



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

(21) **PI 0712923-8 A2**

(22) Data de Depósito: 06/06/2007
(43) Data da Publicação: 02/10/2012
(RPI 2178)



* B R P I 0 7 1 2 9 2 3 A 2 *

(51) *Int.Cl.:*
C07D 401/14
A01N 43/56

(54) **Título:** DERIVADOS DE DIAMIDA DE ÁCIDO ANTRANÍLICO COM SUBSTITUINTES HETEROAROMÁTICOS E HETEROCÍCLICOS

(30) **Prioridade Unionista:** 13/06/2006 DE 10 2006 027 336.2

(73) **Titular(es):** Bayer Cropscience AG

(72) **Inventor(es):** Achim Hense, Bernd Alig, Christian Arnold, Christian Funke, Erich Sanwald, Ernst R. F. Gesing, Katsuaki Wada, Mark Wilhelm Drewes, Olga Malsam, Rüdiger Fischer, Tetsuya Murata, Ulrich Görgens

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

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007005016 de 06/06/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2007/144100de 21/12/2007

(57) **Resumo:** DERIVADOS DE DIAMIDA DE ÁCIDO ANTRANÍLICO COM SUBSTITUINTES HETEROAROMÁTICOS E HETEROCÍCLICOS. A presente invenção refere-se a novos inseticidas da fórmula (I), na qual R1, R2, R3, R4, R5, R6, A, Q e n podem ter os significados mencionados no relatório descritivo, vários procesos para a sua preparação e seu uso como substâncias ativas, especialmente seu uso como composições praguicidas.

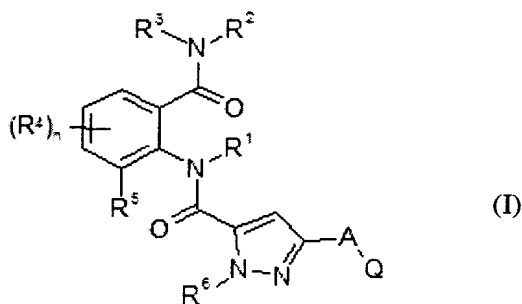
Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**DERIVADOS DE DIAMIDA DE ÁCIDO ANTRANÍLICO COM SUBSTITUINTES HETEROAROMÁTICOS E HETEROCÍCLICOS**".

A presente invenção refere-se a novos inseticidas, vários processos para sua preparação e seu uso como substâncias ativas, especialmente seu uso como composições praguicidas.

Já se sabe, que certas antranilamidas (por exemplo, WO 01/70671, WO 03/015519, WO 03/016284, WO 03/015518, WO 03/024222, WO 03/016282, WO 03/016283, WO 03/062226, WO 03/027099, WO 04/027042, WO 04/033468, WO 2004/046129, WO 2004/067528, WO 2005/118552, WO 2005/077934, WO 2005/085234, WO 2006/023783, WO 2006/000336, WO 2006/040113, WO 2006/111341, WO 2007/006670, WO 2007/024833, WO 2007/020877) possuem propriedades inseticidas.

A eficácia dessas substâncias é boa, mas em alguns casos deixa a desejar.

Foram desenvolvidas novas antranilamidas da fórmula (I)



na qual

R¹ representa hidrogênio, amino, hidróxi ou C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila ou C₃-C₆-cicloalquila em cada caso eventualmente substituída uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, (C₁-C₄-alcóxi)carbonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino ou (C₁-C₄-alquil)C₃-C₆-cicloalquilamino,

R² representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-

alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, C₂-C₆-alcoxicarbonila ou C₂-C₆-alquilcarbonila,

R³ representa hidrogênio ou C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila em cada caso eventualmente substituída uma ou
 5 mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino,
 10 no, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₂-C₆-alcoxicarbonila, C₂-C₆-alquilcarbonila ou C₃-C₆-trialquilsilila

R³ além disso, representa C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila em cada caso eventualmente substituído uma ou
 15 mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de amino, C₃-C₆-cicloalquilamino ou um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros,

R³ do mesmo modo, além disso, representa C₃-C₁₂-cicloalquila, C₃-C₁₂-cicloalquil-C₁-C₆-alquila e C₄-C₁₂-bicicloalquila, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano,
 20 nitro, hidróxi, amino, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-cicloalquilamino, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila,
 25 C₂-C₆-alcoxicarbonila, C₂-C₆-alquilcarbonila, C₃-C₆-trialquilsilila ou um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros,

