têm um comprimento de cadeia de 1 a 6 átomos de carbono. Haloalcóxi é, por exemplo, fluorometóxi, difluorometóxi, trifluorometóxi, 2,2,2-trifluoroetóxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetóxi, 2-fluoroetóxi, 2-cloroetóxi, 2,2-difluoroetóxi e 2,2,2-tricloroetóxi; preferivelmente difluorometóxi, 2-cloroetóxi e trifluorometóxi. Os grupos alquiltio preferivelmente têm um comprimento de cadeia de 1 a 6 átomos de carbono. Alquiltio é, por exemplo, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio ou terc-butiltio, preferivelmente metiltio e etiltio. Alquilsulfinila é, por exemplo, metilsulfinila, etilsulfinila, propilsulfinila, isopropilsulfinila, n-butilsulfinila, isobutilsulfinila, sec-butilsulfinila, terc-butilsulfinila; preferivelmente metilsulfinila e etilsulfinila.

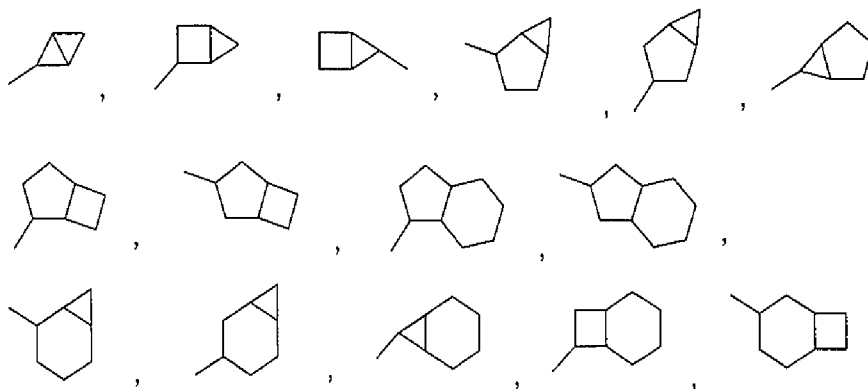
Alquilsulfonila é, por exemplo, metilsulfonila, etilsulfonila, propilsulfonila, isopropilsulfonila, n-butilsulfonila, isobutilsulfonila, sec-butilsulfonila ou terc-butilsulfonila; preferivelmente metilsulfonila ou etilsulfonila. Os grupos alcoxialcóxi preferivelmente têm um comprimento de cadeia de 1 a 8 átomos de carbono. Exemplos de grupos alcoxialcóxi são: metoximetóxi, metoxietóxi, metoxipropóxi, etoximetóxi, etoxietóxi, propoximetóxi ou butoxibutóxi. Alquilamino é, por exemplo, metilamino, etilamino, n-propilamino, isopropilamino ou as butilaminas isoméricas. Dialquilamino é, por exemplo, dimetilamino, metiletilamino, dietilamino, n-propilmetilamino, dibutilamino e diisopropilamino. A preferência é dada aos grupos alquilamino tendo um comprimento de cadeia de 1 a 4 átomos de carbono. Os grupos alcoxialquila preferivelmente têm um comprimento de cadeia de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxialquila é, por exemplo, metoximetila, metoxietila, etoximetila, etoxietila, n-propoximetila, n-propoxietila, isopropoximetila ou isopropoxietila. Alquiltioalquila grupos preferivelmente têm de 1 a 8 átomos de carbono. Alquiltioalquila é, por exemplo, metiltiometila, metiltioetila, etiltiometila, etiltioetila, n-propiltiometila, n-propiltioetila, isopropiltiometila, isopropiltioetila, butiltiometila, butiltioetila ou butiltiobutila. Os grupos cicloalquila preferivelmente têm de 3 a 6 átomos de carbono de anel, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila e cicloexila. A fenila, também como parte de um substituinte tal como fenóxi, benzila, benzilóxi, benzoíla, feniltio, fenilalquila, fenoxialquila, pode ser substituída. Neste caso, os substituintes podem estar em posições *orto*, *meta* e/ou *para*. São posições de substituintes preferidas as posições *orto* e *para* para o ponto de ligação de anel.

Exemplos para B como um sistema de anel de três a quatro membros opcionalmente substituído que é totalmente ou parcialmente saturado e pode conter um heteroátomo do grupo consistindo em nitrogênio, oxigênio e enxofre, são ciclopropila, metil-ciclopropila, ciclopropenila, ciclobutila, ciclobutenila,

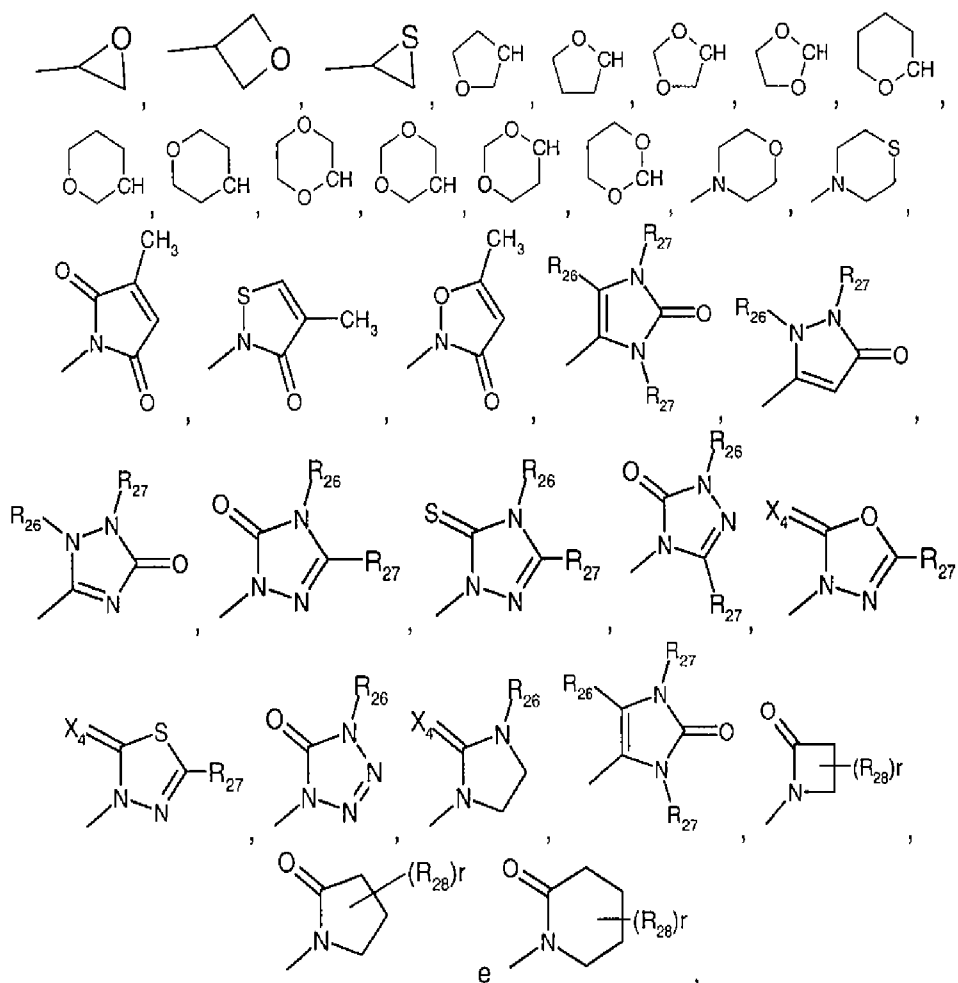


De acordo com a presente invenção, um sistema de anel monocíclico ou bicíclico fundido de três a dez membros que pode ser parcialmen-

te saturado ou totalmente saturado é, dependendo do número de membros de anel, por exemplo, selecionado do grupo consistindo em



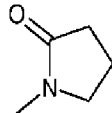
- 5 ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, cicloexila, em que os referidos grupos cicloalquila para sua parte podem ser preferivelmente não substituídos ou substituídos por C₁-C₆alquila ou halogênio, ou é



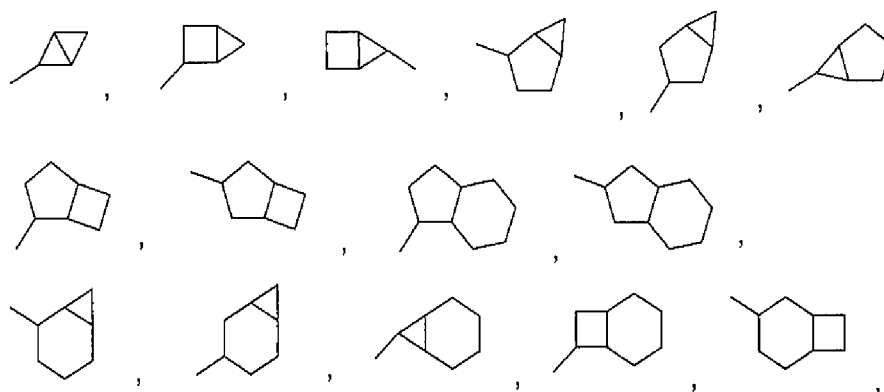
em que cada R₂₆ é metila, cada R₂₇ e cada R₂₈ são independentemente hidrogênio, C₁-C₃alquila, C₁-C₃alcóxi, C₁-C₃alquiltio ou trifluorometila, X₄ é oxi-

gênio ou enxofre e $r = 1, 2, 3$ ou 4 .

Onde nenhuma valência livre é indicada naquelas definições, por exemplo, como no , sítio de ligação é localizado no átomo de car-

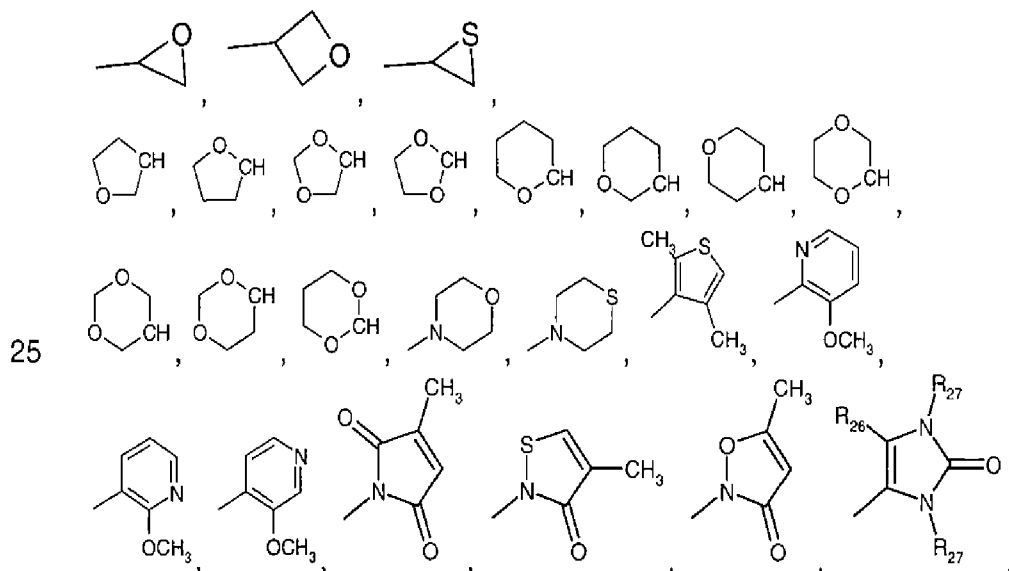
- bono rotulado "CH" ou em um caso tal como, por exemplo,  no sítio
- 5 de ligação indicado no botão esquerdo. A segunda valência para o sistema de anel bivalente de substituinte A ou Y pode ser localizada em qualquer posição adequada do anel.

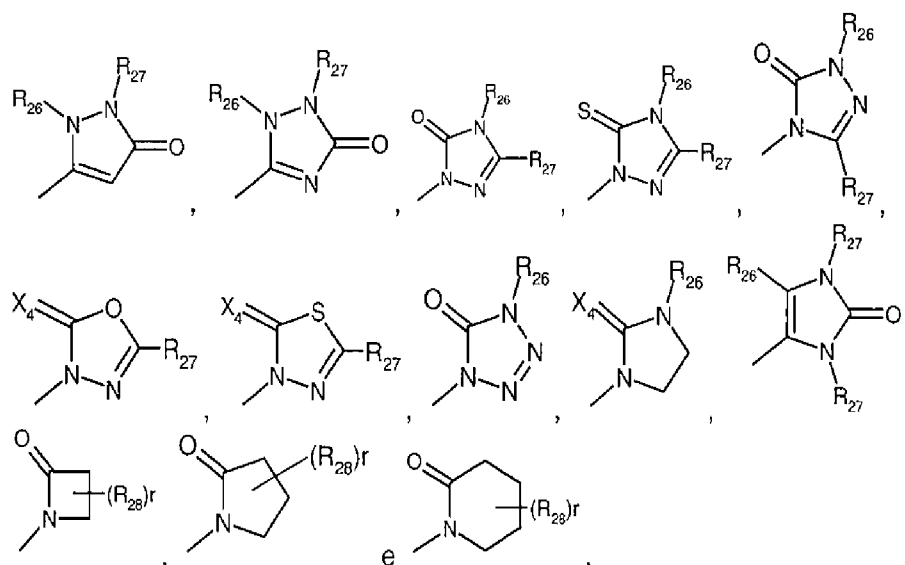
- De acordo com a presente invenção, um sistema de anel monocíclico ou bicíclico fundido de três a dez membros que pode ser aromático,
- 10 parcialmente saturado ou totalmente saturado é, dependendo do número de membros de anel, por exemplo, selecionado do grupo consistindo em



- ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, cicloexila, em que os referidos grupos
- 15 cicloaquila para suas partes podem ser preferivelmente não substituídos ou substituídos por C_1 - C_6 alquila ou halogênio, ou é fenila, benzila, naftila ou os seguintes grupos heterocíclicos: pirrolila; piridila; pirazolila; pirimidila; pirazina;
- 20 1H-pirazol-3-il)-; (1-etil-1H-pirazol-3-il)-; (1-propil-1H-pirazol-3-il)-; (1H-pirazol-3-il)-; (1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-; (4-cloro-1-metil-1H-pirazol-3-il)-; (1H-pirazol-1-il)-; (3-metil-1H-pirazol-1-il)-; (3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)-; (3-isoxazolil)-; (5-metil-3-isoxazolil)-; (3-metil-5-isoxazolil)-; (5-isoxazolil)-; (1H-pirrol-2-il)-; (1-metil-1H-pirrol-2-il)-; (1H-pirrol-1-il)-; (1-metil-1H-pirrol-3-il)-; (2-furanil)-; (5-metil-2-furanil)-; (3-furanil)-; (5-metil-2-tienil)-; (2-tienil)-; (3-tienil)-; (1-metil-1H-
- 25

- imidazol-2-il)-; (1H-imidazol-2-il)-; (1-metil-1H-imidazol-4-il)-; (1-metil-1H-imidazol-5-il)-; (4-metil-2-oxazolil)-; (5-metil-2-oxazolil)-; (2-oxazolil)-; (2-metil-5-oxazolil)-; (2-metil-4-oxazolil)-; (4-metil-2-tiazolil)-; (5-metil-2-tiazolil)-; (2-tiazolil)-; (2-metil-5-tiazolil)-; (2-metil-4-tiazolil)-; (3-metil-4-isotiazolil)-; (3-metil-5-isotiazolil)-; (5-metil-3-isotiazolil)-; (1-metil-1H-1,2,3-triazol-4-il)-; (2-metil-2H-1,2,3-triazol-4-il)-; (4-metil-2H-1,2,3-triazol-2-il)-; (1-metil-1H-1,2,4-triazol-3-il)-; (1,5-dimetil-1H-1,2,4-triazol-3-il)-; (3-metil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-; (5-metil-1H-1,2,4-triazol-1-il)-; (4,5-dimetil-4H-1,2,4-triazol-3-il)-; (4-metil-4H-1,2,4-triazol-3-il)-; (4H-1,2,4-triazol-4-il)-; (5-metil-1,2,3-oxadiazol-4-il)-; (1,2,3-oxadiazol-4-il)-; (3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-; (5-metil-1,2,4-oxadiazol-3-il)-; (4-metil-3-furazanil)-; (3-furazanil)-; (5-metil-1,2,4-oxadiazol-2-il)-; (5-metil-1,2,3-tiadiazol-4-il)-; (1,2,3-tiadiazol-4-il)-; (3-metil-1,2,4-tiadiazol-5-il)-; (5-metil-1,2,4-tiadiazol-3-il)-; (4-metil-1,2,5-tiadiazol-3-il)-; (5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-; (1-metil-1H-tetrazol-5-il)-; (1H-tetrazol-5-il)-; (5-metil-1H-tetrazol-1-il)-; (2-metil-2H-tetrazol-5-il)-; (2-etil-2H-tetrazol-5-il)-; (5-metil-2H-tetrazol-2-il)-; (2H-tetrazol-2-il)-; (2-piridil)-; (6-metil-2-piridil)-; (4-piridil)-; (3-piridil)-; (6-metil-3-piridazinil)-; (5-metil-3-piridazinil)-; (3-piridazinil)-; (4,6-dimetil-2-pirimidinil)-; (4-metil-2-pirimidinil)-; (2-pirimidinil)-; (2-metil-4-pirimidinil)-; (2-cloro-4-pirimidinil)-; (2,6-dimetil-4-pirimidinil)-; (4-pirimidinil)-; (2-metil-5-pirimidinil)-; (6-metil-2-pirazinil)-; (2-pirazinil)-; (4,6-dimetil-1,3,5-triazin-2-il)-; (4,6-dicloro-1,3,5-triazin-2-il)-; (1,3,5-triazin-2-il)-; (4-metil-1,3,5-triazin-2-il)-; (3-metil-1,2,4-triazin-5-il)-; (3-metil-1,2,4-triazin-6-il)-;

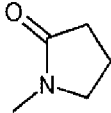




em que cada R_{26} é metila, cada R_{27} e cada R_{28} são independentemente hidrogênio, C_1 - C_3 alquila, C_1 - C_3 alcóxi, C_1 - C_3 alquiltio ou trifluorometila, X_4 é oxigênio ou enxofre e $r = 1, 2, 3$ ou 4 .

Onde nenhuma valência livre é indicada naquelas definições,

por exemplo, como , no sítio de ligação é localizado no átomo de carbono rotulado "CH" ou em um caso tal como, por exemplo,

 no sítio de ligação indicado no botão esquerdo.

A preferência é dada aos subgrupos de compostos de fórmula I em que

- a) p e/ou q é 0;
- b) E e/ou Z é oxigênio; e/ou
- c) R_2 e/ou R_3 é hidrogênio e/ou
- d) A é um sistema de anel monocíclico saturado de três a seis membros bivalente.

X é preferivelmente oxigênio, NH ; N -metila ou N -etila.

Y é preferivelmente C_3 - C_6 cicloalquila, especialmente ciclopropila.

R_4' é preferivelmente hidrogênio.

A menção especial deve ser feita aos compostos de Fórmula I, em que R_1 é selecionado de C_1 - C_4 alquila, halogênio, C_1 - C_5 haloalquila, nitro,

C₁-C₄alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄haloalquilsufinila e C₁-C₄haloalquilsulfonila, em particular de halogênio e C₁-C₆alquila, preferivelmente selecionado de metila e halogênio, mais preferivelmente selecionado de metila e cloro, e n é 1 ou 2, preferivelmente 1. A posição preferida de R₁ é *meta* para o grupo -C(Z)-N(R₃)-A-X-Y-B.

Um grupo destacado de compostos de Fórmula I, compreende aqueles compostos em que A é C₁-C₆alquileno que pode ser substituído por C₃-C₆cicloalquila, C₂-C₆alquenila, ciano, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alcóxi, halogênio ou C₁-C₆haloalquila; ou A é C₃-C₆cicloalquileno. Preferivelmente A é C₃-C₆cicloalquileno, mais preferivelmente ciclopropileno.

Em compostos preferidos de fórmula I, B é ciclopropila, oxetanila ou ciclobutila, preferivelmente ciclopropila.

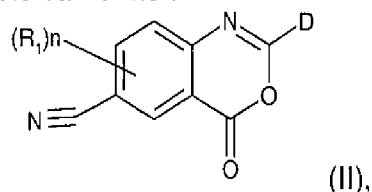
Ênfase especial deve também ser dada aos compostos de fórmula I em que D é um grupo D₁, em que R₅ é 2-piridila que pode ser substituída por halogênio, preferivelmente que é monossubstituída por cloro na posição 3 do anel de piridina e R₄ é halogênio preferivelmente cloro ou bromo, C₁-C₆haloalquila, C₁-C₄haloalcóxi mais preferivelmente 2,2,2-trifluoroetóxi, preferivelmente C₁-C₆haloalquila, mais preferivelmente trifluorometila.

A preferência é também dada aos compostos de Fórmula I em que, em particular B é ciclopropila ou ciclobutila que pode ser mono- di-, ou trissubstituído por halogênio, C₁-C₄alquila, hidróxi, ciano, C₁-C₄alcóxi ou C₁-C₄alquiltio; ou B é CH(CH₂O), CH(CHMeO), CH-(CMe₂O), CH(CH₂S), CH(CH₂OCH₂), CH(CHMeOCH₂), CH(CMe₂OCH₂), CH(CH₂S-(O)₂CH₂), CH(CHMeS(O)₂CH₂), CH(CMe₂S(O)₂CH₂), C(Me)-(CH₂O), C(Me)(CHMeO), C(Me)-(CMe₂O), C(Me)-(CH₂S), C(Me)-(CH₂OCH₂), C(Me)(CHMeOCH₂), C(Me)-(CMe₂OCH₂), C(Me)-(CH₂S(O)₂CH₂), C(Me)-(CHMe-S(O)₂CH₂) ou C(Me)-(CMe₂-S(O)₂CH₂). Em compostos especialmente preferidos de Fórmula I B é ciclopropila ou ciclobutila que pode ser substituído por halogênio ou metila, em particular por cloro, bromo ou metila; mais preferivelmente B é ciclopropila.

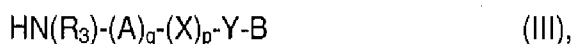
O processo de acordo com a invenção para preparar os compostos da Fórmula I é realizado analogamente aos processos conhecidos, por exemplo, aqueles descritos nos WO 01/70671, WO 03/016284, WO 03/015518, WO 04/033468 e WO 04/067528.