R² e R³ juntos podem estar ligados através de dois a seis átomos de carbono e formar um anel, que eventualmente contém adicionalmente um outro átomo de nitrogênio, enxofre ou oxigênio e que pode ser eventualmente substituído uma a quatro vezes com C₁-C₂-alquila, halogênio, ciano,
 30 amino ou C₁-C₂-alcóxi,

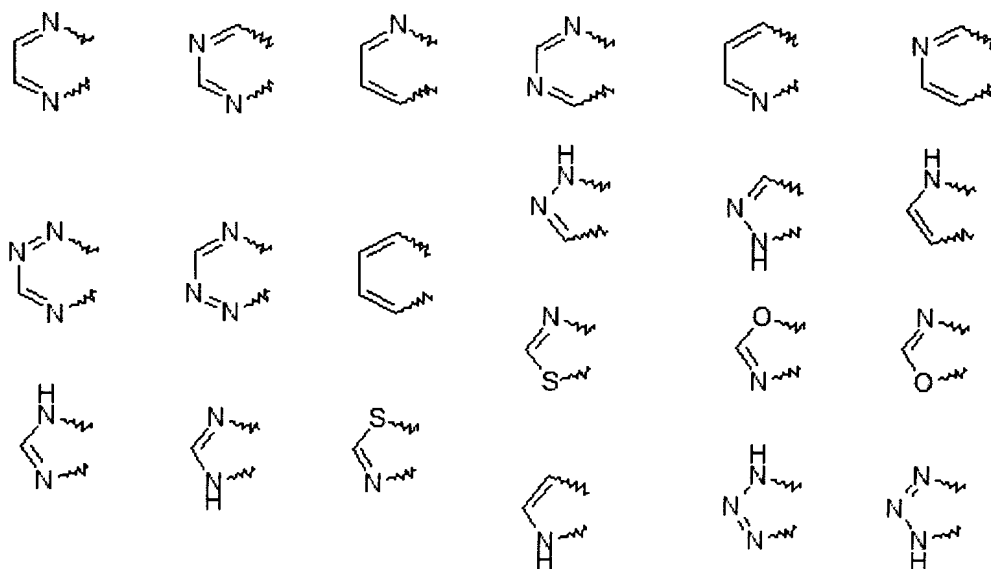
R², R³ além disso, juntos, representam =S(C₁-C₄-alquila)₂,

=S(O)(C₁-C₄-alquila)₂,

R⁴ representa hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-alquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, SF₅, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, (C₁-C₄-alcóxi)imino, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino, (C₁-C₄-haloalquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino ou C₃-C₆-trialquilsilila ou

dois R⁴, através de átomos de carbono adjacentes, formam um anel, que representa -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH=CH-)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-, -OCF₂O-, -(CF₂)₂O-, -O(CF₂)₂O-, -(CH=CH-CH=N)- ou -(CH=CH-N=CH)-,

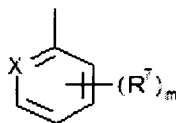
dois R⁴, além disso, através de átomos de carbono adjacentes, formam os seguintes anéis anelados, que são eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio(C₁-C₆-alquila), C₁-C₄-alquilsulfinil(C₁-C₆-alquila), C₁-C₄-alquilsulfonil(C₁-C₆-alquila), C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino ou C₃-C₆-cicloalquilamino,



n representa 0 a 3,

R^5 representa C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_1 - C_6 -halocicloalquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -haloalquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_2 - C_6 -haloalquinila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -haloalcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilsulfinila, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, halogênio, ciano, nitro ou C_3 - C_6 -trialquilsilila,

R^6 representa hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_2 - C_6 -haloalquenila ou



R^6 além disso, representa C_3 - C_6 -cicloalcóxi,

R^7 independente um do outro, representa hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_6 -haloalquila, halogênio, ciano, nitro, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -haloalcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio ou C_1 - C_4 -haloalquiltio,

m representa 0 a 4,

X representa N, CH, CF, CCl, CBr ou Cl,

A representa $-CH_2-$, $-CH_2O-$, $-CH_2OCH_2-$, $-CH_2S-$, $-CH_2SCH_2-$, $-CH_2N(C_1-C_6\text{-alquila})-$, $-CH_2N(C_1-C_6\text{-alquila})CH_2-$, $-CH[CO_2(C_1-C_6\text{-alquila})]-$, $-CH(CN)-$, $-CH(C_1-C_6\text{-alquila})-$, $-C(\text{di-}C_1-C_6\text{-alquila})-$, $-CH_2CH_2-$ ou $-C=NO(C_1-C_6\text{-alquila})-$,

Q representa um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros ou um sistema de anel heterobíclico anelado, aromático, com 8, 9 ou 10 membros, em que o anel ou o sistema de anel é eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente e em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_6 -haloalquila, C_2 - C_6 -haloalquenila, C_2 - C_6 -haloalquinila, C_3 - C_6 -halocicloalquila, halogênio, CN, CO_2H , CO_2NH_2 , NO_2 , OH, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -haloalcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilsulfinila, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, C_3 - C_6 -cicloalquilamino, $(C_1$ - C_6 -alquil)carbonila, $(C_1$ - C_6 -alcóxi)carbonila, $(C_1$ - C_6 -

alquil)aminocarbonila, di-(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila, tri-(C₁-C₂)alquilsilila, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino,

Q além disso, representa um anel heteroaromático ou heterocíclico com 5 ou 6 membros ou um sistema de anel heterobícíclico anelado, aromático com 8, 9 ou 10 membros, em que o anel ou o sistema de anel é eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente e em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, CO₂H, CO₂NH₂, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, (C₁-C₆-alquil)carbonila, (C₁-C₆-alcóxi)carbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di-(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila, tri-(C₁-C₂)alquilsilila, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino,

ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, sendo que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

os compostos da fórmula geral (I) compreendem, além disso, N-óxidos e sais.

Finalmente, foi descoberto, que os compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção, possuem propriedades inseticidas muito boas e podem ser usados tanto na proteção de plantas, quanto também na proteção de materiais para combater parasitas indesejáveis, tais como insetos.

Os compostos de acordo com a invenção, podem estar eventualmente presentes como misturas de várias formas isômeras possíveis, especialmente de estereoisômeros, tais como, por exemplo, isômeros E e Z, treo e eritro, bem como isômeros ópticos, mas eventualmente também de

tautômeros. Tanto os isômeros E, quanto também os isômeros Z, como também os isômeros treo e eritro, bem como os ópticos, misturas desejadas desses isômeros, bem como as possíveis formas tautômeras são reivindicados.

5 As antranilamidas de acordo com a invenção, são definidas de modo geral pela fórmula (I). Definições de radicais preferidos das fórmulas mencionadas acima e abaixo são mencionadas a seguir. Essas definições são válidas para os produtos finais da fórmula (I), como, do mesmo modo, para todos os produtos intermediários.

10 R^1 representa preferivelmente hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, C_3 - C_6 -cicloalquila, ciano(C_1 - C_6 -alquila), C_1 - C_6 -haloalquila, C_2 - C_6 -haloalquenila, C_2 - C_6 -haloalquinila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquiltio- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfinil- C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -alquilsulfonil- C_1 - C_4 -alquila.

15 R^1 representa de modo particularmente preferido hidrogênio, metila, ciclopropila, cianometila, metoximetila, metiltiometa, metilsulfinilmetila ou metilsulfonilmetila.

R^1 representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio.

20 R^2 representa preferivelmente hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila.

R^2 representa de modo particularmente preferido hidrogênio ou metila,

R^2 representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio.