5 O processo para a preparação de um composto da Fórmula I ou, onde apropriado, um tautômero deste, em cada caso em forma livre ou em forma de sal, compreende, por exemplo,

a) preparar um composto da Fórmula I, em que R_2 é hidrogênio e E e Z são oxigênio, ou, onde apropriado, um tautômero e/ou sal deste, reagindo-se um composto da Fórmula

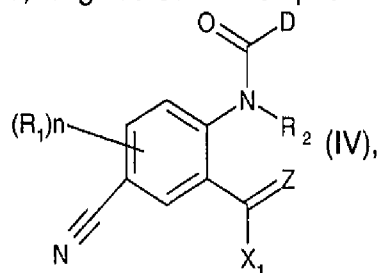


em que R_1 , n, e D têm os significados fornecidos pela fórmula I, ou, onde apropriado, um tautômero e/ou sal deste com um composto da Fórmula

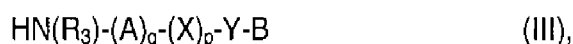


em que R_3 , p, q, A, X, Y e B têm os significados fornecidos pela fórmula I, ou, onde apropriado, com um tautômero e/ou sal deste ou,

b) preparar um composto da Fórmula I, ou, onde apropriado, um tautômero e/ou sal deste, reagindo-se um composto da Fórmula



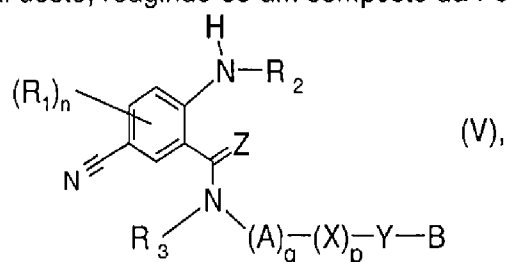
em que R_1 , R_2 , n, Z e D têm os significados fornecidos pela fórmula I; e X_1 é um grupo de partida, ou, onde apropriado, um tautômero e/ou sal deste com um composto da Fórmula



em que R_3 , p, q, A, X, Y e B têm os significados fornecidos pela fórmula I, ou, onde apropriado, com um tautômero e/ou sal deste ou,

c) preparar um composto da Fórmula I, ou, onde apropriado, um

tautômero e/ou sal deste, reagindo-se um composto da Fórmula



em que R_1 , R_2 , R_3 , n , p , q , A , X , Y , Z e B têm os significados fornecidos pela fórmula I, ou, onde apropriado, um tautômero e/ou sal deste com um composto da Fórmula



em que R_1 tem o significado fornecido pela Fórmula I; e X_2 é um grupo de partida, ou, onde apropriado, com um tautômero e/ou sal deste e/ou convertendo-se um composto da Fórmula I ou, onde apropriado, um tautômero deste, em cada caso em forma livre ou em forma de sal, em outro composto da Fórmula I ou, onde apropriado, um tautômero deste, separando-se uma
10 mistura isômera, que pode ser obtida de acordo com o processo, e isolando-se o isômero desejado e/ou convertendo-se um composto livre da Fórmula I ou, onde apropriado, um tautômero deste em um sal ou um sal de um composto da Fórmula I ou, onde apropriado, um tautômero deste no composto
15 livre da Fórmula I ou, onde apropriado, um tautômero deste ou em outro sal.

Os compostos de Fórmula II são novos e são especialmente desenvolvidos para a preparação dos compostos de Fórmula I de acordo com a presente invenção. Os compostos de Fórmula II, por esse motivo, constituem um outro objeto da presente invenção. Os compostos de Fórmula
20 II, podem ser preparados analogamente pelos métodos descritos no WO 04/111030.

Os compostos de Fórmula V são também novos e são especialmente desenvolvidos pela preparação dos compostos de Fórmula I, de acordo com a presente invenção. Os compostos de Fórmula V, por esse
25 motivo, constituem um outro objeto da presente invenção. Os compostos de fórmula V, são preferidos, em que

R_1 é C_1 - C_4 alquila, halogênio, C_1 - C_5 haloalquila, nitro, C_1 - C_4 alcóxi,

C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄alquilsufinila, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄haloalquiltio, C₁-C₄haloalquilsufinila ou C₁-C₄haloalquilsulfonila;

R₂ e R₃ são hidrogênio;

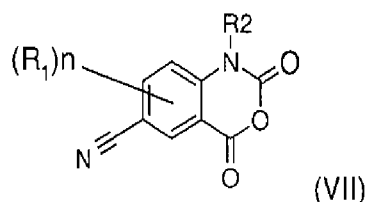
A é C₁-C₆alquileno que pode ser substituído por C₃-C₆cicloalquila, C₂-C₆alquenila, ciano, C₁-C₄alquiltio, C₁-C₄alquilsulfonila, C₁-C₄alcóxi, halogênio ou C₁-C₆haloalquila; ou A é C₃-C₆cicloalquileno;

p e q são, independentemente um do outro, 0 ou 1;

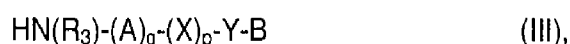
X é oxigênio, NH; NCH₃ ou NC₂H₅;

Y é C₁-C₄alquileno, C₂-C₆alquenileno ou C₃-C₆alquinileno ou, C₁-C₄alquileno, C₂-C₆alquenileno ou C₃-C₆alquinileno substituído por halogênio, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₄alquilsulfonila ou C₁-C₄alcóxi; e B é ciclopropila ou ciclobutila que pode ser mono-, di-, ou trissubstituída por halogênio, C₁-C₄alquila, hidróxi, ciano, C₁-C₄alcóxi ou C₁-C₄alquiltio; ou B é CH(CH₂O), CH(CHMeO), CH-(CMe₂O), CH(CH₂S), CH(CH₂OCH₂), CH(CHMeOCH₂), CH(CMe₂OCH₂), CH(CH₂S-(O)₂CH₂), CH(CHMeS(O)₂CH₂), CH(CMe₂S(O)₂CH₂), C(Me)-(CH₂O), C(Me)(CHMeO), C(Me)-(CMe₂O), C(Me)-(CH₂S), C(Me)-(CH₂OCH₂), C(Me)(CHMeOCH₂), C(Me)-(CMe₂OCH₂), C(Me)-(CH₂S(O)₂CH₂), C(Me)-(CHMe-S(O)₂CH₂) ou C(Me)-(CMe₂-S(O)₂CH₂), preferivelmente B é ciclopropila ou ciclobutila que pode ser mono-, di-, ou trissubstituída por halogênio, C₁-C₄alquila, hidróxi, ciano, C₁-C₄alcóxi ou C₁-C₄alquiltio.

O processo para a preparação de um composto da Fórmula V ou, onde apropriado, um tautômero deste, em cada caso em forma livre ou em forma de sal, compreende, por exemplo, preparar composto de Fórmula V ou, onde apropriado, um tautômero e/ou sal deste, reagindo-se um composto da Fórmula



em que R₁, R₂, n têm os significados dados na Fórmula I, com um composto de Fórmula



em que R_3 , p, q, A, X, Y e B têm os significados fornecidos pela fórmula I, ou, onde apropriado, com um tautômero e/ou sal deste.

O que foi referido acima para tautômeros e/ou sais de compostos I, aplica-se analogamente aos materiais de partida mencionados aqui anteriormente e a seguir com respeito aos tautômeros e/ou sais deste.

As reações descritas aqui anteriormente e a seguir são realizadas de maneira conhecidas por si, na ausência ou, normalmente, na presença de um diluente ou solvente adequado ou de uma mistura destes, o processo sendo realizado, como requerido, com resfriamento, em temperatura ambiente ou com aquecimento, por exemplo, em uma variação de temperatura de aproximadamente -80°C ao ponto de ebulição da mistura de reação, preferivelmente de aproximadamente -20°C a aproximadamente $+150^{\circ}\text{C}$, e, se requerido, em um vaso selado, sob pressão reduzida, normal ou elevada, em uma atmosfera de gás inerte e/ou sob condições anidrasas. Especialmente as condições de reação vantajosas podem ser observadas dos exemplos.

A menos que de outro modo especificado, os materiais de partida mencionados aqui anteriormente e a seguir, que são usados para a preparação dos compostos I ou, onde apropriado, os tautômeros destes, em cada caso em forma livre ou em forma de sal, são conhecidos ou podem ser preparados por métodos conhecidos por si, por exemplo, de acordo com a informação fornecida abaixo.

Variante a)

Os reagentes podem ser reagidos entre si como tal, isto é, sem adição de um solvente ou diluente, por exemplo, na fusão. Na maioria dos casos, entretanto, é vantajoso adicionar um solvente inerte ou diluente ou uma mistura destes. Exemplos de tais solventes ou diluentes que podem ser mencionados são: haloidrocarbonetos ou hidrocarbonetos aromáticos, alifáticos e alicíclicos tais como benzeno, tolueno, xileno, mesitileno, tetralina, clorobenzeno, diclorobenzeno, bromobenzeno, éter de petróleo, hexano, cicloexano, diclorometano, triclorometano, tetraclorometano, dicloroetano, tricloroetano ou tetracloroetano; ésteres tais como acetato de etila; éteres

tais como éter de dietila, éter de dipropila, éter de diisopropila, éter de dibutila, éter de metila de terc-butila, éter de monoetila de etileno glicol, éter de monoetila de etileno glicol, éter de dimetila de etileno glicol, éter de dimetoxidietila, tetraidrofurano ou dioxano; cetonas, tais como acetona, cetona de metil etila ou cetona de metil isobutila; álcoois, tais como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, etileno glicol ou glicerol; amidas tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dietilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilpirrolidona ou triamida de hexametilfosfórico; nitrilos, tais como acetonitrila ou propionitrila; e sulfoxidos, tais como sulfóxido de dimetila.

10 A reação é vantajosamente realizada em uma variação de temperatura de aproximadamente -80°C a aproximadamente +140°C, preferivelmente de aproximadamente -30°C a aproximadamente +100°C, na maioria dos casos na variação entre temperatura ambiente e aproximadamente +80°C.

15 Variante b)

Exemplos de grupos de partida adequados X_1 nos compostos IV são hidróxi, C_1 - C_8 alcóxi, halo- C_1 - C_8 alcóxi, C_1 - C_8 alcanoilóxi, mercapto, C_1 - C_8 alquiltio, halo- C_1 - C_8 alquiltio, C_1 - C_8 alquilsulfonilóxi, halo- C_1 - C_8 alquilsulfonilóxi, benzenossulfonilóxi, toluenossulfonilóxi e halogênio, tal
20 como cloro. Os preferidos são hidróxi, C_1 - C_8 alcóxi e cloro.

Os reagentes podem ser reagidos entre si como tal, isto é, sem a adição de um solvente ou diluente. Na maioria dos casos, entretanto, é vantajoso adicionar um solvente ou diluente inerte ou uma mistura destes. Exemplos de diluentes ou solventes adequados são do tipo descrito sob a
25 variante a).

A reação é vantajosamente realizada em uma variação de temperatura de aproximadamente -80°C a aproximadamente +140°C, preferivelmente de aproximadamente -20°C a aproximadamente +100°C, na maioria dos casos a variação entre temperatura ambiente e a temperatura de
30 refluxo da mistura de reação.

Variante c)

Exemplos de grupos de partida adequados X_2 nos compostos VI

são hidróxi, C₁-C₈alcóxi, halo-C₁-C₈alcóxi, C₁-C₈alcanoilóxi, mercapto, C₁-C₈alquiltio, halo-C₁-C₈alquiltio, C₁-C₈alquilsulfonilóxi, halo-C₁-C₈alquilsulfonilóxi, benzenossulfonilóxi, toluenossulfonilóxi e halogênio, tal como cloro. Os preferidos são hidróxi e cloro.

- 5 Os reagentes podem ser reagidos na presença de uma base. Exemplos de bases adequadas para facilitar a separação de HX₂ são hidroxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, amidas de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, alcóxidos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, acetatos de
- 10 metal de álcali ou metal alcalino-terroso, carbonatos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, dialquilamidas de metal de álcali ou metal alcalino-terroso ou alquilsililamidas de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, alquilaminas, alquilenodiaminas, cicloalquilaminas livres ou N-alquiladas saturadas ou insaturadas, heterociclos básicos, hidroxidos de amônio e aminas
- 15 carbocíclicas. Exemplos que podem ser mencionados são hidróxido de sódio, hidreto de sódio, amida de sódio, metóxido de sódio, acetato de sódio, carbonato de sódio, terc-butoxido de potássio, hidróxido de potássio, carbonato de potássio, hidreto de potássio, diisopropilamida de lítio, bis(trimetilsilil)amida de potássio, hidreto de cálcio, trietilamina, diisopropileti-
- 20 lamina, trietenodiamina, cicloexilamina, N-cicloexil-N,N-dimetilamina, N,N-dietilanilina, piridina, 4-(N,N-dimetilamino)piridina, quinuclidina, N-metilmorfolina, hidróxido de benziltrimetilamônio e 1,8-diaza-biciclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU).

- Os reagentes podem ser reagidos entre si como tal, isto é, sem
- 25 a adição de um solvente ou diluente. Na maioria dos casos, entretanto, é vantajoso adicionar um solvente ou diluente inerte ou uma mistura destes. Exemplos de diluentes ou solventes adequados são do tipo descrito sob a variante a). Se a reação não for realizada na presença de uma base, as bases que são empregadas em excesso, tais como trietilamina, piridina, N-
- 30 metilmorfolina ou N,N-dietilanilina, podem também agir como solventes ou diluentes.

A reação é vantajosamente realizada em uma variação de tem-

peratura de aproximadamente -80°C a aproximadamente $+140^{\circ}\text{C}$, preferivelmente de aproximadamente -30°C a aproximadamente $+100^{\circ}\text{C}$, na maioria dos casos a variação entre temperatura ambiente e aproximadamente $+80^{\circ}\text{C}$.

5 Um composto I pode ser convertido de uma maneira conhecida por si em outro composto I, reagindo-se um ou mais substituintes do composto de partida I da maneira costumeira por (um)outro substituinte(s) de acordo com a invenção.

Por exemplo,

10 - em compostos I, em que R_2 é hidrogênio, este hidrogênio R_2 pode ser substituído por um substituinte R_2 , que é diferente de hidrogênio; ou

- em compostos I, em que R_3 é hidrogênio, este hidrogênio R_3 pode ser substituído por um substituinte R_3 , que é diferente de hidrogênio.

15 Dependendo da escolha das condições de reação e materiais de partida que são adequados em cada caso, é possível, por exemplo, em uma etapa de reação apenas substituir um substituinte por outro substituinte de acordo com a invenção, ou uma pluralidade de substituintes pode ser substituída por outros substituintes de acordo com a invenção na mesma etapa de
20 reação.

Os sais de compostos I podem ser preparados de uma maneira conhecida por si. Desse modo, por exemplo, os sais de adição de ácido de compostos I são obtidos por tratamento com um ácido adequado ou um reagente permutador de íon adequado e sais com bases são obtidas por tra-
25 tamento com uma base adequada ou com um reagente permutador de íon adequado.

Os sais de compostos I podem ser convertidos de maneira costumeira nos compostos I livres, sais de adição de ácido, por exemplo, por tratamento com um composto básico adequado ou com um reagente permutador de íon e sais com bases, por exemplo, por tratamento com um ácido
30 adequado ou com um reagente permutador de íon adequado.

Os sais de compostos I podem ser convertidos de uma maneira

conhecida por si em outros sais de compostos I, sais de adição de ácido, por exemplo, em outros sais de adição de ácido, por exemplo, por tratamento de um sal de ácido inorgânico tal como cloridrato com um sal de metal adequado tal como um sal de sódio, bário, ou prata, de um ácido, por exemplo, com acetato de prata, em um solvente adequado em que um sal inorgânico que forma, por exemplo, o cloreto de prata é insolúvel e, portanto, precipita-se da mistura de reação.

Dependendo do procedimento ou das condições de reação, os compostos I, que têm propriedades de formação de sal podem ser obtidos na forma livre ou na forma de sais.

Os compostos I e, onde apropriado, os tautômeros destes, em cada caso em forma livre ou em forma de sal, podem estar presentes na forma de um dos isômeros que são possíveis ou como misturas destes, por exemplo, na forma de isômeros puros, tais como antípodas e/ou diastereômeros, ou como misturas isômeras tais como misturas enantiômeras, por exemplo, racematos, misturas diastereômeras ou misturas de racematos, dependendo do número, da configuração absoluta e relativa de átomos de carbono assimétricos que ocorrem na molécula e/ou dependendo da configuração de ligações duplas que ocorrem na molécula; a invenção refere-se aos isômeros puros e também à todas misturas isômeras que são possíveis e deve ser entendido em cada caso neste sentido aqui anteriormente e a seguir, mesmo quando os detalhes estereoquímicos não forem especificamente mencionados em cada caso.

As misturas de diastereômeros ou misturas de racematos de compostos I, em forma livre ou em forma de sal, que podem ser obtidas dependendo de quais materiais de partida e procedimentos foram escolhidos podem ser separadas de uma maneira conhecidos racematos ou diastereômeros puros nas bases das diferenças físicoquímicas dos componentes, por exemplo, por cromatografia, destilação e/ou cristalização fracional.

Misturas enantiômeras, tais como racematos, que podem ser obtidas de uma maneira similar podem ser resolvidas em antípodas ópticas, por exemplo, por recristalização de um solvente opticamente ativo, por cro-

matografia em absorventes quirais, por exemplo, cromatografia líquida de alto desempenho (HPLC) em celulose de acetila, com o auxiliar de microorganismos adequados, por clivagem com enzimas imobilizadas, específicas, por meio da formação de compostos de inclusão, por exemplo, empregando-se éteres coroa quiral, onde apenas um enantiômero é complexado, ou por conversão em sais distereoméricos, por exemplo, reagindo-se um racemato de produto final básico com um ácido opticamente ativo, tal como um ácido carboxílico, por exemplo, cânfora, ácido tartárico ou málico, ácido sulfônico, por exemplo, ácido canforsulfônico, e separando-se a mistura diastereômera que pode ser obtida desta maneira, por exemplo, por cristalização fracional com base em suas solubilidades diferentes, para fornecer os diastereômeros, cujo enantiômero desejado pode ser determinado livre pela ação de agentes adequados, por exemplo, agentes básicos.

Os diastereômeros ou enantiômeros puros podem ser obtidos de acordo com a invenção não apenas separando-se as misturas isômeras adequadas, porém também por métodos geralmente conhecidos de síntese diastereosseletiva ou enantiosseletiva, por exemplo, realizando-se o processo de acordo com a invenção com os materiais de partida de um estereoisômero adequado.

É vantajoso isolar ou sintetizar em cada caso o isômero biologicamente mais eficaz, por exemplo, enantiômero ou diastereômero, ou mistura isômera, por exemplo, mistura enantiômera ou mistura diastereômera, se os componentes individuais tiverem uma atividade biológica diferente.

Os compostos de acordo com a invenção e, onde apropriado, os tautômeros destes, em cada caso em forma livre ou em forma de sal, podem, se apropriado, também ser obtidos na forma de hidratos e/ou incluem outros solventes, por exemplo, aqueles que podem ter sido usados pela cristalização de compostos que estão presentes na forma sólida.

Os compostos de acordo com a invenção são ingredientes ativos preventivamente e/ou curativamente valiosos no campo de controle de peste, mesmo em baixas taxas de aplicação, que têm um espectro biocida muito favorável e são bem toleráveis por espécies de sangue quente, peixes

e plantas. Os ingredientes ativos de acordo com a invenção agem contra todos ou individuais estágios de desenvolvimento de normalmente sensíveis, porém também resistentes, pestes de animais tais como insetos ou representantes da ordem *Acarina*. A atividade inseticida ou acaricida dos

5 ingredientes ativos de acordo com a invenção pode manifestar-se em si diretamente, isto é em extermínio das pestes, que toma lugar imediatamente ou apenas após algum tempo ter passado, por exemplo, durante a ecdise, ou indiretamente, por exemplo, em uma oviposição reduzida e/ou taxa de incubação, uma boa atividade correspondente a uma taxa de extermínio (mortalidade)

10 lidade) de pelo menos 50 a 60%.

Exemplos das pestes de animal acima mencionadas são:
da ordem *Acarina*, por exemplo,

Acarus siro, *Aceria sheldoni*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Calipitrimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus carpin*

15 *ni*, *Eriophyes* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Olygonychus pratensis*, *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp. e *Tetranychus* spp.;

20 da ordem *Anoplura*, por exemplo,

Haematopinus spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. e *Phylloxera* spp.;

da ordem *Coleoptera*, por exemplo,

Agriotes spp., *Anthonomus* spp., *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cosmopolites* spp., *Curculio* spp., *Dermestes* spp., *Diabrotica*

25 spp., *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus* spp., *Melolontha* spp., *Orycaephilus* spp., *Otiorhynchus* spp., *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sitophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. e *Trogoderma* spp.;

30 da ordem *Diptera*, por exemplo,

Aedes spp., *Antherigona soccata*, *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis* spp., *Chrysomyia* spp., *Culex* spp., *Cuterebra* spp.,

- Dacus* spp., *Drosophila melanogaster*, *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Glossina* spp., *Hypoderma* spp., *Hyppobosca* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Melanagromyza* spp., *Musca* spp., *Oestrus* spp., *Orseolia* spp., *Oscinella* frit, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Rhagoletis pomonella*, *Sciara* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp. e *Tipula* spp.;
- 5 da ordem *Heteroptera*, por exemplo,
Cimex spp., *Distantiella theobroma*, *Dysdercus* spp., *Euchistus* spp., *Eurygaster* spp., *Leptocoris* spp., *Nezara* spp., *Piesma* spp., *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophara* spp. e *Triatoma* spp.;
- 10 da ordem *Homoptera*, por exemplo,
Aleurothrixus floccosus, *Aleyrodes brassicae*, *Aonidiella* spp., *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Bemisia tabaci*, *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Coccus hesperidum*, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphus* spp., *Myzus* spp., *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidotus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Tria-*
- 15 *leurodes vaporariorum*, *Trioza erytrae* e *Unaspis citri*;
- 20 da ordem *Hymenoptera*, por exemplo,
Acromyrmex, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Solenopsis* spp. e *Vespa* spp.;
- 25 da ordem *Isoptera*, por exemplo,
Reticulitermes spp.;
- da ordem *Lepidoptera*, por exemplo,
Acleris spp., *Adoxophyes* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Anticarsia gemmatilis*, *Archips* spp., *Argyro-*
- 30 *taenia* spp., *Autographa* spp., *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocrocis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylis* spp., *Coleophora* spp., *Crocidolomia*

binotalis, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydia* spp., *Diatraea* spp., *Diparopsis castanea*, *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., *Euxoa* spp., *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucoptera* 5 *scitella*, *Lithocollethis* spp., *Lobesia botrana*, *Lymantria* spp., *Lyonetia* spp., *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Operophtera* spp., *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp., *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xilostella*, *Prays* spp., *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., 10 *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., *Thaumetopoea* spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia ni* e *Yponomeuta* spp.;

da ordem *Mallophaga*, por exemplo,

Damalinea spp. e *Trichodectes* spp.;

da ordem *Orthoptera*, por exemplo,

15 *Blatta* spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Periplaneta* spp. e *Schistocerca* spp.;

da ordem *Psocoptera*, por exemplo,

Liposcelis spp.;

da ordem *Siphonaptera*, por exemplo,

20 *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. e *Xenopsylla cheopis*;

da ordem *Thysanoptera*, por exemplo,

Frankliniella spp., *Hercinothrips* spp., *Scirtothrips aurantii*, *Taeniothrips* spp., *Thrips palmi* e *Thrips tabaci*; e

da ordem *Thysanura*, por exemplo,

25 *Lepisma saccharina*.

Os ingredientes ativos de acordo com a invenção podem ser usados para controlar, isto é, conter ou destruir, as pestes dos tipos acima mencionados que ocorrem em particular em plantas, especialmente em plantas úteis e ornamentais em agricultura, em horticultura e em florestas, 30 ou em órgãos tais como frutas, flores, folhagem, caules, tubérculos ou raízes, de tais plantas, e em alguns casos mesmo em órgãos de plantas que são formados em um momento posterior do tempo, permanecem protegidos

contra estas pestes.

Colheitas alvo adequadas são, em particular, cereais, tal como trigo, cevada, centeio, aveias, arroz, trigo ou sorgo; beterraba, tal como açúcar e forragem de beterraba; fruta, por exemplo, fruta pomácea, fruta de caroço ou fruta macia, tal como maçãs, pêras, ameixas, pêssegos, amêndoas, cerejas, ou amoras, por exemplo, morangos, framboesas ou amoras pretas; colheitas leguminosas, tais como feijões, lentilhas, ervilhas ou soja; colheitas oleosas, tais como óleo de colza, mostarda, papoulas, azeitonas, girassóis, coco, rícino, cacau ou amendoim; curcúbitas, tal como abóboras, pepinos ou melões; plantas de fibra, tal como algodão, linho, cânhamo ou juta; fruta cítricas, tal como laranjas, limões, toranja ou tangerinas; vegetais, tal como espinafre, alface, aspargo, cenouras, cebolas, tomates, batatas ou pimentas sino; *Lauraceae*, tal como abacate, Canela ou cânfora; e também tabaco, nozes, café, berinjelas, cana-de-açúcar, chá, pimenta, videiras, lúpulo, a família *plantain*, plantas látex e ornamentais.