25 R^3 representa preferivelmente hidrogênio ou C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -alcóxi, C_2 - C_6 -alquenila, C_2 - C_6 -alquinila, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -haloalcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -alquilsulfinila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, C_1 - C_4 -alquilsulfinimo,

30 C_1 - C_4 -alquilsulfinimo- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfinimo- C_2 - C_5 -alquilcarbonila, C_1 - C_4 -alquilsulfoximino, C_1 - C_4 -alquilsulfoximino- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfoximino- C_2 - C_5 -alquilcarbonila, C_2 - C_6 -alcoxicarbonila, C_2 - C_6 -

alquilcarbonila ou C₃-C₆-trialquilsilila,

R³ além disso, representa preferivelmente C₃-C₁₂-cicloalquila e C₄-C₁₀-bicicloalquila, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₂-C₆-alcoxicarbonila, C₂-C₆-alquilcarbonila ou C₃-C₆-trialquilsilila,

R³ representa de modo particularmente preferido hidrogênio ou C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi em cada caso eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₂-C₆-alcoxicarbonila, C₂-C₆-alquilcarbonila ou C₃-C₆-trialquilsilila,

R³ além disso, representa de modo particularmente preferido C₃-C₆-cicloalquila eventualmente substituída uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₂-C₆-alcoxicarbonila, C₂-C₆-alquilcarbonila ou C₃-C₆-trialquilsilila,

R³ representa de modo muito particularmente preferido C₁-C₄-alquila (metila, etila, n-propila, iso-propila, n-butila, iso-butila, sec-butila ou

terc-butila) ou ciano-C₁-C₃-alquila (cianometila, 1-cianometila, 2-cianoetila, 1-ciano-n-propila, 2-ciano-n-propila, 3-ciano-n-propila, 1-ciano-iso-propila, 2-ciano-iso-propila).

5 R³ representa de modo especialmente preferido metila, iso-propila ou cianometila.

R⁴ representa preferivelmente hidrogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, halogênio, ciano, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio ou C₁-C₄-haloalquiltio.

10 Além disso, preferivelmente dois radicais R⁴ adjacentes representam -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH=CH-)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-, -OCF₂O-, (CF₂)₂O-, -O(CF₂)₂O-, -(CH=CH-CH=N)- ou -(CH=CH-N=CH)-.

R⁴ representa de modo particularmente preferido hidrogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₂-haloalquila, halogênio, ciano ou C₁-C₂-haloalcóxi.

15 Além disso, de modo particularmente preferido, dois radicais R⁴ adjacentes representam -(CH₂)₄-, -(CH=CH-)₂-, -O(CH₂)₂O-, -O-(CF₂)₂O-, (CH=CH-CH=N)- ou -(CH=CH-N=CH)-

20 R⁴ representa de modo muito particularmente preferido hidrogênio, metila, trifluormetila, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo ou trifluormetóxi. Além disso, de modo muito particularmente preferido, dois radicais R⁴ adjacentes representam -(CH₂)₄- ou -(CH=CH-)₂-.

R⁴ representa de modo especialmente preferido cloro ou bromo.

R⁴ além disso, representa de modo especialmente preferido iodo ou ciano. Além disso, dois radicais R⁴ adjacentes representam de modo especialmente preferido -(CH=CH-)₂-.

25 R⁵ representa preferivelmente C₁-C₄-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₆-halocicloalquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₄-alquinila, C₂-C₄-haloalquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, halogênio, 30 ciano, nitro ou C₃-C₆-trialquilsilila.

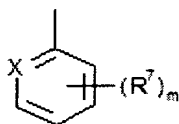
R⁵ representa de modo particularmente preferido C₁-C₄-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₆-halocicloalquila, C₂-C₆-alquenila,

C₂-C₄-haloalquenila, C₂-C₄-alquinila, C₂-C₄-haloalquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, nitro ou C₃-C₆-trialquilsilila.

R⁵ representa de modo muito particularmente preferido metila, flúor, cloro, bromo ou iodo.

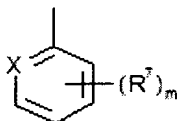
5 R⁵ representa de modo especialmente preferido metila ou cloro.

R⁶ representa preferivelmente C₁-C₆-alquila ou



R⁶ além disso, representa preferivelmente C₃-C₆-cicloalcóxi,

R⁶ representa de modo particularmente preferido metila ou



10 R⁷ independente um do outro, representa preferivelmente hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-haloalquilsulfonila ou (C₁-C₄-alquil)C₁-C₄-alcoxiimino,

R⁷ independente um do outro, representa de modo particularmente preferido hidrogênio, halogênio ou C₁-C₄-haloalquila,

15 R⁷ representa de modo muito particularmente preferido flúor, cloro ou bromo,

R⁷ representa de modo especialmente preferido cloro.

m representa preferivelmente 1, 2 ou 3,

m representa de modo particularmente preferido 1 ou 2,

m representa de modo muito particularmente preferido 1,

20 X representa preferivelmente N, CH, CF, CCl, CBr ou Cl,

X representa de modo particularmente preferido N, CH, CF, CCl ou CBr,

X representa de modo muito particularmente preferido N, CCl ou CH.

25 A representa preferivelmente -CH₂-, -CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -CH₂S-

, -CH₂SCH₂-, -CH₂N(C₁-C₆-alquila)-, -CH₂N(C₁-C₆-alquila)CH₂-, -CH(CN)-, -CH(C₁-C₆-alquila)-, -C(di-C₁-C₆-alquila)-, -CH₂CH₂-, -C=NO(C₁-C₆-alquila)-,

A representa de modo particularmente preferido -CH₂-, -CH(CH₃), C(CH₃)₂ ou CH₂CH₂,

5 A além disso, representa de modo particularmente preferido -CH(CN)-,

A representa de modo muito particularmente preferido CH₂ ou CH(CH₃),

A representa de modo especialmente preferido CH₂,

10 Q representa preferivelmente um anel heterocíclico aromático com 5 ou 6 membros eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-1 até Q-53 ou um sistema de anel heterobíclico anelado aromático com 9 membros Q-54 até Q-56, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, C₁-C₂-alcóxi, halogênio, ciano, hidróxi, nitro ou C₁-C₂-haloalcóxi.

15 Q além disso, representa preferivelmente um anel heterocíclico aromático com 5 ou 6 membros eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-1 até Q-53 e Q-54 até Q-59, um sistema de anel heterobíclico anelado aromático com 9 membros Q-54 até Q-56, bem com um anel heterocíclico com 5 membros Q-60 até Q-61, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, C₁-C₂-alcóxi, halogênio, ciano, hidróxi, nitro ou C₁-C₂-haloalcóxi,

20 ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, em que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

30 Q representa de modo particularmente preferido um anel heterocíclico aromático com 5 ou 6 membros eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-36 até Q-40 ou um sistema de anel heterobíclico

anelado aromático com 9 membros Q-54 até Q-56, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, C₁-C₂-alcóxi, halogênio, ciano, hidróxi, nitro ou C₁-C₂-haloalcóxi.

5 Q além disso, representa de modo particularmente preferido um anel heterocíclico aromático com 5 ou 6 membros eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-36 até Q-40 e Q-58 até Q-59, um sistema de anel heterobícíclico anelado aromático com 9 membros Q-54 até Q-56, bem como um anel heterocíclico com 5 membros Q-60 até Q-61, em que os substitu-
10 tuintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, C₁-C₂-alcóxi, halogênio, ciano, hidróxi, nitro ou C₁-C₂-haloalcóxi, ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, em que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos
15 uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

Q representa de modo muito particularmente preferido um anel
20 heterocíclico aromático eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-58 e Q-59, bem como um anel heterocíclico com 5 membros Q-60, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, C₁-C₂-alcóxi, halogênio, ciano, hidróxi, nitro ou C₁-C₂-haloalcóxi,

25 ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, em que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila,
30 C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

Q além disso, representa de modo muito particularmente preferi-

do um anel heterocíclico aromático eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-58 e Q-59, bem como um anel heterocíclico com 5 membros Q-60, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, halogênio, ciano, nitro ou C₁-C₂-haloalcóxi,

ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, em que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