Os ingredientes ativos de acordo com a invenção são especialmente adequados para controlar *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xilostella* e *Spodoptera littoralis* em colheitas de algodão, vegetais, milho, arroz e soja. Os ingredientes ativos de acordo com a invenção são também especialmente adequados para controlar *Mamestra* (preferivelmente em vegetais), *Cydia pomonella* (preferivelmente maçãs), *Empoasca* (preferivelmente em vegetais, vinhas), *Leptinotarsa* (preferivelmente batatas) e *Chilo suppressalis* (preferivelmente arroz).

O termo "colheitas" deve ser entendido também como incluindo colheitas que foram tornadas tolerantes aos herbicidas (tal como, por exemplo, inibidores de HPPD, inibidores de ALS, por exemplo, primissulfuron, prossulfuron e trifloxissulfuron, inibidores de EPSPS (5-enol-pirovilchiquimato-3-fosfato-sintase), inibidores de GS (glutamina sintetase) como um resultado de métodos convencionais de reprodução ou engenharia genética. Um exemplo de uma colheita que foi tornada tolerante às imidazolinonas, por exemplo, imazamox, por métodos convencionais de reprodução (mutagênese) é Clearfield® colza de verão (Canola). Exemplos de colheitas

que foram tornada tolerantes às herbicidas ou classes de herbicidas por métodos de engenharia genética incluem variedades de milho resistentes a glifosato e glufosinato comercialmente disponíveis sob os nomes comerciais RoundupReady®, Herculex I® e Libertilink®.

- 5 O termo "colheitas" deve ser entendido como incluindo também colheitas de plantas que foram assim transformadas pelo uso de técnicas de DNA recombinantes que são capazes de sintetizar uma ou mais toxinas de ação seletiva, tal como são conhecidas, por exemplo, de bactérias produtoras de toxina, especialmente aquelas do *genus Bacillus*.
- 10 Toxinas que podem ser expressas por tais plantas transgênicas incluem, por exemplo, proteínas inseticidas, por exemplo, proteínas inseticidas de *Bacillus cereus* ou *Bacillus popilliae*; ou proteínas inseticidas de *Bacillus thuringiensis*, tal como δ -endotoxinas, por exemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) ou Cry9c, ou proteínas inseticidas vegetativas (VIP), por exemplo, VIP1, VIP2, VIP3 ou VIP3A; ou proteínas inseticidas de nematódeos de colonização de bactéria, por exemplo, *Photorhabdus spp.* ou *Xenorhabdus spp.*, tal como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas produzidas por animais, tal como toxinas de escorpião, toxinas de aracnídeos, toxinas de vespas e outras
- 15 neurotoxinas específicas de insetos; toxinas produzidas por fungos, tal como toxinas estreptomicetos, lectinas de planta, tal como lectinas de ervilha, lectinas de cevada ou lectinas de campainha branca; aglutininas; inibidores de proteinase, tal como inibidores de tripsina, inibidores de serina protease, patatina, cistatina, inibidores de papaína; proteínas de inativação de ribossoma (RIP), tal como ricina, milho-RIP, abrina, lufina, saporina ou briodina;
- 20 enzimas de metabolismo de esteróide, tal como 3-hidroxisteroidoxidase, ec-disteróide-UDP-glicosil-transferase, colesterol oxidases, inibidores de ecdisona, HMG-COA-reductase, bloqueadores de canais de íon, tal como bloqueadores de sódio ou cálcio, esterase de hormônio juvenil, receptores de
- 25 hormônio diurético, estilbeno sintase, bibenzil sintase, quitinases e glucanases.
- 30

No contexto da presente invenção deve ser entendido por δ -

endotoxinas, por exemplo, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) ou Cry9c, ou proteínas inseticidas vegetais (VIP), por exemplo, VIP1, VIP2, VIP3 ou VIP3A, expressamente também toxinas híbridas, toxinas truncadas e toxinas modificadas. As toxinas híbridas são re-

5 combinantemente produzidas por uma nova combinação de domínios diferentes daquelas proteínas (vide, por exemplo, WO 02/15701). As toxinas truncadas, por exemplo, uma CryIA(b) truncada, são conhecidas. No caso das toxinas modificadas, um ou mais aminoácidos da toxina de ocorrência natural são substituídos. Em tal substituição de aminoácido, preferivelmente

10 seqüências de reconhecimento de protease não naturalmente presente são inseridas na toxina, tal como, por exemplo, no caso de CryIIIA055, uma seqüência de reconhecimento de catepsina-D é inserida em uma toxina CryIIIA (vide, WO 03/018810).

Exemplos de tais toxinas ou plantas transgênicas capazes de

15 sintetizar tais toxinas são descritos, por exemplo, em EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 e WO 03/052073.

Os processos para a preparação de tais plantas transgênicas são geralmente conhecidos pela pessoa versada na técnica e são descritos,

20 por exemplo, nas publicações acima mencionadas. Ácidos deoxirribonucléico tipo CryI e sua preparação são conhecidos, por exemplo, de WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 e WO 90/13651.

A toxina contida nas plantas transgênicas confere às plantas tolerância a insetos nocivos. Tais insetos podem ocorrer em qualquer grupo

25 taxonômico de insetos, porém são especialmente comumente encontradas em besouros (*Coleoptera*), insetos de duas asas (*Diptera*) e borboletas (*Lepidoptera*).

Plantas transgênicas contendo um ou mais genes que codificam para uma resistência inseticida e expressam uma ou mais toxinas são co-

30 nhecidas e algumas delas são comercialmente disponíveis. Exemplos de tais plantas são: YieldGard® (variedade de milho que expressa uma toxina CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (variedade de milho que expressa uma

toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedade de milho que expressa uma toxina CryIA(b) e uma CryIIIB(b1)); Starlink® (variedade de milho que expressa uma toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedade de milho que expressa uma toxina CryIF(a2) e a enzima fosfotricina N-acetiltransferase (PAT) para obter tolerância à herbicida de amônio de glifosinato); NuCOTN 33B® (variedade de algodão que expressa uma toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedade de algodão que expressa uma toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedade de algodão que expressa uma toxina CryIA(c) e uma CryIIA(b)); VIPCOT® (variedade de algodão que expressa uma toxina VIP); NewLeaf® (variedade de batata que expressa uma toxina CryIIIA); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21 característica tolerante a glifosato), Agrisure® CB Advantage (Bt11 característica de broca de milho (CB)) e Protecta®.

Outros exemplos de tais colheitas transgênicas são:

1. **Milho Bt11** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, França, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* geneticamente modificadas que foram tornadas resistentes ao ataque pela broca de milho Europeu (*Ostrinia nubilalis* e *Sesamia nonagrioides*) por expressão transgênica de uma toxina CryIA(b) truncado. Milho Bt11 também expressa transgenicamente a enzima PAT para obter tolerância ao herbicida de amônio de glicosinato.

2. **Milho Bt176** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, França, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* geneticamente modificadas que foram tornadas resistentes ao ataque pela broca de milho Europeu (*Ostrinia nubilalis* e *Sesamia nonagrioides*) por expressão transgênica de uma toxina CryIA(b). Milho Bt176 também expressa transgenicamente a enzima PAT para obter tolerância à herbicida de amônio de glifosinato.

3. **Milho MIR604** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, França, número de registro C/FR/96/05/10. O milho que foi tornado resistente a inseto por expressão transgênica de uma toxina CryIIIA modificada. Esta toxina é Cry3A055 modificada por inserção de uma sequência de conhecimento de catepsina-D-protease. A preparação

de tais plantas de milho transgênicos é descrita em WO 03/018810.

4. **Milho MON 863** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belga, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expressa uma toxina CryIIIB(b1) e tem resistência a certos insetos *Coleoptera*.

5. **Algodão IPC 531** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belga, número de registro C/ES/96/02.

6. **Milho 1507** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belga, número de registro C/NL/00/10. Milho geneticamente modificado pela expressão da proteína Cry1F para obter a resistência a certos insetos *Lepidoptera* e da proteína PAT para obter tolerância à herbicida de amônio de glifosinato.

7. **Milho NK603 x MON 810** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belga, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste em variedades de milho híbrido convencionalmente desenvolvidas por cruzamento das variedades geneticamente modificadas NK603 e MON 810. Milho NK603 x MON 810 expressa transgenicamente a proteína CP4 EPSPS, obtida de *Agrobacterium sp.* linhagem CP4, que confere tolerância à herbicida Roundup® (contém glifosato), e também uma toxina CryIA(b) obtida de *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* que realizam tolerância a certo *Lepidoptera*, incluem broca de milho Europeu.

Colheitas transgênicas de plantas resistentes a insetos são também descritas em BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Suíça) Report 2003, (<http://bats.ch>).

O termo "colheitas" deve ser entendido como incluindo também plantas de colheitas que foram assim transformadas pelo uso de técnicas de DNA recombinantes que são capazes de sintetizar substâncias antipatogênicas tendo uma seleção seletiva, tal como, por exemplo, as proteínas assim chamadas "proteínas relacionadas com patogênese" (PRPs, vide por exemplo, EP-A-0 392 225). Exemplos de tais substâncias e plantas transgênicas capazes de sintetizar tais substâncias são conhecidas, por exemplo,

de EP-A-0 392 225, WO 95/33818, e EP-A-0 353 191. Os métodos de produção de tais plantas transgênicas são geralmente conhecidos pela pessoa versada na técnica e são descritos, por exemplo, nas publicações acima mencionadas.

- 5 Substâncias antipatogênicas que podem ser expressas por tais plantas transgênicas incluem, por exemplo, bloqueadores de canais de íon, tal como bloqueadores de canais de sódio e cálcio, por exemplo, as toxinas virais KP1, KP4 ou KP6; estilbeno sintase; bibenzil sintases; chitinases; glucanases; as assim chamadas "proteínas relacionadas com patogênese"
- 10 (PRPs; vide, por exemplo, EP-A-0 392 225); substâncias antipatogênicas produzidas por microorganismos, por exemplo, antibióticos de peptídeo ou antibióticos heterocíclicos (vide, por exemplo, WO 95/33818) ou fatores de proteína ou polipeptídeos envolvidos em defesa de patógeno de planta (assim chamados "genes de resistência de doença de planta", como descrito
- 15 em WO 03/000906).

Outras áreas de uso dos compostos de acordo com a invenção são a proteção de mercadorias armazenadas e depósitos e a proteção de materiais brutos, tal como madeira, têxteis, revestimento de pisos ou construções, e também no setor de higiene, especialmente a proteção de seres

20 humanos, animais domésticos e criação produtiva contra peste do tipo mencionado.

No setor de higiene, os compostos de acordo com a invenção são ativos contra ectoparasitas tal como carrapatos duros, carrapatos macios, ácaros de sarna, ácaros silvestre, moscas (mordendo e lambendo), larvas de moscas parasíticas, piolhos, piolhos de cabelo, piolhos de pássaros e

25 pulgas.

Exemplos de tais parasitas são:

Da ordem Anoplurida: *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.* e *Phtirus spp.*, *Solenopotes spp.*.

30 Da ordem Mallophagida: *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.* e *Felicola spp.*.

Da ordem Diptera e as subordens *Nematocerina* e *Brachycerina*, por exemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atilotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philopomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp. e *Melophagus* spp..

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

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

15 Da ordem Blattaria, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica* e *Supella* spp..

Da subclasse Acaria (Acarida) e as ordens Meta- e Mesostigmata, por exemplo, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp.,
20 *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. and *Varroa* spp..

Das ordens Actiniedida (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.,
25 *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. and *Laminosioptes* spp..

Os compostos de acordo com a invenção são também adequados para proteger contra infestação de inseto no caso de materiais tais como madeira, têxteis, plásticos, adesivos, colas, pinturas, papel e cartão, couro, revestimentos de piso e construções.

A invenção, portanto, também refere-se a composições pesti-

das tais como concentrados emulsificáveis, concentrados de suspensão, soluções diretamente vaporizáveis ou diluíveis, pastas dissemináveis, emulsões diluídas, pós solúveis, pós dispersíveis, pós umectáveis, polvilhos, grânulos ou encapsulações em substâncias poliméricas, que compreendem –
5 pelo menos – um dos ingredientes ativos de acordo com a invenção e que deve ser selecionado pra ajustar-se aos objetivos pretendidos e as circunstâncias predominantes.

Nestas composições, o ingrediente ativo é empregado na forma pura, um ingrediente ativo sólido, por exemplo, em um tamanho de partícula
10 específico, ou, preferivelmente, juntamente com – pelo menos – um dos auxiliares convencionalmente usados na técnica de formulação, tal como extensores, por exemplo, solventes ou veículos sólidos, ou tais como compostos tensoativos (surfactantes).

Exemplos de solventes adequados são: hidrocarbonetos aromáticos não hidrogenados ou parcialmente hidrogenados, preferivelmente as
15 frações C₈ a C₁₂ de alquilbenzenos, tal como misturas de xileno, naftalenos alquilados ou tetraidronaftaleno, hidrocarbonetos alifáticos ou cicloalifáticos, tais como parafinas ou cicloexano, álcoois tais como etanol, propanol ou butanol, glicóis e seus éteres e ésteres tais como propileno glicol, éter dipropileno glicol, etileno glicol ou éter monometila de etileno glicol ou éter mono-
20 etila de etileno glicol, cetonas, tal como cicloexanona, isoforona ou álcool de diacetona, solventes fortemente polares, tais como N-metilpirrolid-2-ona, sulfóxido de dimetila ou N,N-dimetilformamida, água, óleos vegetais não epoxidados ou epoxidados, tais como óleos não epoxidados ou epoxidados,
25 de rícino, coco ou soja, e óleos de silicone.

Os veículos sólidos que são usados, por exemplo, para polvilhos e pós dispersíveis são, como uma regra, minerais naturais moídos tais como calcita, talco, caulim, montmorilonita ou atapulgita. Para melhorar as propriedades físicas, é também possível adicionar sílicas altamente dispersas ou
30 polímeros absorptivos altamente dispersos. Os veículos adsorptivos particulares adequados para grânulos são tipos porosos, tais como pomes, areia para tijolo, sepiolita ou bentonita, e materiais veículos não-sorptivos adequados

são calcita ou areia. Além disso, um grande número de materiais granulados de natureza inorgânica ou orgânica pode ser usado, em particular dolomita ou resíduos de planta fragmentados.

Os compostos tensoativos adequados são, dependendo do tipo
5 do ingrediente ativo a ser formulado, tensoativos não-iônicos, catiônicos e/ou aniônicos ou misturas tensoativas que têm boas propriedades de emulsificação, dispersão e umectação. Os tensoativos mencionados abaixo devem apenas ser considerados como exemplos; um grande número de outros tensoativos que são convencionalmente usados na técnica de formulação e
10 adequados de acordo com a invenção são descritos na literatura pertinente.

Os tensoativos não-iônicos adequados são, especialmente, derivados de éter de poliglicol de álcoois alifáticos ou cicloalifáticos, de ácidos graxos saturados ou insaturados ou de alquil fenóis que podem conter aproximadamente 3 a aproximadamente 30 grupos de éter de glicol e aproxima-
15 damente 8 a aproximadamente 20 átomos de carbono no radical de hidrocarboneto (ciclo)alifático ou aproximadamente 6 a aproximadamente 18 átomos de carbono na porção de alquila dos alquil fenóis. Também adequados são os aduzidos de óxido de polietileno solúveis em água com polipropileno glicol, etilenodiaminopolipropileno glicol ou alquil polipropileno glicol
20 tendo 1 a aproximadamente 10 átomos de carbono na cadeia de alquila e aproximadamente 20 a aproximadamente 250 grupos de éter de etileno glicol e aproximadamente 10 a aproximadamente 100 grupos éter de propileno glicol. Normalmente, os compostos acima mencionados contêm 1 a aproximadamente 5 unidades de etileno glicol por unidade de propileno glicol. Ex-
25emplos que podem ser mencionados são nonilfenoxipolietoxietanol, éter de poliglicol de óleo de rícino, aduzidos de óxido de polietileno / polipropileno glicol, tributilfenoxipolietoxietanol, polietileno glicol ou octilfenoxipolietoxietanol. São também adequados os ésteres de ácido graxo de polioxietileno de sorbitano, tal como trioleato de polioxietileno de sorbitano.

30 Os tensoativos catiônicos são, especialmente, sais de amônio quaternários que geralmente têm pelo menos um radical de alquila de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C como substituintes e

como outros substituintes (não halogenados ou halogenados) radicais de benzila ou hidroxialquila ou alquila inferior. Os sais são preferivelmente na forma de haletos, metilsulfatos ou etilsulfatos. Exemplos são cloreto de esteariltrimetilamônio e brometo de benzilbis(2-cloroetil)etilamônio.

- 5 Exemplos de tensoativos aniônicos adequados são sabões solúveis em água ou compostos tensoativos sintéticos solúveis em água. Exemplos de sabões adequados são os sais de álcali, alcalino-terroso ou (não substituídos ou substituídos) amônio de ácidos graxos tendo aproximadamente 10 a aproximadamente 22 átomos de C, tal como os sais de sódio ou
- 10 potássio de ácido oléico ou esteárico, ou de misturas de ácido graxos naturais que são obteníveis, por exemplo, de coco ou óleo de "tall"; menção deve também ser feita dos tauratos de metila de ácido graxo. Entretanto, os tensoativos sintéticos são usados mais freqüentemente, em particular sulfonatos graxos, sulfatos graxos, derivados de benzimidazol sulfonato ou sulfonatos de alquilarila. Como uma norma, os sulfonatos graxos e sulfatos graxos estão presentes como sais de álcali, alcalino-terroso ou (substituídos ou não substituídos amônio e eles geralmente têm um radical de alquila de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C, alquila também deve ser entendida como incluindo a porção de alquila de radicais de acila;
- 15 exemplos que podem ser mencionados são os sais de sódio e potássio de ácido lignossulfônico, do éster dodecilsulfúrico ou de uma mistura de sulfato de álcool graxo preparada de ácidos graxos naturais. Este grupo também inclui os sais dos ésteres sulfúricos e ácidos sulfônicos de aduzidos de óxido de álcool/etileno graxo. Os derivados de benzimidazol sulfonados preferi-
- 20 velmente contêm 2 grupos sulfonila e um radical de ácido graxo de aproximadamente 8 a aproximadamente 22 átomos de C. Exemplos de alquilartil-sulfonatos são os sais de sódio, cálcio, ou trietanolamônio de ácido decil-benzenossulfônico, de ácido dibutilnaftalenossulfônico ou de um condensado de ácido naftalenossulfônico/formaldeído. São também possíveis, além
- 25 disso, fosfatos adequados, tal como sais do éter fosfórico de um aduzido de
- 30 óxido de p-noniifenol/(4-14), ou fosfolipídeos.

Como uma norma, as composições compreendem 0,1 a 99%,

- especialmente 0,1 a 95%, de ingrediente ativo e 1 a 99,9%, especialmente 5 a 99,9%, de pelo menos um adjuvante sólido ou líquido, sendo possível como uma norma para 0 a 25%, especialmente 0,1 a 20%, da composição a ser tensoativas (% em cada caso significando percentual em peso). Visto
- 5 que as composições concentradas tendem a ser preferidas para mercadorias comerciais, o consumidor final como norma usa composições diluídas que têm concentrações substancialmente baixas de ingrediente ativo. As composições preferidas são compostas em particular como segue (% = percentual por peso):

10 Concentrados emulsificáveis:

ingrediente ativo:	1 a 95%, preferivelmente 5 a 20%
tensoativo:	1 a 30%, preferivelmente 10 a 20 %
solvente:	5 a 98%, preferivelmente 70 a 85%

Polvilhos:

- 15 ingrediente ativo: 0,1 a 10%, preferivelmente 0,1 a 1%
 veículo sólido: 99,9 a 90%, preferivelmente 99,9 a 99%

Concentrados de suspensão:

ingrediente ativo:	5 a 75%, preferivelmente 10 a 50%
água:	94 a 24%, preferivelmente 88 a 30%

- 20 tensoativo: 1 a 40%, preferivelmente 2 a 30%

Pós umectáveis:

ingrediente ativo:	0,5 a 90%, preferivelmente 1 a 80%
tensoativo:	0,5 a 20%, preferivelmente 1 a 15%
veículo sólido:	5 a 99%, preferivelmente 15 a 98%

25 Grânulos:

ingrediente ativo:	0,5 a 30%, preferivelmente 3 a 15%
veículo sólido:	99,5 a 70%, preferivelmente 97 a 85%

- As composições podem também compreender auxiliares sólidos ou líquidos, tal como estabilizadores, por exemplo, óleos vegetais não epo-
- 30 xidados ou epoxidados (por exemplo óleo de coco, óleo de colza ou óleo de soja), antiespumas, por exemplo, óleo de silicone, conservantes, reguladores de viscosidade, aglutinantes e/ou aderentes, fertilizantes ou outros in-

grediente ativos para obter efeitos específicos, por exemplo, bactericidas, fungicidas, nematocidas, ativadores de planta, moluscicidas ou herbicidas.

As composições de acordo com a invenção são preparadas de uma maneira conhecida por si, na ausência de auxiliares, por exemplo, por moagem, peneiração e/ou compressão de um ingrediente ativo sólido e na presença de pelo menos um auxiliar, por exemplo, por mistura íntima e/ou moagem do ingrediente ativo com o auxiliar (auxiliares). Os processos para a preparação das composições e o uso dos compostos I, para a preparação destas composições são também um objeto da invenção.

Os métodos de aplicação para as composições, isto é, os métodos de controle de peste dos tipos acima mencionados, tal como vaporização, atomização, polvilhamento, escovação sobre, curativo, dispersão ou derramamento – que devem ser selecionados para adaptar-se aos objetivos pretendidos das circunstâncias predominantes - e o uso das composições para o controle de pestes dos tipos acima mencionados são outros objetos da invenção. Taxas típicas de concentração são entre 0,1 e 1000 ppm, preferivelmente entre 0,1 e 500 ppm, de ingrediente ativo. A taxa de aplicação por hectare é geralmente 1 a 2000 g de ingrediente ativo por hectare, em particular 10 a 1000 g/ha, preferivelmente 10 a 600 g/ha.

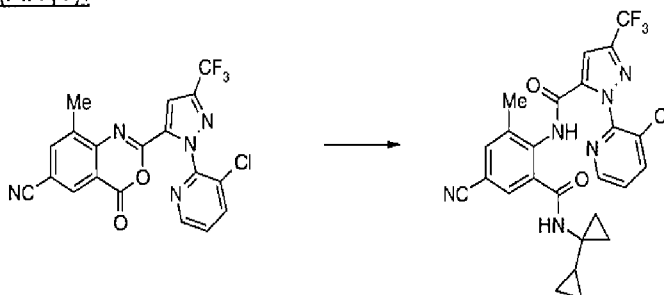
Um método preferido de aplicação no campo de proteção de colheita é a aplicação à folhagem das plantas (aplicação folhear), sendo possível selecionar frequência e taxa de aplicação para comparar o perigo de infestação com a peste em questão. Alternativamente, o ingrediente ativo pode estender-se às plantas por meio de sistema de raiz (ação sistêmica), encharcando-se o local das plantas com uma composição líquida ou incorporando-se o ingrediente ativo em forma sólida no local das plantas, por exemplo, no solo, por exemplo, na forma de grânulos (aplicação ao solo). No caso de colheitas de arroz alagado, tais grânulos podem ser medidos dentro do campo alagado por inundação.

As composições de acordo com a invenção são adequadas para a proteção de material de propagação de planta, por exemplo, sementes, tal como fruta, tubérculos ou sementes, ou plantas sementeiras, contra pestes

dos tipos acima mencionados. O material de propagação pode ser tratado com as composições antes da plantação, por exemplo, as sementes podem ser tratadas antes da semeadura. Alternativamente, as composições podem ser aplicadas às sementes semeadas (revestimento), encharcando-se as sementes em uma composições líquida ou aplicando-se uma camada de uma composições sólida. É também possível aplicar as composições quando o material de propagação é plantado no sítio de aplicação, por exemplo, dentro do sulco de semente durante a drenagem. Estes métodos de tratamento para material de propagação de planta e o material de propagação de planta, desse modo, tratado são também objetos da invenção.

Exemplos de preparação

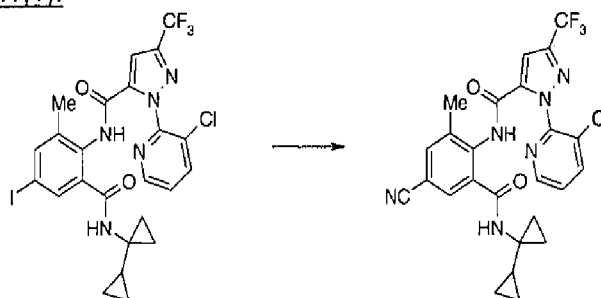
Exemplo P1: preparação de [2-(biciclopropil-1-ilcarbamoil)-4-ciano-6-metil-fenil]-amida de ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carboxílico (A.1,1):



A uma solução de 2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-8-metil-4-oxo-4H-benzo[d][1,3]oxazina-6-carbonitrila (1,2 g, 2,8 mmol) (preparado de acordo com WO 04/067528) em tetraidrofurano (40 ml), é adicionado cloridrato de biciclopropil-1-ilamina (0,6 g, 4,2 mmols) e 1,2 ml (8,4 mmols) de trietilamina, e a solução é aquecida em uma temperatura de 60°C durante 8 horas. A solução é resfriada para temperatura ambiente e o solvente é evaporado. Em seguida a mistura é triturada em 100 ml de água e os cristais são lavados com água e éter para fornecer 0,85 g do composto do título. O líquido mãe é evaporado e uma segunda safra de cristais é obtida por cristalização em disopropiléter para fornecer 0,46 g do composto do título (F: 270-272 °C).

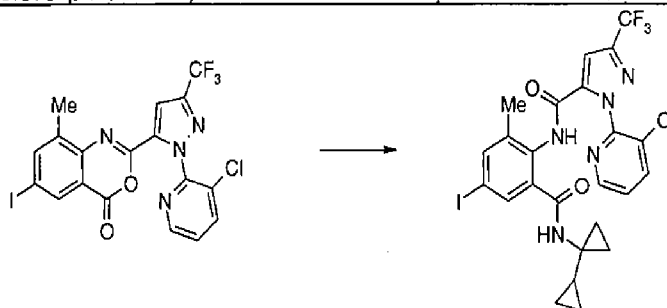
Exemplo P2: preparação de [2-(biciclopropil-1-ilcarbamoil)-4-ciano-6-metil-fenil]-amida de ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-

carboxílico (A.1,1):



A uma solução de 3,29 g (5,23 mmols) de [2-(biciclopropil-1-ilcarbamoil)-4-iodo-6-metil-fenil]-amida de ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carboxílico em 50 ml de tetraidrofurano são adicionados 1,19 g (6,25 mmols) CuI, 0,30 g de tetracis(trifenilfosfina)paládio e 2,78 g (31,0 mmols) de CuCN. A mistura é aquecida 1 hora a 80°C e torna-se verde-escura. Após resfriamento, a mistura é filtrada em Hyflo e evaporada. O resíduo é dissolvido em 15 ml de DMF e despejado em 100 ml de água contendo 5 g de NaHCO₃. Após 30 minutos agitando, os cristais são filtrados, lavados com água e uma mistura de hexano / acetona (1:3) para fornecer 2,8 g do composto do título.

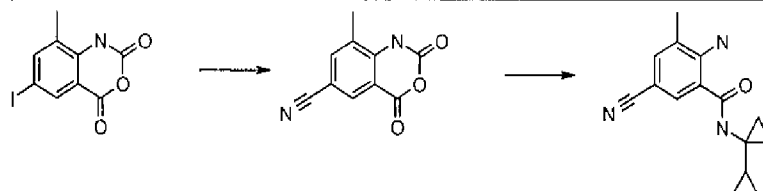
Preparação de [2-(biciclopropil-1-ilcarbamoil)-4-iodo-6-metil-fenil]-amida de ácido 2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-carboxílico.



2,08 g (3,91 mmols) de (2-[2-(3-cloro-piridin-2-il)-5-trifluorometil-2H-pirazol-3-il]-8-hidróxi-6-iodo-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona (preparado de acordo com WO 04/067528), 0,6 g (4,50 mmols) de cloridrato de biciclopropil-1-ilamina e 0,63 ml (4,50 mmol) de trietilamina em 20 ml de THF são aquecidos 20 horas ao refluxo. Após resfriamento, o precipitado é filtrado e o líquido mãe é evaporado. O resíduo é dissolvido em 5 ml de DMF e despejado em 40 ml de água. Os cristais formados são filtrados e purificados por cromatografia instantânea (diclorometano 40, dietiléter 1) para fornecer 1,85 g do composto do título.

g do composto do título. ^1H -RMN (CDCl_3 , 400 MHz, ppm): 0,11 (q, 2H), 0,45 (q, 2H), 0,62 (s, 4H), 1,4 (m, 1H), 2,10 (s, 3H), 6,50 (s, 1H), 7,40 (m, 2H), 7,51 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,85 (dd, 1H), 8,49 (m, 1H), 10,45 (s, 1H).

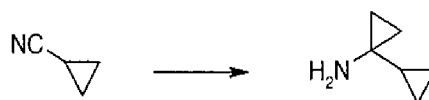
Preparação de 2-amino-N-biciclopropil-1-il-5-ciano-3-metil-benzamida



5 600 mg (1,98 mmol) de 6-iodo-8-metil-1H-benzo[d][1,3]oxazina-2,4-diona (preparado de acordo com procedimentos conhecidos, vide G. M. Coppola, *Synthesis*, **1980**, 505), 212 mg (2,37 mmols) de CuCN, 377 mg (1,98 mmol) de CuI e 114 mg de tetracis(trifenilfosfina)paládio em 60 ml de THF são aquecidos 5 horas ao refluxo. Após resfriamento, a mistura é filtra-
10 da em Hyflo. A fase orgânica é lavada com água e evaporada. O resíduo é cristalizado de uma mistura de diclorometano, acetato de etila e hexano para fornecer 245 mg de 8-metil-2,4-dioxo-1,4-diidro-2H-benzo[d][1,3]oxazina-6-carbonitrila, a qual é diretamente usada na seguinte etapa.

236 mg (1,16 mmol) de 8-metil-2,4-dioxo-1,4-diidro-2H-benzo[d][1,3]oxazina-6-carbonitrila, 234 mg (1,75 mmol) de cloridrato de bi-
15 ciclopropil-1-ilamina e 177 mg (1,75 mmol) de trietilamina em 25 ml de THF são aquecidos 4 horas ao refluxo. A mistura é resfriada e evaporada. O resíduo é dissolvido em acetato de etila e extraído com água. Após purificação em uma trilha curta de sílica-gel, 63 mg do composto do título são isolados
20 como cristais amarelos. F: 171 - 172°C.

Preparação de biciclopropil-1-ilamina:



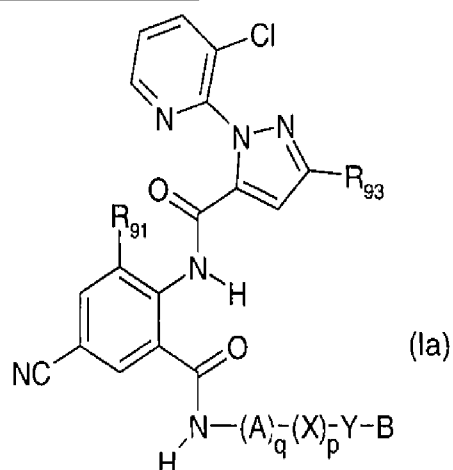
93,2 ml (328 mmols) de $\text{Ti}(\text{OiPr})_4$ são adicionados a uma solu-
ção de 20 g (298 mmols) de carbonitrila de ciclopropano em 300 ml de éter. Em seguida a solução é resfriada para -78°C e 199 ml (596 mmols) de so-
25 lução de brometo de etilmagnésio (3 M em éter) são lentamente adiciona-
dos. Após 10 minutos a -78°C , a poupa é deixada aquecer para temperatu-

ra ambiente e agitada durante 1 hora. Em seguida 84,6 g (595 mmols) de $\text{BF}_3 \cdot \text{OEt}_2$ são adicionados e a mistura é agitada em temperatura ambiente durante 18 horas. A esta mistura, 600 ml de 2N de NaOH são lentamente adicionados em uma temperatura de 0 °C. A fase orgânica é separada e
 5 extraída com 600 ml de 2N de HCl. A fase de água é evaporada e o resíduo é triturado em éter para fornecer 30,9 g do composto do título como um sal de cloridrato.

Os exemplos que seguem são entendidos para ilustrar a invenção e mostram compostos preferidos de fórmula I. Me significa o grupo de metila. Et significa o grupo de etila. Se nenhuma definição para o substituinte X é fornecida, em seguida p é 0, se X é um substituinte, em seguida p é 1. Se nenhuma definição para o substituinte A é fornecida, em seguida q é 0, se A é um substituinte, em seguida q é 1. O grupo $\text{C}(\text{CH}_2\text{CH}_2)$ para o substituinte Y significa ciclopropila com duas valências livres:



15 Tabela A: Compostos de fórmula Ia:



Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,1	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,2	Cl	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,3	Br	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,4	Me	Cl	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,5	Cl	Cl	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila

Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,6	Br	Cl	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,7	Me	Br	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,8	Cl	Br	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,9	Br	Br	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,10	Me	OCHF ₂	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,11	Cl	OCHF ₂	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,12	Br	OCHF ₂	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,13	Me	OCH ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,14	Cl	OCH ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,15	Br	OCH ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,16	Me	CHF ₂	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,17	Cl	CHF ₂	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,18	Br	CHF ₂	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,19	Me	CH ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,20	Cl	CH ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,21	Br	CH ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,22	Me	CF ₃	-	-	CH(ciclo- propila)	ciclopropila
A.1,23	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,24	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CHF)	ciclopropila
A.1,25	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CF ₂)	ciclopropila
A.1,26	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CHCl)	ciclopropila
A.1,27	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CFCl)	ciclopropila
A.1,28	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CCl ₂)	ciclopropila
A.1,29	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CHBr)	ciclopropila
A.1,30	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CBr ₂)	ciclopropila
A.1,31	Me	CF ₃	C(CH ₂ CHMe)	-	C(CH ₂ CHMe)	ciclopropila
A.1,32	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CMe ₂)	ciclopropila
A.1,33	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CHEt)	ciclopropila
A.1,34	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CEt ₂)	ciclopropila
A.1,35	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ OCH ₂)	ciclopropila
A.1,36	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ S(O) ₂ - CH ₂)	ciclopropila
A.1,37	Me	CF ₃	C(CH ₂ CH ₂)	O	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,38	Me	CF ₃	CH ₂	CH ₂	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila

Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,39	Me	CF ₃	CH ₂	O	CH-(ciclo- propila)	ciclopropila
A.1,40	Me	CF ₃	CH ₂	O	CH(CH ₂ S- (O) ₂ Me)	ciclopropila
A.1,41	Me	CF ₃	CH ₂	O	CH(CH ₂ O- Me)	ciclopropila
A.1,42	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,43	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CHF)	ciclopropila
A.1,44	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CF ₂)	ciclopropila
A.1,45	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CHCl)	ciclopropila
A.1,46	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CFCl)	ciclopropila
A.1,47	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CCl ₂)	ciclopropila
A.1,48	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CHBr)	ciclopropila
A.1,49	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CBr ₂)	ciclopropila
A.1,50	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CHMe)	ciclopropila
A.1,51	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CMe ₂)	ciclopropila
A.1,52	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ CHEt)	ciclopropila
A.1,53	Me	CF ₃	CH ₂	O	C(CH ₂ C-Et ₂)	ciclopropila
A.1,54	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-flúor- ciclopropila
A.1,55	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-cloro- ciclopropila
A.1,56	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-bromo- ciclopropila
A.1,57	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-metil-- ciclopropila
A.1,58	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-etil- ciclopropila
A.1,59	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-ciano- ciclopropila
A.1,60	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-metil-- tiociclopro- pila
A.1,61	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-metóxi- ciclopropila
A.1,62	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-hidróxi- ciclopropila

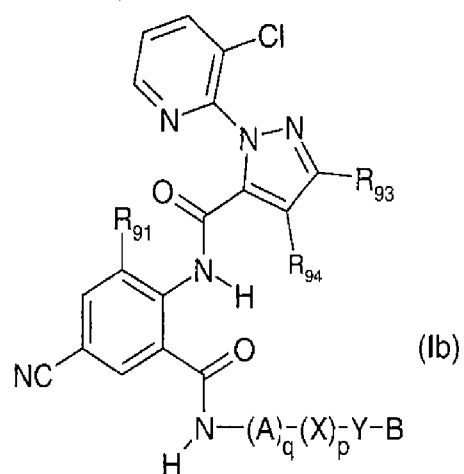
Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,63	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-triflúor- metil- ciclopropila
A.1,64	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-flúor- ciclopropila
A.1,65	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-diflúor- ciclopropila
A.1,66	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro- ciclopropila
A.1,67	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dicloro- ciclopropila
A.1,68	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-bromo- ciclopropila
A.1,69	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2- dibromo- ciclopropila
A.1,70	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro-2- flúor- ciclopropila
A.1,71	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil- ciclopropila
A.1,72	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dimetil- ciclopropila
A.1,73	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-etil- ciclopropila
A.1,74	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dietil- ciclopropila
A.1,75	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-ciano- ciclopropila
A.1,76	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil- tiociclopro- pila
A.1,77	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-metóxi- ciclopropila
A.1,78	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-hidróxi- ciclopropila
A.1,79	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-triflúor- metil- ciclopropila

Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,80	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclobutila
A.1,81	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-flúor- ciclobutila
A.1,82	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-diflúor- ciclobutila
A.1,83	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro- ciclobutila
A.1,84	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dicloro- ciclobutila
A.1,85	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-bromo- ciclobutila
A.1,86	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2- dibromo- ciclobutila
A.1,87	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro-2- flúor- ciclobutila
A.1,88	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil- ciclobutila
A.1,89	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dimetil- ciclobutila
A.1,90	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-etil- ciclobutila
A.1,91	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dietil- ciclobutila
A.1,92	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-ciano- ciclobutila
A.1,93	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil- tiociclobuti- la
A.1,94	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-metóxi- ciclobutila
A.1,95	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-hidróxi- ciclobutila
A.1,96	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	2-triflúor- metil- ciclobutila
A.1,97	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	3-metil- ciclobutila

Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,98	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	3,3-dimetil- -ciclobutila
A.1,99	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	3-cloro- ciclobutila
A.1,100	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	3,3-dicloro- ciclobutila
A.1,101	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ O)
A.1,102	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH- MeO)
A.1,103	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(C- Me ₂ O)
A.1,104	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ S)
A.1,105	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ OC H ₂)
A.1,106	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CHMe OCH ₂)
A.1,107	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CMe ₂ O CH ₂)
A.1,108	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ - S(O) ₂ CH ₂)
A.1,109	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CHMe S(O) ₂ CH ₂)
A.1,110	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CMe ₂ S(O) ₂ CH ₂)
A.1,111	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CH ₂ O)
A.1,112	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CHMeO)
A.1,113	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CMe ₂ O)
A.1,114	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CH ₂ S)
A.1,115	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CH ₂ OCH ₂)
A.1,116	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CHMeO- CH ₂)
A.1,117	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(C- Me ₂ OCH ₂)

Comp. n°	R ₉₁	R ₉₃	A	X	Y	B
A.1,118	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CH ₂ S(O) ₂ CH ₂)
A.1,119	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CH- MeS(O) ₂ C H ₂)
A.1,120	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	CMe(C- Me ₂ S(O) ₂ C H ₂)
A.1,121	Me	CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	1-(COOEt)- ciclo- propila
A.1,122	Me	SMe	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,123	Cl	SMe	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,124	Br	SMe	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,125	Me	SOMe	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,126	Cl	SOMe	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,127	Br	SOMe	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,128	Me	SO ₂ Me	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,129	Cl	SO ₂ Me	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,130	Br	SO ₂ Me	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,131	Me	OCF ₂ - CFHCF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,132	Cl	OCF ₂ - CFHCF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,133	Br	OCF ₂ - CFHCF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,134	Me	O- CH ₂ CF ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,135	Cl	O- CH ₂ CF ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila
A.1,136	Br	O- CH ₂ CF ₂ CF ₃	-	-	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila

Tabela B: Compostos de fórmula Ib:



Comp. No.	R ₉₁	R ₉₃	R ₉₄	A	X	Y	B
B.1,1	Me	CF ₃	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,2	Cl	CF ₃	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,3	Br	CF ₃	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,4	Me	Cl	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,5	Cl	Cl	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,6	Br	Cl	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,7	Me	Br	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,8	Cl	Br	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,9	Br	Br	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,10	Me	CF ₃	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,11	Cl	CF ₃	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,12	Br	CF ₃	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,13	Me	Cl	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila

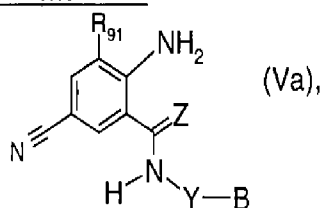
Comp. No.	R ₉₁	R ₉₃	R ₉₄	A	X	Y	B
B.1,14	Cl	Cl	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,15	Br	Cl	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,16	Me	Br	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,17	Cl	Br	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,18	Br	Br	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,19	Me	CF ₃	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,20	Cl	CF ₃	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,21	Br	CF ₃	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,22	Me	Cl	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,23	Cl	Cl	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,24	Br	Cl	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,25	Me	Br	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,26	Cl	Br	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,27	Br	Br	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,28	Me	OCH ₂ CF ₃	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,29	Cl	OCH ₂ CF ₃	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,30	Br	OCH ₂ CF ₃	Br	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,31	Me	OCH ₂ CF ₃	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,32	Cl	OCH ₂ CF ₃	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila

Comp. No.	R ₉₁	R ₉₃	R ₉₄	A	X	Y	B
B.1,33	Br	OCH ₂ CF ₃	Cl	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,34	Me	OCH ₂ CF ₃	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,35	Cl	OCH ₂ CF ₃	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila
B.1,36	Br	OCH ₂ CF ₃	Me	-	-	C(CH ₂ C H ₂)	ciclo- propila

Tabela C: Dados físicos dos compostos de tabela A e B:

Nenhum composto	ponto de fusão [°C]
A.1,1	270-272
A.1,13	175-178
A.1,4	249-255
A.1,7	254-260
B,1,28	169-174
A.1,122	243-244
A.1,131	170-172
A.1,134	200-205
A.1,16	250-251
A.1,72	158-160
A.1,57	247-249

Tabela D: Compostos de fórmula Va:



Comp. nº	R ₉₁	Y	B	ponto de fusão [°C]
D1	Me	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila	171-172
D2	Me	CH(ciclo-propil)	ciclopropila	
D3	Me	C(CH ₂ CHF)	ciclopropila	
D4	Me	C(CH ₂ CF ₂)	ciclopropila	
D4	Me	C(CH ₂ CHCl)	ciclopropila	
D6	Me	C(CH ₂ CFCl)	ciclopropila	

Comp. nº	R ₉₁	Y	B	ponto de fusão [°C]
D7	Me	C(CH ₂ CCl ₂)	ciclopropila	
D8	Me	C(CH ₂ CHBr)	ciclopropila	
D9	Me	C(CH ₂ CBr ₂)	ciclopropila	
D11	Me	C(CH ₂ CMe ₂)	ciclopropila	
D12	Me	C(CH ₂ CHEt)	ciclopropila	
D13	Me	C(CH ₂ CEt ₂)	ciclopropila	
D14	Me	C(CH ₂ OCH ₂)	ciclopropila	
D15	Me	C(CH ₂ S(O) ₂ -CH ₂)	ciclopropila	
D16	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-flúor-ciclopropila	
D17	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-cloro-ciclopropila	
D18	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-bromo-ciclopropila	
D19	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-metil--ciclopropila	
D20	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-etil-ciclopropila	
D21	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-ciano-ciclopropila	
D22	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-metil--tiociclopropila	
D23	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-metóxi-ciclopropila	
D24	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-hidróxi-ciclopropila	
D25	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-triflúor-metil- ciclopropila	
D26	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-flúor-ciclopropila	
D27	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-diflúor- ciclopropila	
D28	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro-ciclopropila	
D29	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dicloro- ciclopropila	
D30	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-bromo-ciclopropila	
D31	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dibromo- ciclopropila	
D32	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro-2-flúor- ciclopropila	
D33	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil-ciclopropila	
D34	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dimetil- ciclopropila	
D35	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-etil-ciclopropila	

Comp. nº	R ₉₁	Y	B	ponto de fusão [°C]
D36	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dietil-ciclopropila	
D37	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-ciano-ciclopropila	
D38	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil-tiociclopropila	
D39	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-metóxi-ciclopropila	
D40	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-hidróxi-ciclopropila	
D41	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-triflúor-metil-- ciclopropila	
D42	Me	C(CH ₂ CH ₂)	ciclobutila	
D43	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-flúor-ciclobutila	
D44	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-diflúor-ciclobutila	
D45	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro-ciclobutila	
D46	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dicloro-ciclobutila	
D47	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-bromo-ciclobutila	
D48	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dibromo- ciclobutila	
D49	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-cloro-2-flúor- ciclobutila	
D50	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil-ciclobutila	
D51	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dimetil--ciclobutila	
D52	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-etil-ciclobutila	
D53	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dietil-ciclobutila	
D54	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-ciano-ciclobutila	
D55	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-metil-tiociclobutila	
D56	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-metóxi-ciclobutila	
D57	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-hidróxi-ciclobutila	
D58	Me	C(CH ₂ CH ₂)	2-triflúor-metil- ciclobutila	
D59	Me	C(CH ₂ CH ₂)	3-metil-ciclobutila	
D60	Me	C(CH ₂ CH ₂)	3,3-dimetil--ciclobutila	
D61	Me	C(CH ₂ CH ₂)	3-cloro-ciclobutila	
D62	Me	C(CH ₂ CH ₂)	3,3-dicloro-ciclobutila	
D63	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ O)	
D64	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH-MeO)	
D65	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(C-Me ₂ O)	

Comp. nº	R ₉₁	Y	B	ponto de fusão [°C]
D66	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ S)	
D67	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ OCH ₂)	
D68	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CHMeOCH ₂)	
D69	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CMe ₂ OCH ₂)	
D70	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CH ₂ -S(O) ₂ CH ₂)	
D71	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CHMeS(O) ₂ CH ₂)	
D72	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CH(CMe ₂ S(O) ₂ CH ₂)	
D73	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CH ₂ O)	
D74	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CHMeO)	
D75	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CMe ₂ O)	
D76	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CH ₂ S)	
D77	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CH ₂ OCH ₂)	
D78	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CHMeO-CH ₂)	
D79	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(C-Me ₂ OCH ₂)	
D80	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)- (CH ₂ S(O) ₂ CH ₂)	
D81	Me	C(CH ₂ CH ₂)	C(Me)-(CH- MeS(O) ₂ CH ₂)	
D82	Me	C(CH ₂ CH ₂)	CMe(C- Me ₂ S(O) ₂ CH ₂)	
D83	Me	C(CH ₂ CH ₂)	1-(COOEt)-ciclo- propil	
D84	Cl	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila	
D85	Br	C(CH ₂ CH ₂)	ciclopropila	
D86	Cl	C(CH ₂ CH ₂)	1-metil-ciclopropila	
D87	Br	C(CH ₂ CH ₂)	1-metil-ciclopropila	
D88	Cl	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dimetil- ciclopropila	
D89	Br	C(CH ₂ CH ₂)	2,2-dimetil- ciclopropila	

Exemplos de formulação (% = percentual por peso)

<u>Exemplo F1: concentrados de emulsões</u>		a)	b)	c)
Ingredientes ativos		25 %	40 %	50 %
Benzenossulfonato de cálcio		5 %	8 %	6 %
5	Éter de polietileno glicol de óleo castor (36 mols de EO)	5 %	-	-
Éter de tributilfenoxipolietileno glicol (30 mols de EO)		-	12 %	4 %
Cicloexanona		-	15 %	20 %
10	Mistura de xileno	65 %	25 %	20 %

Emulsões de qualquer concentração desejada podem ser preparadas de tais concentrados por diluição com água.

<u>Exemplo F2: Solução</u>		a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo 80 %		10 %	5 %	95 %	
15	Éter de monometila de etileno glicol	20 %	-	-	-
Polietileno glicol MW 400		-	70 %	-	-
N-metilpirrolid-2-ona		-	20 %	-	-
Óleo de côco epoxidado		-	-	1 %	5 %
Éter de petróleo (faixa de ebulição: 160-190°)		-	-	94 %	-

20 As soluções são adequadas para uso na forma de microgotas.

<u>Exemplo F3: Grânulos</u>		a)	b)	c)	d)
Ingrediente ativo 5 %		10%	8%	21%	
Caulim		94%	-	79%	54%
Sílica altamente dispersa		1%	-	13%	7%
25	Atapulgita	-	90%	-	18%

O ingrediente ativo é dissolvido em diclorometano, a solução é vaporizada sob o(s) veículo(s), e o solvente é subsequente evaporado a vácuo.

<u>Exemplo F4: Pós</u>		a)	b)
30	Ingrediente ativo 2 %	5 %	
Sílica altamente dispersa		1 %	5 %
Talco		97 %	-

Caulim - 90 %

Os pós prontos para uso são obtidos misturando-se intimamente os veículos e o ingrediente ativo.

<u>Exemplo F5: Pós umectáveis</u>		a)	b)	c)
5	Ingrediente ativo 25 %	50 %	75 %	
	Lignossulfonato de sódio	5 %	5 %	-
	Sulfato de laurila de sódio	3 %	-	5 %
	Diisobutilnaftalenossulfonato de sódio	-	6 %	10 %
	Octilfenoxipolietileno glicol			
10	Éter (7-8 mol de EO)	-	2 %	-
	Sílica altamente dispersa	5 %	10 %	10 %
	Caulim	62 %	27 %	-

O ingrediente ativo é misturado com os aditivos e a mistura é completamente moída em um moinho adequado. Este fornece pós umectáveis que podem ser diluídos com água para fornecer suspensões de qualquer concentração desejada.

<u>Exemplo F6: Grânulos Extrusores</u>	
	Ingrediente ativo 10 %
	Lignossulfonato de sódio 2 %
20	Carboximetilcelulose 1 %
	Caulim 87 %

O ingrediente ativo é misturado com os aditivos, e a mistura é moída, umedecida com água, extrusada, granulada e secada em uma corrente de ar.

<u>Exemplo F7: Grânulos revestidos</u>	
	Ingrediente ativo 3 %
	Polietileno glicol (MW 200) 3 %
25	Caulim 94 %

Em um misturador, o ingrediente ativo moído finamente é aplicado uniformemente ao caulim, que foi umedecido com o polietileno glicol. Este fornece grânulos revestidos de pó livre.

Exemplo F8: Concentrado de suspensão

	Ingrediente ativo	40 %
	Etileno glicol	10 %
	Éter de Nonilfenoxipolietileno glicol	
5	(15 mols de EO)	6 %
	Lignossulfonato de sódio	10 %
	Carboximetilcelulose	1 %
	37 % de solução de formaldeído aquosa	0,2 %
	Óleo de Silicone	
10	(75 % de emulsão aquosa)	0,8 %
	Água	32 %

O ingrediente ativo moído finamente é misturado intimamente com os aditivos. As suspensões com qualquer concentração desejada podem ser preparadas do concentrado de suspensão assim resultante por diluição com éter.

A atividade dos compostos de acordo com a invenção pode ser ampliada consideravelmente, e adaptada para predominar circunstâncias, adicionando-se inseticidamente ou acaricidamente ingredientes ativos. As adições adequadas para ingredientes ativos aqui são, por exemplo, representantes das seguintes classes de ingredientes ativos: compostos organofosforosos, derivados de nitrofenol, tiouréias, hormônios juvenis, formamidas, derivados de benzofenona, uréias, derivados de pirrol, carbamatos, piretróides, hidrocarbonetos clorados, aciluréias, derivados de piridilmetilenoamino, macrolídeos, neonicotinóides e preparações de *Bacillus thuringiensis*.

As seguintes misturas dos compostos de fórmula I com ingredientes ativos são preparadas (a abreviação "TX" significa "um composto selecionado do grupo consistindo em compostos especialmente descritos nas tabelas A e B da presente invenção"):

um adjuvante do grupo de substâncias consistindo em óleos de petróleo (nome alternativo) (628) + TX,

um acaricida selecionada do grupo de substâncias consistindo

em 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nome de IUPAC) (910) + TX, benzenossulfonato de 2,4-diclorofenila (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-flúor-*N*-metil-*N*-1-naftilacetamida (nome de IUPAC) (1295) + TX, sulfona de fenila de 4-clorofenila (nome de IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocila (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarbo (16) + TX, aldoxicarbo (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amidition (870) + TX, amidoflumeto [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amiton (875) + TX, oxilato de hidrogênio de amiton (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramito (881) + TX, óxido arsenoso (882) + TX, AVI 382 (código de composto) + TX, AZ 60541 (código de composto) + TX, azinfos-etila (44) + TX, azinfos-metila (45) + TX, azobenzeno (nome de IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomila (62) + TX, benoxáfós (nome alternativo) [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de benzila (nome de IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifenitrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato (nome alternativo) + TX, bromocileno (918) + TX, bromófos (920) + TX, bromófos-etila (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxima (103) + TX, butoxicarboxima (104) + TX, butilpiridabeno (nome alternativo) + TX, polissulfeto de cálcio (nome de IUPAC) (111) + TX, canfecloro (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarila (115) + TX, carbofurano (118) + TX, carbofenotion (947) + TX, CGA 50'439 (código de desenvolvimento) (125) + TX, cinometionato (126) + TX, clorbenzida (959) + TX, clordimefórmio (964) + TX, cloridrato de clormefórmio (964) + TX, clorfenápiro (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfenson (970) + TX, clorfensulfeto (971) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorobenzilato (975) + TX, cloromebufórmio (977) + TX, clorometiuron (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, clorpirifos (145) + TX, clorpirifos-metila (146) + TX, clortiófos (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezina (158) + TX, closantel (nome alternativo) [CCN] + TX, coumafos (174) + TX, crotamiton (nome alternativo) [CCN] + TX, crotoxfos (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (CAS Reg. No.: 400882-07-7) + TX, cialotrina (196) + TX, ciexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefion

(1037) + TX, demefion-O (1037) + TX, demefion-S (1037) + TX, demeton (1038) + TX, demeton-metila (224) + TX, demeton-O (1038) + TX, demeton-O-metila (224) + TX, demeton-S (1038) + TX, demeton-S-metila (224) + TX, demeton-S-metilsulfono (1039) + TX, diafentiuron (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diazinon (227) + TX, diclofluanid (230) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos (nome alternativo) + TX, dicofol (242) + TX, dicrotófos (243) + TX, dienclor (1071) + TX, dimefóx (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nome alternativo) (653) + TX, dinéx (1089) + TX, dinéx-diclexina (1089) + TX, dinobuton (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinocion (1090) + TX, dinopenton (1092) + TX, dinossulfon (1097) + TX, dinoterbon (1098) + TX, dioxation (1102) + TX, sulfona de difenila (nome de IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (nome alternativo) [CCN] + TX, disulfoton (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapin (1113) + TX, doramectina (nome alternativo) [CCN] + TX, endossulfano (294) + TX, endotion (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina (nome alternativo) [CCN] + TX, etion (309) + TX, etoato-metila (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfos (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquino (328) + TX, óxido de fenbutatin (330) + TX, fenotiocarbo (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nome alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fenson (1157) + TX, fentrifanila (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronila (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluazuron (1166) + TX, flubenzimina (1167) + TX, flucicloxuron (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetila (1169) + TX, flufenoxuron (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbenzida (1174) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desenvolvimento) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, cloridrato de formetanato (405) + TX, formotion (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenpróx (424) + TX, heptenófos (432) + TX, ciclopropanecarboxilato de hexadecila (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazóx (441) + TX, iodometano (nome de IUPAC) (542) + TX, isocarbófos (nome alternativo) (473) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropila (nome de IUPAC) (473) + TX, ivermectina (nome alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, linda-

no (430) + TX, lufenuron (490) + TX, malation (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolan (1261) + TX, mesulfeno (nome alternativo) [CCN] + TX, metacrífos (1266) + TX, metamidófos (527) + TX, metidation (529) + TX, metiocarbo (530) + TX, metomila (531) + TX, 5 brometo de metila (537) + TX, metolcarbo (550) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nome alternativo) [CCN] + TX, mipafóx (1293) + TX, monocrotófos (561) + TX, morfotion (1300) + TX, moxidectina (nome alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de composto) + TX, NC-512 (código de 10 composto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nicomicinas (nome alternativo) [CCN] + TX, nitrilacarbo (1313) + TX, nitrilacarbo 1:1 complexo de cloreto de zinco (1313) + TX, NNI-0101 (código de composto) + TX, NNI-0250 (código de composto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamila (602) + TX, oxideprófos (1324) + TX, oxidissulfoton (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paration (615) 15 + TX, permetrina (626) + TX, óleos de petróleo (nome alternativo) (628) + TX, fencapton (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalonga (637) + TX, fosfolan (1338) + TX, fosmeto (638) + TX, fosfamidon (639) + TX, foxima (642) + TX, pirimifos-metila (652) + TX, policloroterpenos (nome tradicional) (1347) + TX, polinactinas (nome alternativo) (653) + TX, proclo- 20 nol (1350) + TX, profenófos (662) + TX, promacila (1354) + TX, propargito (671) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxúro (678) + TX, protidation (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridafention (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfos (711) + TX, quintió- 25 fos (1381) + TX, R-1492 (código de desenvolvimento) (1382) + TX, RA-17 (código de desenvolvimento) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, sscradan (1389) + TX, sebufos (nome alternativo) + TX, selamectina (nome alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de composto) + TX, sofamida (1402) + TX, spirodiclofeno (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desenvolvimento) (1404) + TX, sulfiram (nome alternativo) [CCN] + TX, sul- 30 fluramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, enxofre (754) + TX, SZI-121 (código de desenvolvimento) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad

- (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nome alternativo) + TX, tetraclorvinfos (777) + TX, tetradifon (786) + TX, tetranactina (nome alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenóx (nome alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanóx (800) + TX, tiometon (801) + TX, tioquinóx (1436) + TX, turingienisina (nome alternativo) [CCN] + TX, triamifos (1441) + TX, triaratenos (1443) + TX, triazófos (820) + TX, triazuron (nome alternativo) + TX, triclorfon (824) + TX, trifenófos (1455) + TX, trinactina (nome alternativo) (653) + TX, vamidotion (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código de composto) + TX,
- 10 uma aglicida selecionada do grupo de substâncias consistindo em betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre (nome de IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclona (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratado [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoxalmina (714) + TX, quinonamid (1379)
- 15 + TX, simazina (730) + TX, acetato de trifeniltina (nome de IUPAC) (347) e hidróxido de trifeniltina (nome de IUPAC) (347) + TX,
- um antelmíntico selecionado do grupo de substâncias consistindo em abamectina (1) + TX, crufomato (1011) + TX, doramectina (nome alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina
- 20 (291) + TX, eprinomectina (nome alternativo) [CCN] + TX, ivermectina (nome alternativo) [CCN] + TX, oxima de milbemicina (nome alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nome alternativo) [CCN] + TX, piperazina [CCN] + TX, selamectina (nome alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) e tiofanato (1435) + TX,
- 25 uma avicida selecionada do grupo de substâncias consistindo em cloralose (127) + TX, endrina (1122) + TX, fention (346) + TX, piridin-4-amina (nome de IUPAC) (23) e stricnina (745) + TX,
- uma bactericida selecionada do grupo de substâncias consistindo em 1-hidróxi-1*H*-piridina-2-tiona (nome de IUPAC) (1222) + TX, 4-
- 30 (quinoxalin-2-ilamino)benzenossulfonamida (nome de IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nome de IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nome de IUPAC)

- (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminossulfo (1144) + TX, formaldeído (404) + TX, hidrargafeno (nome alternativo) [CCN] + TX, cassugamicina (483) + TX, hidrato de cloridrato de cassugamicina (483) + TX, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel (nome de IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilinona (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, sulfato de hidroxiquinolína de potássio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomicina (744) + TX, sesquissulfato de estreptomicina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, e tiomersal (nome alternativo) [CCN] + TX,
- 10 um agente biológico selecionado do grupo de substâncias consistindo em *Adoxophyes orana* GV (nome alternativo) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (nome alternativo) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (nome alternativo) (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (nome alternativo) (28) + TX, *Anagrus atomus* (nome alternativo) (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (nome alternativo) (33) + TX, *Aphidius colemani* (nome alternativo) (34) + TX, *Aphidoletes aphidimyza* (nome alternativo) (35) + TX, *Autographa californica* NPV (nome alternativo) (38) + TX, *Bacillus firmus* (nome alternativo) (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (nome científico) (49) + TX, *Bacillus turingiensis* Berliner (nome científico) (51) + TX, *Bacillus turingiensis* subsp. *aizawai* (nome científico) (51) + TX, *Bacillus turingiensis* subsp. *israelensis* (nome científico) (51) + TX, *Bacillus turingiensis* subsp. *japonensis* (nome científico) (51) + TX, *Bacillus turingiensis* subsp. *kurstaki* (nome científico) (51) + TX, *Bacillus turingiensis* subsp. *tenebrionis* (nome científico) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (nome alternativo) (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (nome alternativo) (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (nome alternativo) (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (nome alternativo) (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (nome alternativo) (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (nome alternativo) (212) + TX, *Diglyphus isaea* (nome alternativo) (254) + TX, *Encarsia formosa* (nome científico) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (nome alternativo) (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (nome alternativo) (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriofora* e *H. megidis* (nome alternativo) (433) + TX, *Hippodamia convergens* (nome alternativo) (442) + TX, *Leptomastix dactilopii* (nome alterna-

tivo) (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (nome alternativo) (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (nome alternativo) (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (nome alternativo) (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (nome científico) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nome científico) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV e *N. lecontei* NPV (nome alternativo) (575) + TX, *Orius* spp. (nome alternativo) (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (nome alternativo) (613) + TX, *Phytoseiulus persimilis* (nome alternativo) (644) + TX, *Spodoptera exigua* multicapsid nuclear polyhedrosis virus (nome científico) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema feltiae* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema glaseri* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (nome alternativo) (742) + TX, *Steinernema* spp. (nome alternativo) (742) + TX, *Trichogramma* spp. (nome alternativo) (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (nome alternativo) (844) e *Verticillium lecanii* (nome alternativo) (848) + TX,

um esterilizante de solo selecionado do grupo de substâncias consistindo em iodometano (nome de IUPAC) (542) e brometo de metila (537) + TX,

um quimioesterilizante selecionado do grupo de substâncias consistindo em afolato [CCN] + TX, bisazir (nome alternativo) [CCN] + TX, bus-sulfano (nome alternativo) [CCN] + TX, diflubenzuron (250) + TX, dimatif (nome alternativo) [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, metiotepa [CCN] + TX, afolato de metila [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penfluron (nome alternativo) [CCN] + TX, tepa [CCN] + TX, tioempa (nome alternativo) [CCN] + TX, tiotepa (nome alternativo) [CCN] + TX, tretamina (nome alternativo) [CCN] e uredepa (nome alternativo) [CCN] + TX,

uma feromona de inseto selecionada do grupo de substâncias consistindo em acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ila com (*E*)-dec-5-en-1-ol (nome de IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ila (nome de IUPAC)

(829) + TX, (*E*)-6-metilept-2-en-4-ol (nome de IUPAC) (541) + TX, (*E* + TX, *Z*)-tetradeca-4 + TX, acetato de 10-dien-1-ila (nome de IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ila (nome de IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nome de IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ila

5 (nome de IUPAC) (437) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-13-en-11-in-1-ila (nome de IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-ona (nome de IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-al (nome de IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (nome de IUPAC) (783) + TX, acetato de (*Z*)-tetradec-9-en-1-ila (nome de IUPAC) (784) + TX, (7*E* + TX, 9*Z*)-dodeca-7 + TX, acetato de 9-dien-1-ila

10 (nome de IUPAC) (283) + TX, (9*Z* + TX, 11*E*)-tetradeca-9 + TX, acetato de 11-dien-1-ila (nome de IUPAC) (780) + TX, (9*Z* + TX, 12*E*)-tetradeca-9 + TX, acetato de 12-dien-1-ila (nome de IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nome de IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol com 4-metilnonan-5-ona (nome de IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina (nome alternativo)

15 [CCN] + TX, brevicomina (nome alternativo) [CCN] + TX, codlure (nome alternativo) [CCN] + TX, codlemona (nome alternativo) (167) + TX, cuclure (nome alternativo) (179) + TX, disparlure (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ila (nome de IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ila (nome de IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ila (nome de IUPAC) (284) + TX, dominicalure (nome alternativo) [CCN] + TX, 4-metiloctanoato de etila (nome de IUPAC) (317) + TX, eugenol (nome alternativo) [CCN] + TX, frontalina (nome alternativo) [CCN] + TX, gossiplure (nome alternativo) (420) + TX, grandlure (421) + TX, grandlure I (nome alternativo) (421) + TX, grandlure II (nome alternativo) (421) + TX, grandlure III (nome alternativo) (421) + TX, grandlure IV (nome alternativo) (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol (nome alternativo) [CCN] + TX, ipsenol (nome alternativo) [CCN] + TX, japonilure (nome alternativo) (481) + TX, lineatina (nome alternativo) [CCN] + TX, litlure (nome alternativo) [CCN] + TX, loplure (nome alternativo) [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, ácido megatômico (nome alternativo) [CCN] + TX, metila eugenol (nome alternativo) (540) + TX, muscalure (563) + TX, octadeca-2 + TX, acetato de 13-dien-1-ila (nome de IUPAC) (588) + TX, octadeca-3 + TX, acetato de 13-dien-1-ila (nome de IUPAC)

20

25

30

(589) + TX, orfralure (nome alternativo) [CCN] + TX, orictalure (nome alternativo) (317) + TX, ostramona (nome alternativo) [CCN] + TX, siglure [CCN] + TX, sordidina (nome alternativo) (736) + TX, sulcatol (nome alternativo) [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ila (nome de IUPAC) (785) + TX,
 5 trimedlure (839) + TX, trimedlure A (nome alternativo) (839) + TX, trimedlure B₁ (nome alternativo) (839) + TX, trimedlure B₂ (nome alternativo) (839) + TX, trimedlure C (nome alternativo) (839) e trunc-cal (nome alternativo) [CCN] + TX,

um repelente de inseto selecionado do grupo de substâncias
 10 consistindo em 2-(octiltio)etanol (nome de IUPAC) (591) + TX, butopironoxila (933) + TX, butóxi(polipropileno glicol) (936) + TX, adipato de dibutila (nome de IUPAC) (1046) + TX, ftalato de dibutila (1047) + TX, succinato de dibutila (nome de IUPAC) (1048) + TX, dietiltoluamida [CCN] + TX, carbato de dime-
 15 TX, hexamida [CCN] + TX, metoquin-butila (1276) + TX, metilneodecanamida [CCN] + TX, oxamato [CCN] e picaridina [CCN] + TX,

uma inseticida selecionada do grupo de substâncias consistindo
 em 1 + TX, 1-dicloro-1-nitroetano (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1 + TX, 1-dicloro-2 + TX, 2-bis(4-etilfenil)etano (nome de IU-
 20 PAC) (1056) + TX, 1 + TX, 2-dicloropropano (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1 + TX, 2-dicloropropano com 1 + TX, 3-dicloropropeno (nome de IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, 2 + TX, 2 + TX, acetato de 2-
 25 triclora-1-(3 + TX, 4-diclorofenil)etila (nome de IUPAC) (1451) + TX, 2 + TX, fosfato de metila de 2-etilsulfiniletila de 2-diclorovinila (nome de IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1 + TX, 3-ditiolan-2-il)fenila (nome de IUPAC/ Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etila (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, 2-(4 + TX, 5-dimetil-1 + TX, metilcarbamato de 3-dioxolan-2-il)fenila (nome de IUPAC/ Chemical
 30 Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3 + TX, 5-xililóxi)etanol (nome de IUPAC) (986) + TX, fosfato de dietila de 2-clorovinila (nome de IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nome de IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1 + TX, 3-

diona (nome de IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenila (nome de IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetila (nome de IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nome de IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ila (nome de IUPAC) (1283) + TX, 4-metil(prop-2-inil)amino-3 + TX, metilcarbamato de 5-xilila (nome de IUPAC) (1285) + TX, 5 + TX, dimetilcarbamato de 5-dimetil-3-oxocicloex-1-enila (nome de IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acetato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetion (nome alternativo) [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrila (nome de IUPAC) (861) + TX, alanicarbo (15) + TX, aldicarbo (16) + TX, aldoxicarbo (863) + TX, aldrina (864) + TX, alletrina (17) + TX, alosamidina (nome alternativo) [CCN] + TX, alixicarbo (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-eccidisona (nome alternativo) [CCN] + TX, fosfeto de alumínio (640) + TX, amidition (870) + TX, amidotioato (872) + TX, aminocarbo (873) + TX, amiton (875) + TX, oxilato de hidrogênio de amiton (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina (877) + TX, atidation (883) + TX, AVI 382 (código de composto) + TX, AZ 60541 (código de composto) + TX, azadiractina (nome alternativo) (41) + TX, azametifos (42) + TX, azinfos-etila (44) + TX, azinfos-metila (45) + TX, azotoato (889) + TX, endotoxinas delta *Bacillus turingiensis* (nome alternativo) (52) + TX, hexafluorosilicato de bário (nome alternativo) [CCN] + TX, polissulfeto de bário (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desenvolvimento) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desenvolvimento) (894) + TX, bendiocarbo (58) + TX, benfuracarbo (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifenitrina (76) + TX, bioalletrina (78) + TX, isômero de S-ciclopentenila de bioletrina (nome alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, bioresmetrina (80) + TX, bis(2-cloroetil)éter (nome de IUPAC) (909) + TX, bistrifluron (83) + TX, borax (86) + TX, brofenvalerato (nome alternativo) + TX, bromfenvinfos (914) + TX, bromocileno (918) + TX, bromo-DDT (nome alternativo) [CCN] + TX, bromófos (920) + TX, bromófos-etila (921) + TX, bufencarbo (924) + TX, buprofezina (99) + TX, butacarbo (926) + TX, butatiófos (927) + TX, butocarboxima

(103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxima (104) + TX, butilpiridabeno (nome alternativo) + TX, cadusafos (109) + TX, arsenato de cálcio [CCN] + TX, cianida de cálcio (444) + TX, polissulfeto de cálcio (nome de IUPAC) (111) + TX, canfecloro (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarila (115) + TX, carbofurano (118) + TX, dissulfeto de carbono (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloreto de carbono (nome de IUPAC) (946) + TX, carbofenotion (947) + TX, carbossulfano (119) + TX, cartap (123) + TX, cloridrato de cartap (123) + TX, cevadina (nome alternativo) (725) + TX, clorbicileno (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimefórmio (964) + TX, cloridrato de clormefórmio (964) + TX, cloretoxifos (129) + TX, clorfenápiro (130) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorfluzuron (132) + TX, clorméfos (136) + TX, clorofórmio [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazófos (990) + TX, clorpirifos (145) + TX, clorpirifos-metila (146) + TX, clortiófos (994) + TX, cromafenozi-
da (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, cis-resmetrina (nome alternativo) + TX, cismetrina (80) + TX, clocitrina (nome alternativo) + TX, cloetocarbo (999) + TX, closantel (nome alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arsenato de cobre [CCN] + TX, oleao de cobre [CCN] + TX, coumafos (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamiton (nome alternativo) [CCN] + TX, crotoxifos (1010) + TX, crufomato (1011) + TX, crilito (nome alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desenvolvimento) (1012) + TX, cianofenfos (1019) + TX, cianófos (184) + TX, ciantoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + TX, ciflutrina (193) + TX, cialotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato (nome alternativo) [CCN] + TX, *d*-limoneno (nome alternativo) [CCN] + TX, *d*-tetrametrina (nome alternativo) (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofurano (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefion (1037) + TX, demefion-O (1037) + TX, demefion-S (1037) + TX, demeton (1038) + TX, demeton-metila (224) + TX, demeton-O (1038) + TX, demeton-O-metila (224) + TX, demeton-S (1038) + TX, demeton-S-metila (224) + TX, demeton-S-metilsulfono (1039) + TX, diafentiuron (226) +

TX, dialifos (1042) + TX, diamidafos (1044) + TX, diazinon (227) + TX, dicap-
 ton (1050) + TX, diclofention (1051) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos (no-
 me alternativo) + TX, dicresila (nome alternativo) [CCN] + TX, dicrotófos
 (243) + TX, diciclanila (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, fosfato de 5-
 5 metilpirazol-3-ila de dietila (nome de IUPAC) (1076) + TX, diflubenzuron
 (250) + TX, dilor (nome alternativo) [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX,
 dimefóx (1081) + TX, dimetan (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina
 (1083) + TX, dimetilvinfos (265) + TX, dimetilan (1086) + TX, dinéx (1089) +
 TX, dinéx-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) +
 10 TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurano (271) + TX, diofenolan (1099) + TX,
 dioxabenzófos (1100) + TX, dioxacarbo (1101) + TX, dioxation (1102) + TX,
 disulfoton (278) + TX, diticrófos (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina
 (nome alternativo) [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdiesterona (nome alter-
 nativo) [CCN] + TX, EI 1642 (código de desenvolvimento) (1118) + TX, e-
 15 mamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120)
 + TX, empentrina (292) + TX, endossulfano (294) + TX, endotion (1121) +
 TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano
 (1124) + TX, eprinomectina (nome alternativo) [CCN] + TX, esfenvalerato
 (302) + TX, etafos (nome alternativo) [CCN] + TX, etiofencarbo (308) + TX,
 20 etion (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metila (1134) + TX, etoprófos
 (312) + TX, formato de etila (nome de IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (nome
 alternativo) (1056) + TX, dibrometo de etileno (316) + TX, cloreto de etileno
 (nome químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenpróx (319)
 + TX, etrimfos (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfúr (323) + TX, fenamifos
 25 (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclórfos (1148) + TX, fenetacarbo
 (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitroton (335) + TX, fenobucarbo
 (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarbo (340) + TX, fenpiritrina
 (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nome alternativo) + TX,
 fensulfotion (1158) + TX, fention (346) + TX, fention-etila [CCN] + TX, fenva-
 30 lerato (349) + TX, fipronila (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamida
 (CAS. Reg. No.: 272451-65-7) + TX, flucofuron (1168) + TX, flucicloxuron
 (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetila (1169) + TX, flufenerim [CCN] +

TX, flufenoxuron (370) + TX, flufenpróx (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desenvolvimento) (1185) + TX, fonófos (1191) + TX, formetanato (405) + TX, cloridrato de formetanato (405) + TX, formotion (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilan

5 (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietan (1196) + TX, furatiocarbo (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gama-cialotrina (197) + TX, gama-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetato de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desenvolvimento) (423) + TX, halfenpróx (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, hepta-

10 clor (1211) + TX, heptenófos (432) + TX, heterófos [CCN] + TX, hexaflumuron (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnon (443) + TX, cianida de hidrogênio (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarbo (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarbo (465) + TX, iodometano (nome de IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazófos (1231) + TX,

15 isobenzano (1232) + TX, isocarbófos (nome alternativo) (473) + TX, isodrina (1235) + TX, isofenfos (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocarbo (472) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropila (nome de IUPAC) (473) + TX, isoprotiolano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxation (480) + TX, ivermectina (nome alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina

20 II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, hormona juvenil I (nome alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil II (nome alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil III (nome alternativo) [CCN] + TX, celevan (1249) + TX, kinopreno (484) + TX, lambda-cialotrina (198) + TX, arsenato de lead [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptófos (1250) + TX, lindano (430) + TX, lirimfos

25 (1251) + TX, lufenuron (490) + TX, litidation (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenila (nome de IUPAC) (1014) + TX, fosfeto de magnésio (nome de IUPAC) (640) + TX, malation (492) + TX, malonobenno (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfon (1258) + TX, menazon (1260) + TX, mefosfolan (1261) + TX, cloreto mercurioso (513) + TX, mesulfenfos

30 (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-potássio (nome alternativo) (519) + TX, metam-sódio (519) + TX, metacrífos (1266) + TX, metamidófos (527) + TX, fluoreto de metanossulfonila (nome

de IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidation (529) + TX, metiocarbo (530) + TX, metocrotófos (1273) + TX, metomila (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquin-butila (1276) + TX, metotrina (nome alternativo) (533) + TX, metoxiclor (534) + TX, metoxifenoza (535) + TX, brometo de metila (537) + TX, isotiocianato de metila (543) + TX, metilclorofórmio (nome alternativo) [CCN] + TX, cloreto de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarbo (550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nome alternativo) [CCN] + TX, mipafóx (1293) + TX, miréx (1294) + TX, monocrotófos (561) + TX, morfotio (1300) + TX, moxidectina (nome alternativo) [CCN] + TX, naftalofofos (nome alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desenvolvimento) (1306) + TX, NC-184 (código de composto) + TX, nicotina (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilacarbo (1313) + TX, nitrilacarbo 1:1 complexo de cloreto de zinco (1313) + TX, NNI-0101 (código de composto) + TX, NNI-0250 (código de composto) + TX, nor nicotina (nome tradicional) (1319) + TX, novaluron (585) + TX, noviflumuron (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-etila de *O*-5-dicloro-4-iodofenila (nome de IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-chromen-7-ila de *O,O*-dietila (nome de IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ila de *O,O*-dietila (nome de IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O,O,O',O'*-tetrapropila (nome de IUPAC) (1424) + TX, ácido oléico (nome de IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamila (602) + TX, oxidemeton-metila (609) + TX, oxideprófos (1324) + TX, oxidissulfotio (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-diclorobenzeno [CCN] + TX, paration (615) + TX, paration-metila (616) + TX, penfluron (nome alternativo) [CCN] + TX, pentaclorofenol (623) + TX, laurato de pentaclorofenila (nome de IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, óleos de petróleo (nome alternativo) (628) + TX, PH 60-38 (código de desenvolvimento) (1328) + TX, fencapton (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosadona (637) + TX, fosfolan (1338) + TX, fosmeto (638) + TX, fosniclor

(1339) + TX, fosfamidon (639) + TX, fosfina (nome de IUPAC) (640) + TX, foxima (642) + TX, foxim-metila (1340) + TX, pirimetafos (1344) + TX, pirimicarbo (651) + TX, pirimifos-etila (1345) + TX, pirimifos-metila (652) + TX, isômero de policlorodidiclopentadieno (nome de IUPAC) (1346) + TX, policlorterpenos (nome tradicional) (1347) + TX, arseneto de potássio [CCN] + TX, tiocianato de potássio [CCN] + TX, praetrina (655) + TX, precoceno I (nome alternativo) [CCN] + TX, precoceno II (nome alternativo) [CCN] + TX, precoceno III (nome alternativo) [CCN] + TX, primidófos (1349) + TX, profenófos (662) + TX, proflutrina [CCN] + TX, promacila (1354) + TX, promecarbo (1355) + TX, propáfós (1356) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxúro (678) + TX, protidation (1360) + TX, protiófós (686) + TX, protoato (1362) + TX, protrifenbuto [CCN] + TX, pimetrozina (688) + TX, piraclofos (689) + TX, pirazófos (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridalila (700) + TX, piridafention (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifeno (708) + TX, quassia (nome alternativo) [CCN] + TX, quinalfos (711) + TX, quinalfos-metila (1376) + TX, quinotion (1380) + TX, quintiófos (1381) + TX, R-1492 (código de desenvolvimento) (1382) + TX, rafoxanida (nome alternativo) [CCN] + TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX, RU 15525 (código de desenvolvimento) (723) + TX, RU 25475 (código de desenvolvimento) (1386) + TX, riania (nome alternativo) (1387) + TX, rianodina (nome tradicional) (1387) + TX, sabadila (nome alternativo) (725) + TX, scradan (1389) + TX, sebufos (nome alternativo) + TX, selamectina (nome alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de composto) + TX, SI-0205 (código de composto) + TX, SI-0404 (código de composto) + TX, SI-0405 (código de composto) + TX, silafluofen (728) + TX, SN 72129 (código de desenvolvimento) (1397) + TX, arseneto de sódio [CCN] + TX, cianida de sódio (444) + TX, fluoreto de sódio (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sódio (1400) + TX, pentaclorofenoxida de sódio (623) + TX, selenato de sódio (nome de IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sódio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, spinosad (737) + TX, espiromesifeno (739) + TX, espirotetmat (CCN) + TX, sulcofuron (746) + TX, sulcofu-

ron-sódio (746) + TX, sulfluramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoreto de
 sulfurila (756) + TX, sulprófos (1408) + TX, óleos de tar (nome alternativo)
 (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarbo (1412) + TX, TDE (1414)
 + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfos (764) +
 5 TX, teflubenzuron (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefos (770) + TX,
 TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nome alternativo) + TX,
 terbufos (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfos (777) + TX,
 tetrametrina (787) + TX, teta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX,
 tiafenóx (nome alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticrofos (1428) +
 10 TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam (798) + TX, oxalato de hidrogênio de
 tiociclam (798) + TX, tiodicarbo (799) + TX, tiofanóx (800) + TX, tiometon
 (801) + TX, tionazina (1434) + TX, tiossultap (803) + TX, tiossultap-sódio
 (803) + TX, turingienisina (nome alternativo) [CCN] + TX, tolfenpirad (809) +
 TX, tralometrina (812) + TX, transflutrina (813) + TX, transpermetrina (1440)
 15 + TX, triamifos (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazófos (820) + TX, tria-
 zuron (nome alternativo) + TX, triclorfon (824) + TX, triclormetafos-3 (nome
 alternativo) [CCN] + TX, tricloronat (1452) + TX, trifenófos (1455) + TX, tri-
 flumuron (835) + TX, trimetacarbo (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamido-
 tion (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratridina (nome alternativo) (725) +
 20 TX, veratrina (nome alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarbo (854)
 + TX, YI-5302 (código de composto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, ze-
 tametrina (nome alternativo) + TX, fosfeto de zinco (640) + TX, zolaprófos
 (1469) e ZXI 8901 (código de desenvolvimento) (858) + TX,

uma moluscicida selecionada do grupo de substâncias consis-
 25 tindo em bis(tributiltin)óxido (nome de IUPAC) (913) + TX, bromoacetamida
 [CCN] + TX, arsenato de cálcio [CCN] + TX, cloetocarbo (999) + TX, aceto-
 arsenito de cobre [CCN] + TX, sulfato de cobre (172) + TX, fentina (347) +
 TX, fosfato férrico (nome de IUPAC) (352) + TX, metaldeído (518) + TX, me-
 tiocarbo (530) + TX, niclosamida (576) + TX, niclosamida-olamina (576) +
 30 TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenoxida de sódio (623) + TX, ta-
 zimcarbo (1412) + TX, tiodicarbo (799) + TX, óxido de tributiltina (913) + TX,
 trifenmorf (1454) + TX, trimetacarbo (840) + TX, acetato de trifeniltina (nome

de IUPAC) (347) e hidróxido de trifeniltina (nome de IUPAC) (347) + TX,
 uma nematicida selecionado do grupo de substâncias consistin-
 do em AKD-3088 (código de composto) + TX, 1 + TX, 2-dibromo-3-
 cloropropano (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1 + TX, 2-
 5 dicloropropano (nome de IUPAC/ Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1 + TX,
 2-dicloropropano com 1 + TX, 3-dicloropropeno (nome de IUPAC) (1063) +
 TX, 1 + TX, 3-dicloropropeno (233) + TX, 3 + TX, 4-diclorotetraidrotofeno 1
 + TX, 1-dioxida (nome de IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-
 clorofenil)-5-metilrhodanina (nome de IUPAC) (980) + TX, 5-metil-6-tioxo-1 +
 10 TX, 3 + TX, ácido 5-tiadiazinan-3-ilacético (nome de IUPAC) (1286) + TX, 6-
 isopentenilaminopurina (nome alternativo) (210) + TX, abamectina (1) + TX,
 acetoprol [CCN] + TX, alanicarbo (15) + TX, aldicarbo (16) + TX, aldoxicarbo
 (863) + TX, AZ 60541 (código de composto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX,
 benomila (62) + TX, butilpiridabeno (nome alternativo) + TX, cadusafos (109)
 15 + TX, carbofurano (118) + TX, dissulfeto de carbono (945) + TX, carbossul-
 fano (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, clorpirifos (145) + TX, cloetocarbo
 (999) + TX, citocininas (nome alternativo) (210) + TX, dazomet (216) + TX,
 DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafos (1044) + TX, diclofention
 (1051) + TX, diclifos (nome alternativo) + TX, dimetoato (262) + TX, dora-
 20 mectina (nome alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato
 de emamectina (291) + TX, eprinomectina (nome alternativo) [CCN] + TX,
 etoprófos (312) + TX, dibrometo de etileno (316) + TX, fenamifos (326) + TX,
 fenpirad (nome alternativo) + TX, fensulfotion (1158) + TX, fostiazato (408) +
 TX, fostietano (1196) + TX, furfural (nome alternativo) [CCN] + TX, GY-81
 25 (código de desenvolvimento) (423) + TX, heterófos [CCN] + TX, iodometano
 (nome de IUPAC) (542) + TX, isamidófos (1230) + TX, isazófos (1231) + TX,
 ivermectina (nome alternativo) [CCN] + TX, cinetina (nome alternativo) (210)
 + TX, mecarfon (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potássio (nome al-
 ternativo) (519) + TX, metam-sódio (519) + TX, brometo de metila (537) +
 30 TX, isotiocianato de metila (543) + TX, oxima de milbemicina (nome alterna-
 tivo) [CCN] + TX, moxidectina (nome alternativo) [CCN] + TX, composição
 de *Myrothecium verrucaria* (nome alternativo) (565) + TX, NC-184 (código de

- composto) + TX, oxamila (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidon (639) + TX, fosfocarbo [CCN] + TX, sebufos (nome alternativo) + TX, selamectina (nome alternativo) [CCN] + TX, spinosad (737) + TX, terbam (nome alternativo) + TX, terbufos (773) + TX, tetraclorotiofeno (nome de IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenóx (nome alternativo) + TX, tionazina (1434) + TX, triazófos (820) + TX, triazuron (nome alternativo) + TX, xilenóis [CCN] + TX, YI-5302 (código de composto) e zeatina (nome alternativo) (210) + TX,
- uma inibidor de nitrificação selecionado do grupo de substâncias consistindo em etilxantato de potássio [CCN] e nitrapirina (580) + TX,
- 10 um ativador de plantas selecionado do grupo de substâncias consistindo em acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-*S*-metila (6) + TX, probenazol (658) e xtrato de *Reynoutria sachalinensis* (nome alternativo) (720) + TX,
- uma rodenticida selecionada do grupo de substâncias consistindo em 2-isovalerilindan-1 + TX, 3-diona (nome de IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenossulfonamida (nome de IUPAC) (748) + TX, alfa-cloroidrina [CCN] + TX, fosfeto de alumínio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenosa (882) + TX, carbonato de bário (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacoum (89) + TX, bromadiolona (91) + TX, brometalina (92) + TX, cianida de cálcio (444) + TX, cloralose (127) + TX, clorofacinona (140) + TX, colecalciferol (nome alternativo) (850) + TX, coumaclor (1004) + TX, coumafurila (1005) + TX, coumatetralila (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafeno (357) + TX, fluoroacetamida (379) + TX,
- 25 flupropadina (1183) + TX, cloridrato de flupropadina (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, cianida de hidrogênio (444) + TX, iodometano (nome de IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfeto de magnésio (nome de IUPAC) (640) + TX, brometo de metila (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX, fosfina (nome de IUPAC) (640) + TX,
- 30 fosforoso [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arseneto de potássio [CCN] + TX, pirinuron (1371) + TX, scillirosida (1390) + TX, arsenato de sódio [CCN] + TX, cianida de sódio (444) + TX, fluoroacetato de sódio (735) + TX, estric-

nina (745) + TX, sulfato de tálio [CCN] + TX, warfarina (851) e fosfeto de zinco (640) + TX,

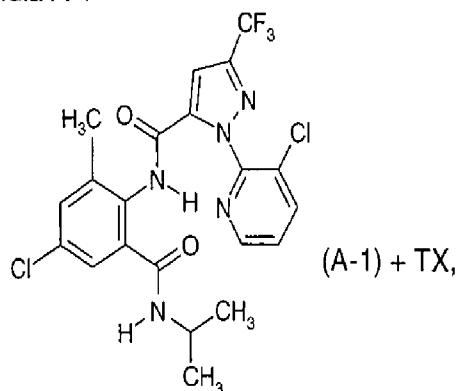
um sinergista selecionado do grupo de substâncias consistindo em piperonilato de 2-(2-butoxi)etila (nome de IUPAC) (934) + TX, 5-(1 +
 5 TX, 3-benzodioxol-5-il)-3-hexilcicloex-2-enona (nome de IUPAC) (903) + TX, farnesol com nerolidol (nome alternativo) (324) + TX, MB-599 (código de desenvolvimento) (498) + TX, MGK 264 (código de desenvolvimento) (296) + TX, butóxida de piperonila (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isômero de propila (1358) + TX, S421 (código de desenvolvimento) (724) + TX, sesaméx
 10 (1393) + TX, sesasmolin (1394) e sulfoxida (1406) + TX,

um repelente de animal selecionado do grupo de substâncias consistindo em antraquinona (32) + TX, cloralose (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclureto de cobre (171) + TX, diazinon (227) + TX, diciclopentadieno (nome químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetato de guazatina (422) + TX, metiocarbo (530) + TX, piridin-4-amina (nome de IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarbo (840) + TX, naftenato de zinco [CCN] e ziram (856) + TX,

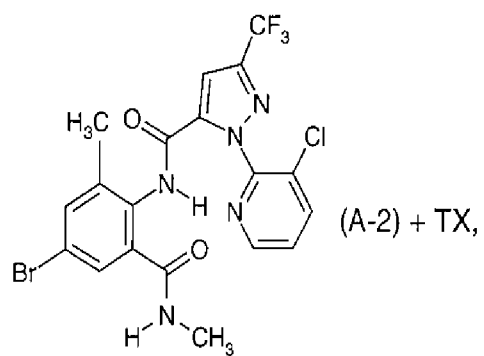
um viricida selecionado do grupo de substâncias consistindo em imanina (nome alternativo) [CCN] e ribavirina (nome alternativo) [CCN] + TX,

20 e um protetor de ferimento selecionado do grupo de substâncias consistindo em óxido mercúrico (512) + TX, octilinona (590) e tiofanato-metila (802) + TX,

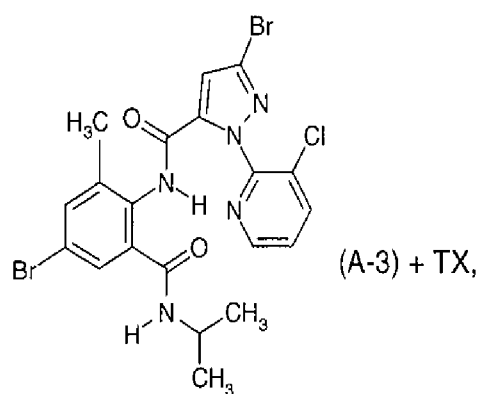
o composto de fórmula A-1



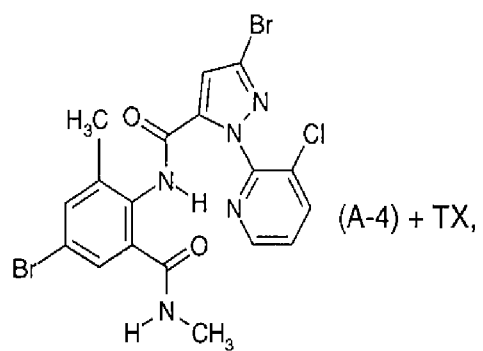
a fórmula A-2



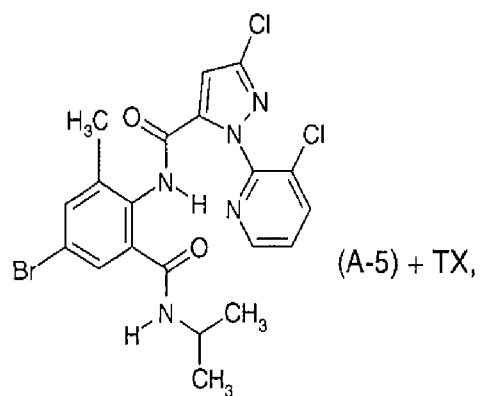
a fórmula A-3



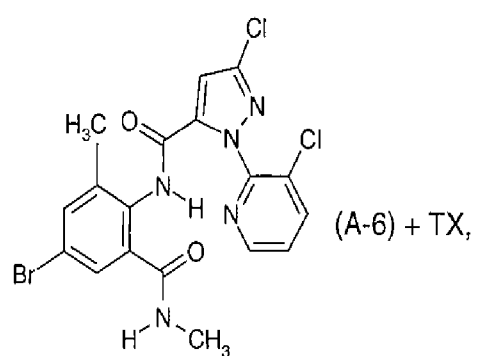
a fórmula A-4



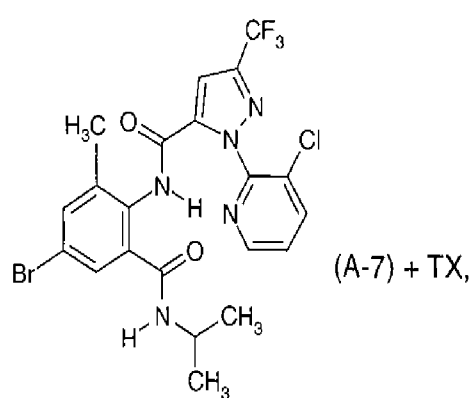
a fórmula A-5



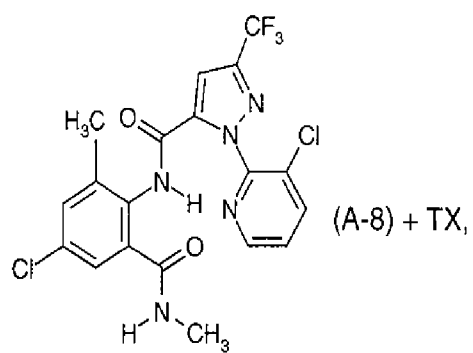
a fórmula A-6



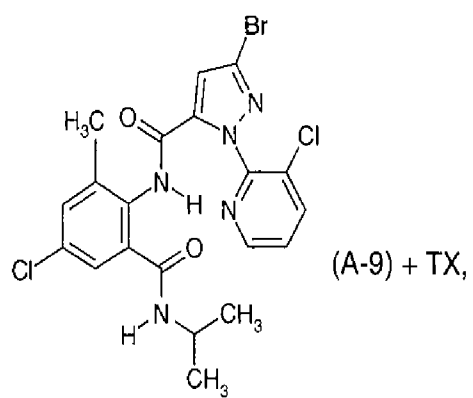
a fórmula A-7



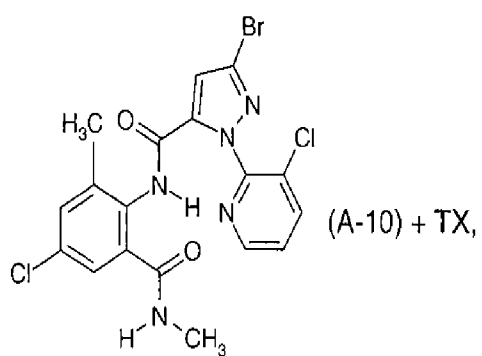
a fórmula A-8



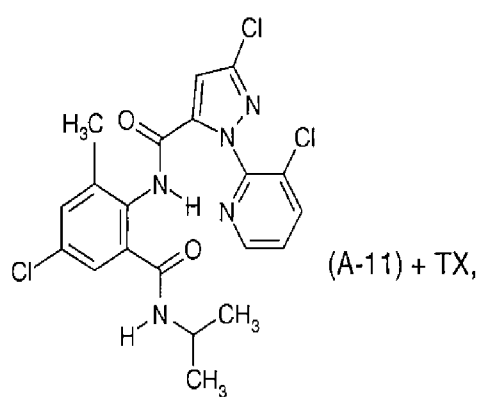
a fórmula A-9



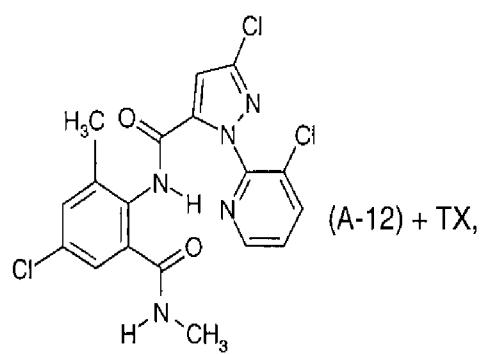
a fórmula A-10



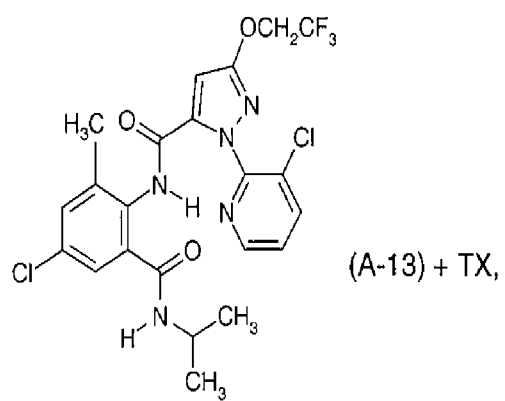
a fórmula A-11



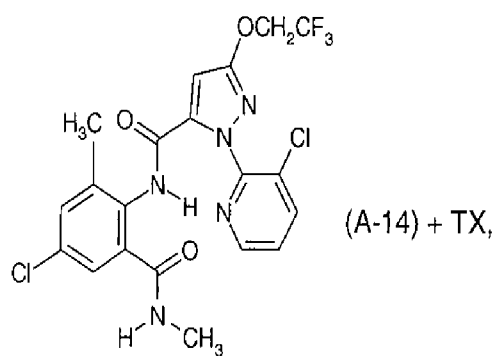
a fórmula A-12



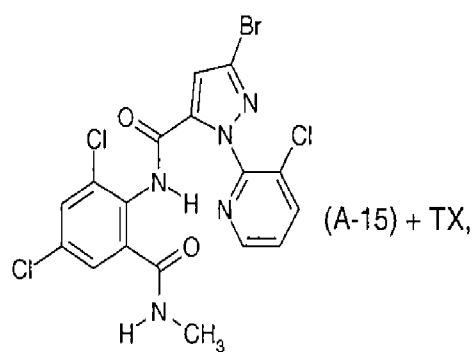
a fórmula A-13



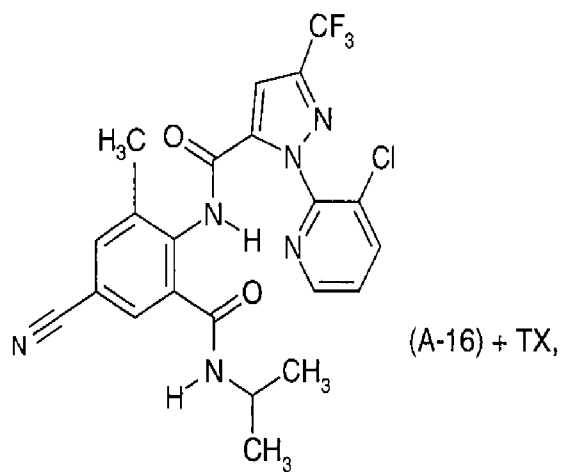
a fórmula A-14



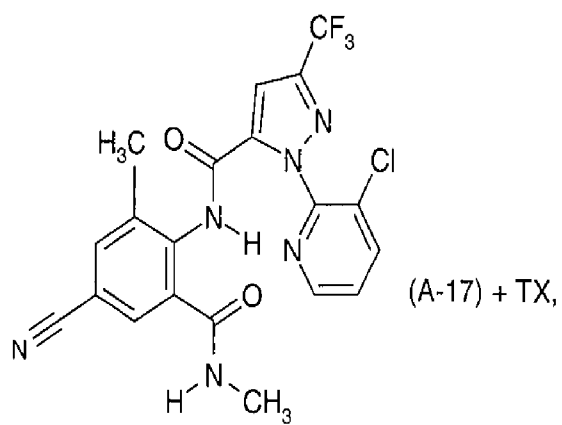
a fórmula A-15



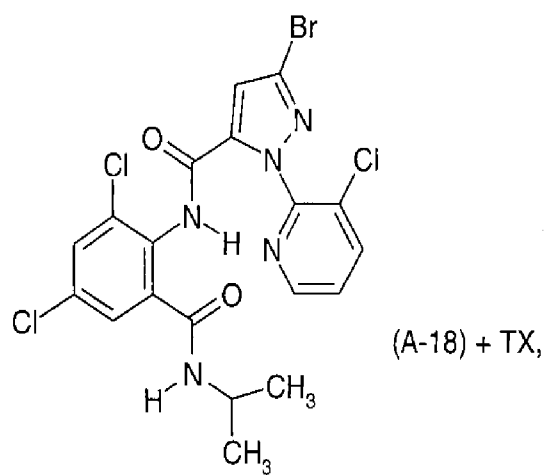
a fórmula A-16



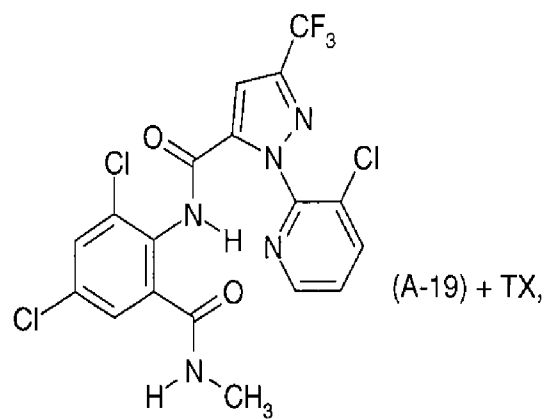
a fórmula A-17



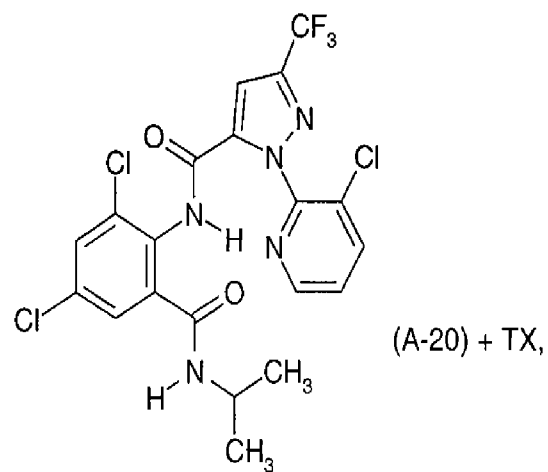
a fórmula A-18



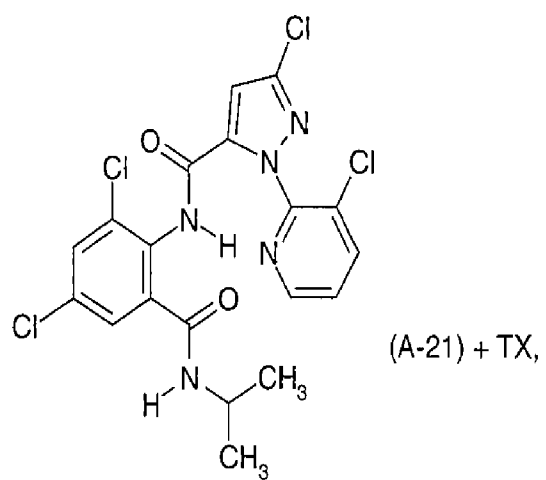
a fórmula A-19



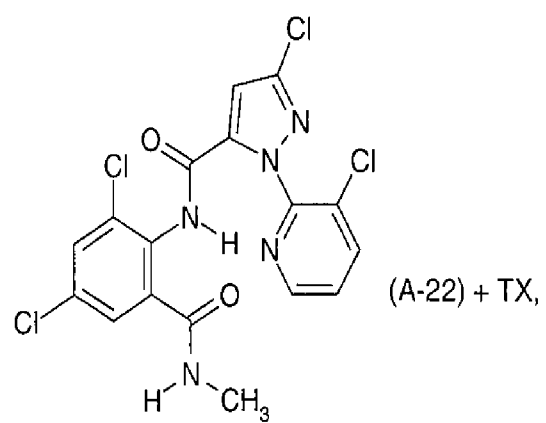
a fórmula A-20



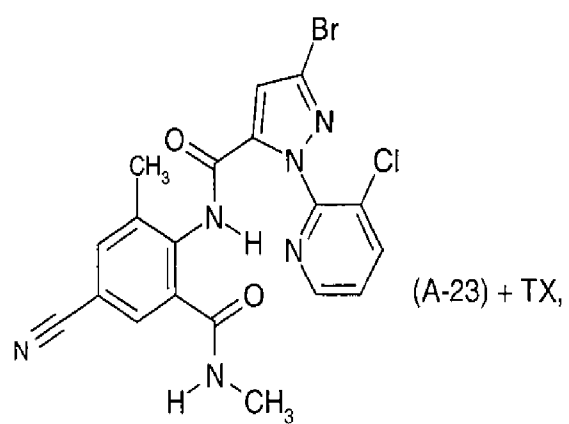
a fórmula A-21



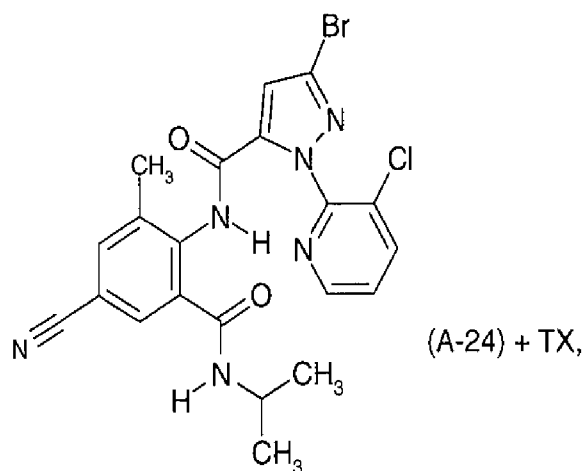
a fórmula A-22



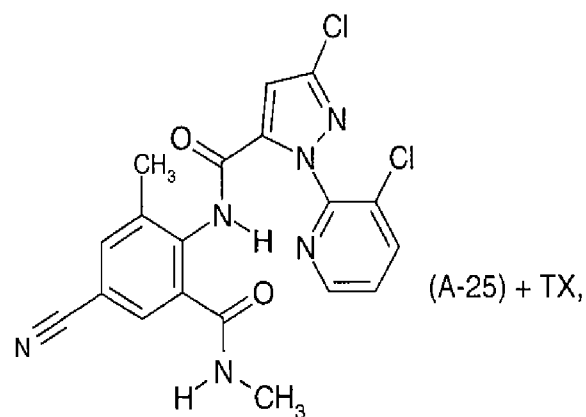
a fórmula A-23



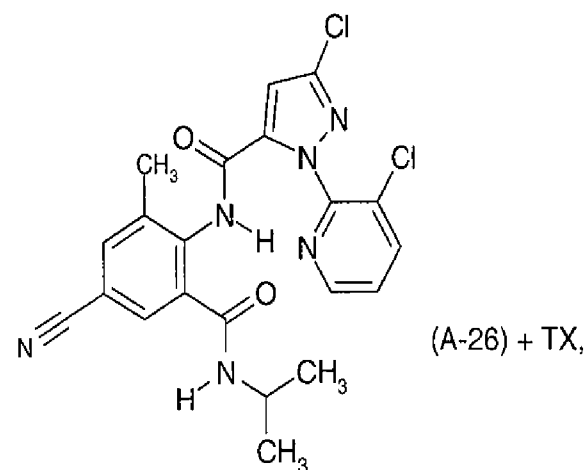
a fórmula A-24



a fórmula A-25



a fórmula A-26

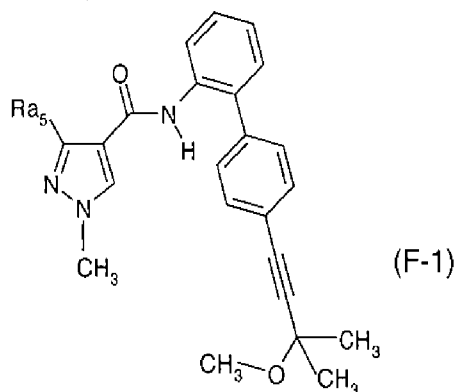


- e Azaconazol [60207-31-0] + TX, Bitertanol [70585-36-3] + TX, Bromuconazol [116255-48-2] + TX, Ciproconazol [94361-06-5] + TX, Difenconazol [119446-68-3] + TX, Diniconazol [83657-24-3] + TX, Epoxiconazol [106325-08-0] + TX, Fenbuconazol [114369-43-6] + TX, Fluquinconazol [136426-54-5] + TX, Flusilazol [85509-19-9] + TX, Flutriafol [76674-21-0] + TX, Hexaco-

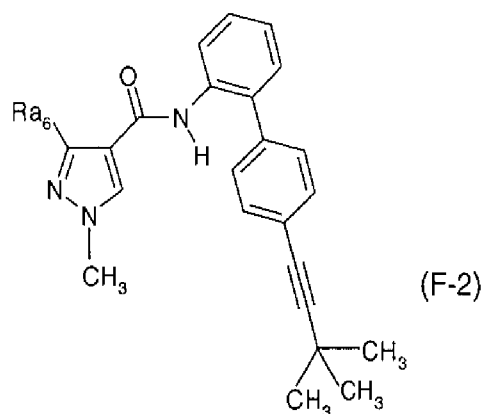
- nazol [79983-71-4] + TX, Imazalila [35554-44-0] + TX, Imibenconazol [86598-92-7] + TX, Ipconazol [125225-28-7] + TX, Metconazol [125116-23-6] + TX, Miclobutanila [88671-89-0] + TX, Pefurazoato [101903-30-4] + TX, Penconazol [66246-88-6] + TX, Protioconazol [178928-70-6] + TX, Pirifenóx
- 5 [88283-41-4] + TX, Procloraz [67747-09-5] + TX, Propiconazol [60207-90-1] + TX, Simeconazol [149508-90-7] + TX, Tebuconazol [107534-96-3] + TX, Tetraconazol [112281-77-3] + TX, Triadimefon [43121-43-3] + TX, Triadime-
- 10 nol [55219-65-3] + TX, Triflumizol [99387-89-0] + TX, Triticonazol [131983-72-7] + TX, Ancimidol [12771-68-5] + TX, Fenarimol [60168-88-9] + TX, Nua-
- rimol [63284-71-9] + TX, Bupirinato [41483-43-6] + TX, Dimetirimol [5221-53-4] + TX, Etirimol [23947-60-6] + TX, Dodemorf [1593-77-7] + TX, Fenpro-
- 15 pidina [67306-00-7] + TX, Fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, Tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinila [121552-61-2] + TX, Mepanipirim [110235-47-7] + TX, Pirimetanila [53112-28-0] + TX, Fen-
- 20 piclonila [74738-17-3] + TX, Fludioxonila [131341-86-1] + TX, Benalaxila [71626-11-4] + TX, Furalaxila [57646-30-7] + TX, Metalaxila [57837-19-1] + TX, R-Metalaxila [70630-17-0] + TX, Ofurace [58810-48-3] + TX, Oxadixila [77732-09-3] + TX, Benomila [17804-35-2] + TX, Carbendazim [10605-21-7] + TX, Debacarbo [62732-91-6] + TX, Fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiaben-
- 25 dazol [148-79-8] + TX, Clozolinato [84332-86-5] + TX, Diclozolina [24201-58-9] + TX, Iprodiona [36734-19-7] + TX, Miclozolina [54864-61-8] + TX, Proci-
- midona [32809-16-8] + TX, Vinclozolina [50471-44-8] + TX, Boscalid [188425-85-6] + TX, Carboxina [5234-68-4] + TX, Fenfuram [24691-80-3] + TX, Flutolanila [66332-96-5] + TX, Mepronila [55814-41-0] + TX, Oxicarboxi-
- 30 na [5259-88-1] + TX, Pentiopirad [183675-82-3] + TX, Tifluzamida [130000-40-7] + TX, Guazatina [108173-90-6] + TX, Dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base de carga) + TX, Iminoctadina [13516-27-3] + TX, Azoxistrobina [131860-33-8] + TX, Dimoxistrobina [149961-52-4] + TX, Enestroburina {Proc. BCPC + TX, Int. Congr. + TX, Glasgow + TX, 2003 + TX, 1 + TX, 93} + TX, Fluoxastrobina [361377-29-9] + TX, Kresoxim-metila [143390-89-0] + TX, Metominostrobin [133408-50-1] + TX, Trifloxistrobina [141517-21-7] + TX, Orisastrobina [248593-16-0] + TX, Picoxistrobina [117428-22-5] + TX,

Piraclostrobina [175013-18-0] + TX, Ferbam [14484-64-1] + TX, Mancozeb
 [8018-01-7] + TX, Maneb [12427-38-2] + TX, Metiram [9006-42-2] + TX,
 Propineb [12071-83-9] + TX, Tiram [137-26-8] + TX, Zineb [12122-67-7] +
 TX, Ziram [137-30-4] + TX, Captafol [2425-06-1] + TX, Captan [133-06-2] +
 5 TX, Diclofluanid [1085-98-9] + TX, Fluoroimida [41205-21-4] + TX, Folpet
 [133-07-3] + TX, Toliifluanid [731-27-1] + TX, Mistura Bordeaux [8011-63-0]
 + TX, Coperidroxid [20427-59-2] + TX, Coperoxiclorid [1332-40-7] + TX, Co-
 persulfat [7758-98-7] + TX, Coperoxid [1317-39-1] + TX, Mancoper [53988-
 93-5] + TX, Oxina-coper [10380-28-6] + TX, Dinocap [131-72-6] + TX, Nitro-
 10 tal-isopropila [10552-74-6] + TX, Edifenfos [17109-49-8] + TX, Iprobenfos
 [26087-47-8] + TX, Isoprotiolano [50512-35-1] + TX, Fosdifen [36519-00-3] +
 TX, Pirazófos [13457-18-6] + TX, Tolclofos-metila [57018-04-9] + TX, Aci-
 benzolar-S-metila [135158-54-2] + TX, Anilazina [101-05-3] + TX, Bentiavali-
 carbo [413615-35-7] + TX, Blastidicin-S [2079-00-7] + TX, Cinometionato
 15 [2439-01-2] + TX, Cloroneb [2675-77-6] + TX, Clorotalonila [1897-45-6] +
 TX, Ciflufenamid [180409-60-3] + TX, Cimoxanila [57966-95-7] + TX, Diclona
 [117-80-6] + TX, Diclocimet [139920-32-4] + TX, Diclomezina [62865-36-5] +
 TX, Dicloran [99-30-9] + TX, Dietofencarbo [87130-20-9] + TX, Dimetomorf
 [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, Ditianon [3347-
 20 22-6] + TX, Etaboxam [162650-77-3] + TX, Etridiazol [2593-15-9] + TX, Fa-
 moxidona [131807-57-3] + TX, Fenamidona [161326-34-7] + TX, Fenoxanila
 [115852-48-7] + TX, fentina [668-34-8] + TX, Ferimzona [89269-64-7] + TX,
 Fluazinam [79622-59-6] + TX, Fluopicolida [239110-15-7] + TX, Flusulfamida
 [106917-52-6] + TX, Fenexamid [126833-17-8] + TX, Fosetil-alumínio
 25 [39148-24-8] + TX, Himexazol [10004-44-1] + TX, Iprovalicarbo [140923-17-
 7] + TX, IKF-916 (Ciazofamid) [120116-88-3] + TX, cassugamicina [6980-18-
 3] + TX, Metasulfocarbo [66952-49-6] + TX, Metrafenona [220899-03-6] +
 TX, Pencicuron [66063-05-6] + TX, ftalida [27355-22-2] + TX, Polioxinas
 [11113-80-7] + TX, Probenazol [27605-76-1] + TX, Propamocarbo [25606-
 30 41-1] + TX, Proquinazid [189278-12-4] + TX, Piroquilon [57369-32-1] + TX,
 Quinoxifeno [124495-18-7] + TX, Quintozeno [82-68-8] + TX, Scwefel [7704-
 34-9] + TX, Tiadinila [223580-51-6] + TX, Triazoxida [72459-58-6] + TX, Tri-

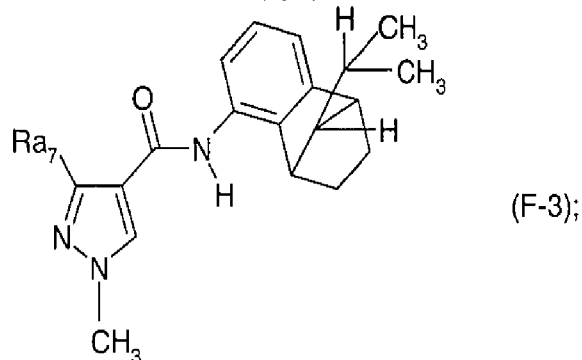
ciclazol [41814-78-2] + TX, Triforina [26644-46-2] + TX, Validamicina [37248-47-8] + TX, Zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, Mandipropamid [374726-62-2] + TX, o composto de fórmula F-1



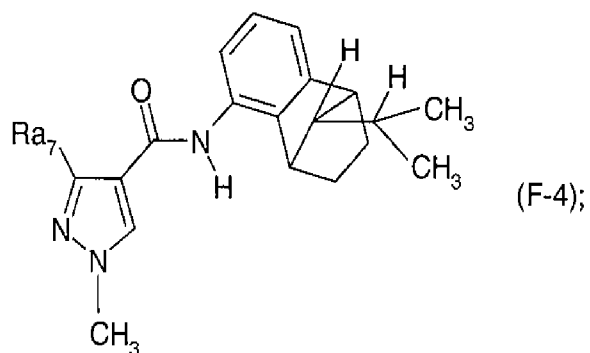
em que Ra_5 é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/058723) + TX, ; o
5 composto de fórmula F-2



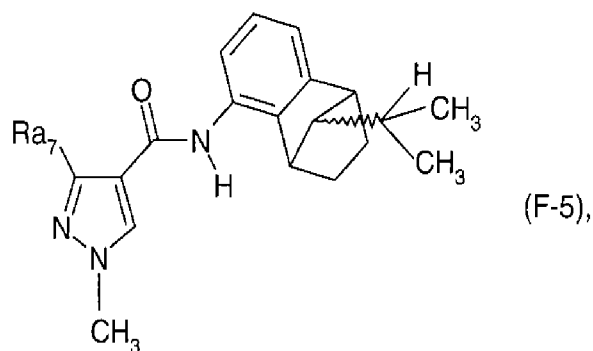
em que Ra_6 é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/058723) + TX,; o
composto racêmico de fórmula F-3 (syn)



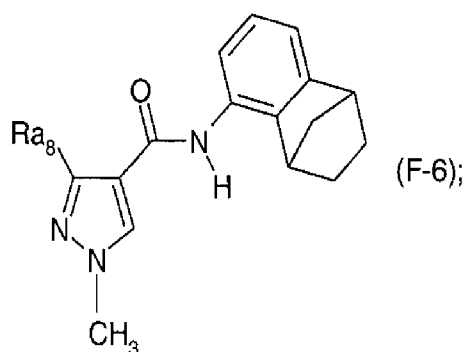
em que Ra_7 é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/035589) + TX,
a mistura racêmica de fórmula F-4 (anti)



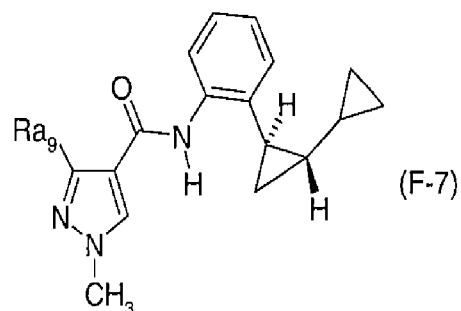
em que Ra_7 é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/035589) + TX, o composto de fórmula F-5



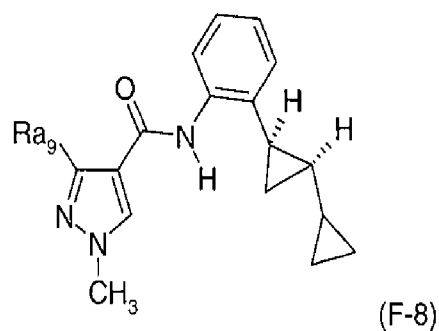
que é uma mistura epimérica de composto racêmico de fórmulas **F-3 (syn)** e **F-4 (anti)**, em que a relação de compostos racêmicos de fórmula **F-3 (syn)** para compostos racêmicos de fórmula **F-4 (anti)** é de 1000 : 1 a 1 : 1000 e em que Ra_7 é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/035589) + TX, o composto de fórmula F-6



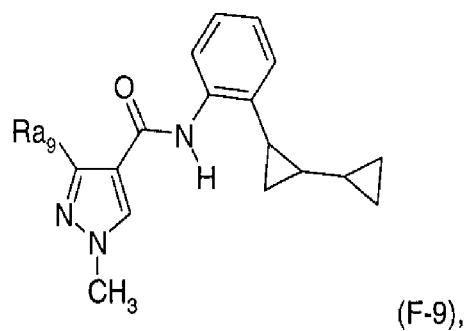
em que Ra_8 é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/035589) + TX, o composto racêmico de fórmula F-7 (trans)



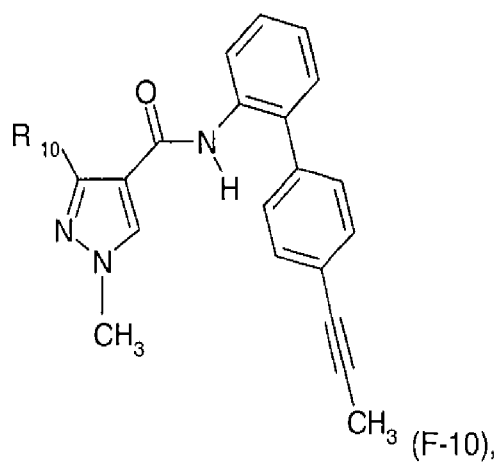
em que Ra_9 é trifluorometila ou difluorometila (WO03/074491) + TX, o composto racêmico de fórmula F-8 (cis)



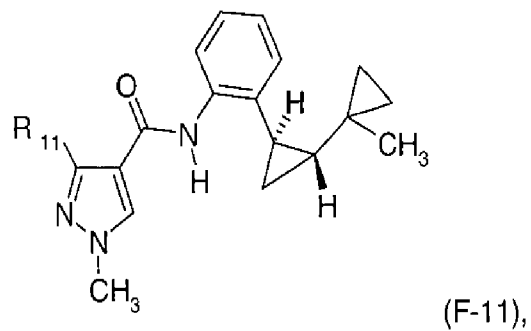
em que Ra_9 é trifluorometila ou difluorometila (WO03/074491) + TX, o composto de fórmula F-9



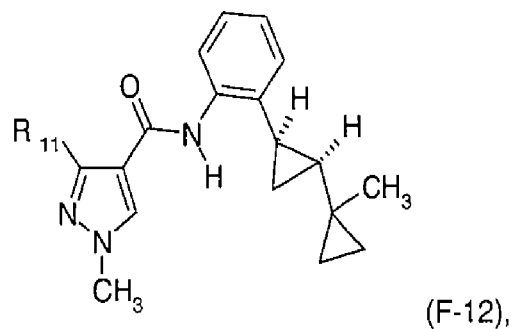
- 5 que é uma mistura dos composto racêmicos de fórmulas F-7 (trans) e F-8 (cis), em que a relação do composto racêmico de fórmula F-7 (trans) para o composto racêmico de fórmula F-8 (cis) é 2 : 1 a 100 : 1 ; e em que Ra_9 é trifluorometila ou difluorometila (WO03/074491) + TX, o composto de fórmula F-10



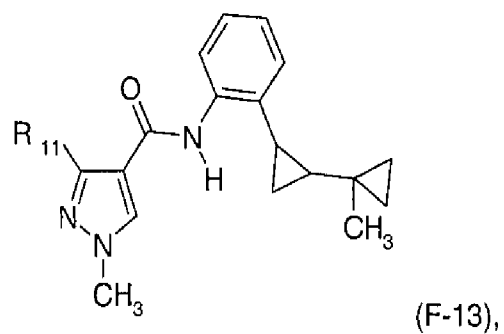
em que R_{10} é trifluorometila ou difluorometila (WO2004/058723) + TX, o composto racêmico de fórmula F-11 (trans)



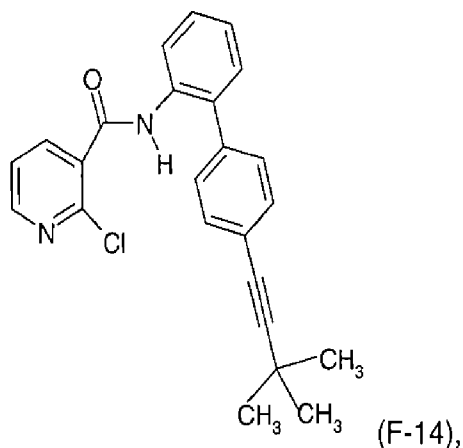
em que R_{11} é trifluorometila ou difluorometila (WO03/074491) + TX, o composto racêmico de fórmula F-12 (cis)



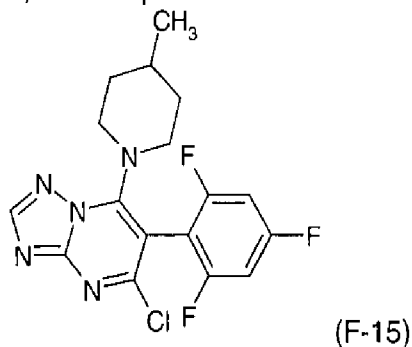
- 5 em que R_{11} é trifluorometila ou difluorometila (WO03/074491) + TX, o composto de fórmula F-13



que é uma mistura racêmica de fórmulas F-11 (trans) e F-12 (cis), e em que R_{11} é trifluorometila ou difluorometila (WO 03/074491) + TX, e o composto de fórmula F-14



(WO2004/058723) + TX, e o composto de fórmula F-15



5 [214706-53-3], + TX.

A mistura de ingrediente ativo dos compostos de fórmula I selecionados das tabelas A e B com ingredientes ativos descritos acima compreende um composto selecionado das tabelas A e B e um ingrediente ativo como descrito acima preferivelmente em uma relação de mistura de 100:1 a 1:6000, especialmente de 50:1 a 1:50, mais especialmente em uma relação de 20:1 a 1:20, ainda mais especialmente de 10:1 a 1:10, muito especialmente de 5:1 e 1:5, preferência especial sendo dada a uma relação de 2:1 a 1:2, e uma relação de 4:1 a 2:1 sendo igualmente preferida, acima todos em uma relação de 1:1, ou 5:1, ou 5:2, ou 5:3, ou 5:4, ou 4:1, ou 4:2, ou 4:3, ou 3:1, ou 3:2, ou 2:1, ou 1:5, ou 2:5, ou 3:5, ou 4:5, ou 1:4, ou 2:4, ou 3:4, ou 1:3, ou 2:3, ou 1:2, ou 1:600, ou 1:300, ou 1:150, ou 1:35, ou 2:35, ou 4:35, ou 1:75, ou 2:75, ou 4:75, ou 1:6000, ou 1:3000, ou 1:1500, ou 1:350, ou 2:350, ou 4:350, ou 1:750, ou 2:750, ou 4:750. Essas relações de misturas

são entendidas para incluir, em um manual, relações por peso e também, em outro manual, relações molares.

As misturas compreendem um composto de fórmula I selecionados das tabelas A e B e um ou mais ingredientes ativos como descritos acima podem ser aplicados, por exemplo, uma forma de "mistura pronta" simples, em uma mistura por spray combinada composta de formulações separadas dos componentes de ingrediente ativo, tais como uma "mistura de tanque", e em um uso combinado dos ingredientes ativos simples quando aplicados em uma maneira sequencial, isto é, uma após a outra com um período razoavelmente curto, tal como poucas horas ou dias. A ordem de aplicar os compostos de fórmula I selecionados das tabelas A e B e os ingredientes ativos como descritos acima não é essencial para preparar a presente invenção.

As referências entre colchetes atrás dos ingredientes ativos, por exemplo, [3878-19-1] referem-se aos números de Chemical Abstracts Registry. Os compostos de fórmulas A-1 a A-26 são descritos em WO 03/015518 ou em WO 04/067528. Os pares de misturas descritas acima são conhecidos. Quando os ingredientes ativos são incluídos em "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; Décima Terceira Edição; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council], eles são descritos aqui sob o número de entrada dado entre parênteses aqui acima para o composto particular; por exemplo, o composto "abamectina" é descrito sob número de entrada (1). Onde "[CCN]" é adicionado aqui acima para o composto particular, o composto em questão é incluído no "Compendium of Pesticide Nome comuns", que é acessível na internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Nome comuns, Copiright © 1995-2004]; por exemplo, o composto "acetoprol" é descrito sob endereço de internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprol.html>.

A maioria dos ingredientes ativos descritos acima são referidos aqui anteriormente por um assim chamado "nome comum", o pertinente "nome comum ISO" ou outro "nome comum" sendo usado em casos individuais. Se a designação não é um "nome comum", a natureza da designação

usada em vez dele é dada entre colchetes para o composto particular; no caso, o nome de IUPAC, o nome de IUPAC/Chemical Abstracts, um "nome químico", um "nome tradicional", um "nome de composto" ou um "código de desenvolvimento" é usado ou, se nenhuma daquelas designações nem
 5 nenhum "nome comum" é usado, um "nome alternativo" é empregado. "CAS Reg. No" significa o Chemical Abstracts Registry Number.

Exemplos Biológicos (% = percentual por peso, a menos que de outro modo especificado)

Exemplo B1: Atividade contra *Cydia pomonella*:

10 Padrões de cubos de dieta de *Cydia* (1,5 cm de largura) são penetrados com palito de dente e são imersos em parafina líquido (ca. 80°C). Após o revestimento de parafina ser endurecido, uma emulsão aquosa contendo 400 ppm de ingrediente ativo é aplicada usando um vaporizador De Vilbis (25 ml, 100 kPa (1 bar)). Após o revestimento por spray ser secado, os
 15 cubos são colocados em recipientes de plástico que são em seguida populados com *Cydia pomonella* recentemente ninhadas (1st instar). Os recipientes são em seguida fechados com uma capa de plástico. Após incubação de 14 dias a 26°C e 40-60% de umidade relativa, a relação de sobrevivência das lagartas bem como sua regulação de crescimento é determinada. Neste
 20 teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,1, A.1,13, A.1,7 e A.1,4 têm uma atividade de 80% a mais.

Exemplo B2: Atividade contra *Diabrotica balteata*

25 Mudas de milho são vaporizadas com uma mistura por spray de emulsão aquosa compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo e, depois o revestimento por spray foi secado, populado com 10 lagartas (2nd instar) de *Diabrotica balteata* e introduzido em um recipiente de plástico. 6 dias depois, a redução de porcentagem na população (% atividade) é determinada comparando-se o número de lagartas mortas entre as plantas tratadas e não
 30 tratadas.

Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,1, A.1,4, B. 1.28,

A.1,122 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

Exemplo B3: Atividade contra *Heliotis virescens* (aplicação foliar)

Plantas de soja jovens são vaporizadas com uma mistura por spray de emulsão aquosa compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo e, depois o revestimento por spray foi secado, populado com 10 lagartas (1st instar) de *Heliotis virescens* e introduzido em um recipiente de plástico. 6 dias depois, a redução de porcentagem na população e na lesão alimentar (% de atividade) são determinadas comparando-se o número de lagartas mortas e a lesão alimentar entre as plantas tratadas e não tratadas.

Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,4, A.1,1 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

Exemplo B4: Atividade contra *Heliotis virescens* (aplicação para ovos)

Ovos de *Heliotis virescens*, que foram depositados em algodão, são vaporizados com uma mistura por spray de emulsão aquosa compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo. Após 8 dias, a relação de porcentagem ninhada dos ovos e a relação de sobrevivência das lagartas (% de atividade) são avaliadas em comparação com grupos de controle não tratados.

Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,1, A.1,4, B. 1.28, A.1,122, A.1,57, A.1,131 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

Exemplo B5: Atividade contra *Myzus persicae* (aplicação folhear)

Mudas de ervilha são infectadas com *Myzus persicae*, subsequentemente vaporizadas com uma mistura por spray compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo e em seguida incubadas a 20°. 3 e 6 dias depois, a redução de porcentagem na população (% de atividade) é determinada comparando-se o número de afídios mortos entre as plantas tratadas e não tratadas.

Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,4, A.1,122 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

Exemplo B6: Atividade contra *Myzus persicae* (aplicação sistêmica)

Mudas de ervilha são infectadas com *Myzus persicae*, e suas raízes são subsequenteiramente colocadas em uma mistura por spray compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo. As plantas são em seguida incubadas a 20°. 3 e 6 dias depois, a redução de porcentagem na população (% de atividade) é determinada comparando-se o número de afídios mortos entre as plantas tratadas e não tratadas. Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,4, A.1,122 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

10 Exemplo B7: Atividade contra *Plutella xilostella*

Plantas de repolho jovens são vaporizadas com uma mistura por spray de emulsão aquosa compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo e, depois o revestimento por spray foi secado, populado com 10 lagartas (3rd instar) de *Plutella xilostella* e introduzido em um recipiente de plástico. 3 dias depois, a redução de porcentagem na população e na lesão alimentar (% de atividade) são determinadas comparando-se o número de lagartas mortas e a lesão alimentar entre as plantas tratadas e não tratadas.

Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,1, A.1,4, B. 1.28, A.1,122, A.1,57, A.1,131, A.1,134 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

20 Exemplo B8: Atividade contra *Spodoptera littoralis*

Plantas de soja jovens são vaporizadas com uma mistura por spray de emulsão aquosa compreendendo 400 ppm de ingrediente ativo e, em seguida o revestimento por spray foi secado, populado com 10 lagartas (1st instar) de *Spodoptera littoralis* e introduzido em um recipiente de plástico. 3 dias depois, a redução de porcentagem na população e na lesão alimentar (% de atividade) são determinadas comparando-se o número de lagartas mortas e a lesão alimentar entre as plantas tratadas e não tratadas.

Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,1, A.1,4, B. 1.28, A.1,122, A.1,57, A.1,131 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

Exemplo B9: Teste de Inseticida Sistêmico para *Spodoptera littoralis* (lagarta de folha de algodão):

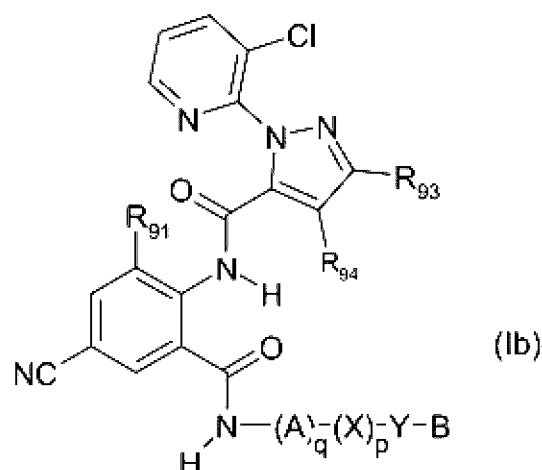
Mudas de milho de quatro dias (*Zea mays*, variety Stoneville) são colocadas em pequenos frascos individuais contendo 24 ml de água em que a química é diluída em 12,5 ppm. Mudanças são deixadas cultivar durante seis dias. Subseqüentemente as folhas são cortadas e colocadas em uma placa de Petri (5 cm de diâmetro), inoculadas com doze a quinze 1st instar de larvas de *S. littoralis* e incubadas durante quatro dias em uma câmara de crescimento (25°C, 50% r.h., 18:6 L:D período de foto). O número de insetos vivos são contados e a porcentagem de mortos calculada. Os testes foram conduzidos com uma réplica. Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,13, A.1,1, A.1,4, A.1,7, A.1,13, A.1,122, A.1,131 e B1.28 têm uma atividade de 80% a mais.

15 Exemplo B10 Atividade contra *Frankliniella occidentalis*:

Os discos de folha de feijão sobre ágar em placas Petri ou plantas de feijão em uma câmara de spray são tratados com soluções de teste diluídas. Após secagem, discos de folha são cortados e colocados em xícaras de plástico sobre a superfície de uma camada ágar e infestadas com população mista. 6 dias (discos de folha) ou 14 dias (plantas) após a infestação, as amostras são checadas quanto à redução de população tratada e comparada à população não tratada. Neste teste, os compostos listados na Tabela C acima mostram boa atividade. Em particular os compostos A.1,1, A.1,4, A.1,13, A.1,122 e A.1,7 têm uma atividade de 80% a mais.

REIVINDICAÇÕES

1. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta a Fórmula lb:



em que

- 5 R_{91} é C_1 - C_6 alquila;
- R_{93} é halogênio; C_1 - C_6 haloalquila; C_1 - C_6 haloalcóxi; C_1 - C_6 alquiltio;
- R_{94} é hidrogênio ou halogênio;
- A é C_1 - C_6 alquileno;
- q é 0 ou 1;
- 10 X é ausente;
- p é 0;
- Y é C_3 - C_6 cicloalquila;
- B é ciclopropila que pode ser mono- ou dissubstituída com C_1 - C_6 alquila; e sais/tautômeros agronomicamente aceitáveis destes compostos.
- 15 2. Composição pesticida, caracterizada pelo fato de que compreende pelo menos um composto de Fórmula I, como definido na reivindicação 1, ou, onde apropriado, um tautômero do mesmo, em cada caso na forma livre ou na forma de sal agroquimicamente utilizável, como ingrediente ativo e pelo menos um auxiliar.
- 20 3. Composição de acordo com a reivindicação 2, caracterizada pelo fato de ser para o controle de insetos ou representantes da ordem *Acarina*.
4. Método para o controle de pragas, caracterizado pelo fato de

que compreende aplicar uma composição, como definida na reivindicação 2, às pestes ou seu meio ambiente, com a exceção do tratamento do corpo do animal ou humano por meio de cirurgia ou terapia.

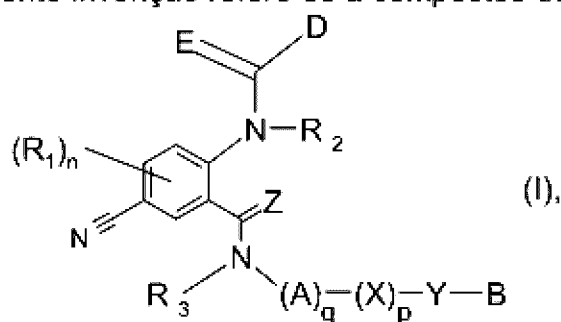
- 5 5. Método de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de ser para o controle de insetos ou representantes da ordem *Acarina*.

6. Método de acordo com a reivindicação 4, caracterizado pelo fato de ser para proteger o material de propagação de planta do ataque por peste, que compreende tratar o material de propagação ou o sítio, onde o material de propagação é plantado.

RESUMO

Patente de Invenção: "INSETICIDAS DE ANTRANILAMIDA DE CIANO, COMPOSIÇÃO PESTICIDA E MÉTODO PARA O CONTROLE DE PESTES".

5 A presente invenção refere-se a compostos de fórmula I



em que os substituintes são como definidos na reivindicação 1, e os sais agroquimicamente aceitáveis e todas as formas estereoisômeras e tautoméricas dos compostos de Fórmula I podem ser usados como ingredientes agroquímicos ativos e podem ser preparados de uma maneira conhecida por

10 si.