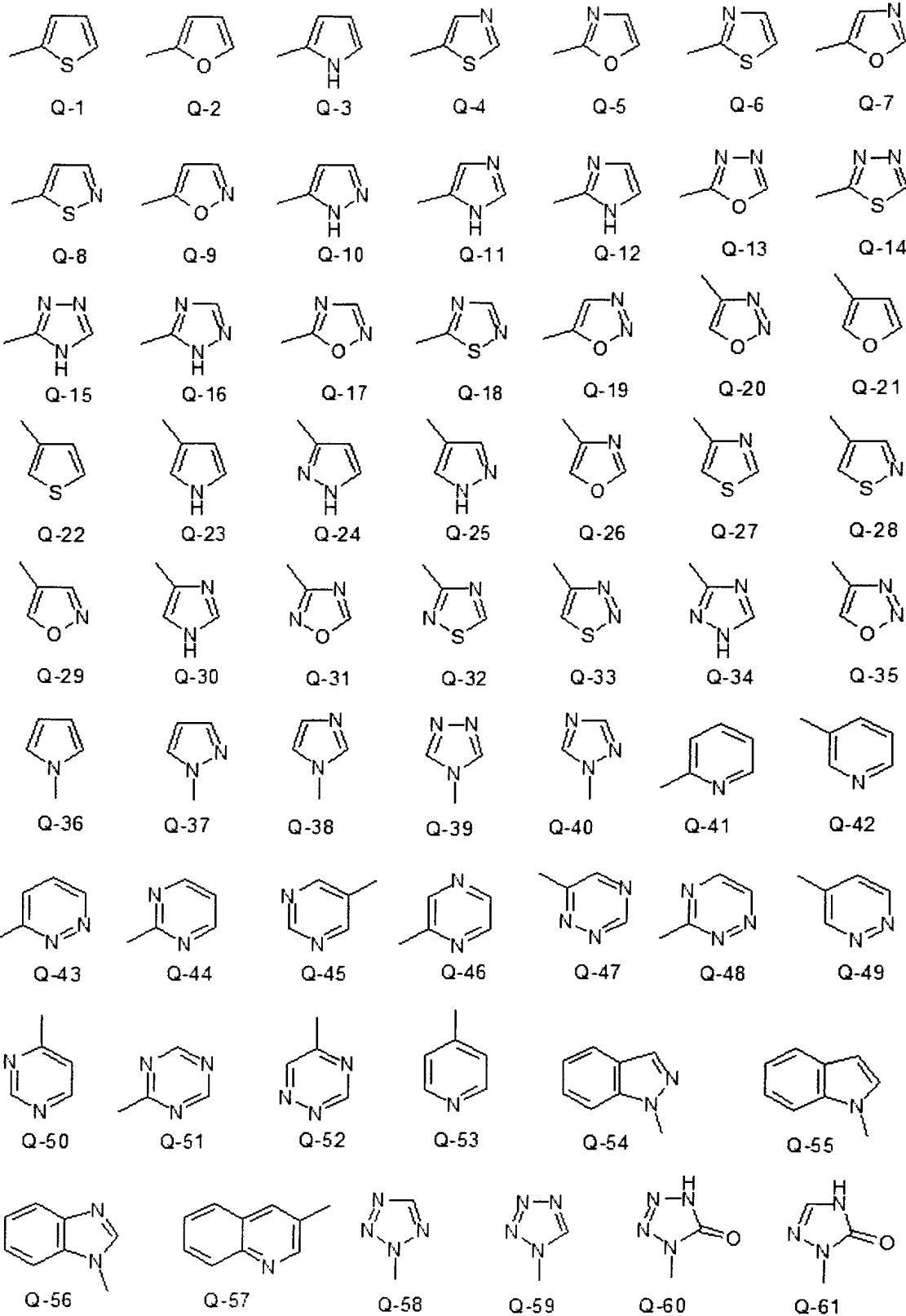
Q representa de modo especialmente preferido um anel heterocíclico aromático, eventualmente substituído uma, duas ou três vezes em átomos de carbono Q-37, Q-40, Q-58 e Q-59, bem como um anel heterocíclico com 5 membros Q-60, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de cloro, flúor, iodo, bromo, ciano, trifluormetila e pentafluoretila,

ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila, em que o anel fenila pode ser eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, C₁-C₄-haloalcóxi,

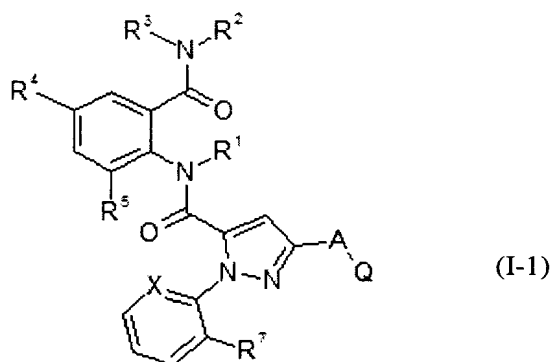
Q além disso, representa de modo especialmente preferido um anel heterocíclico aromático eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-37, Q-40, Q-58 e Q-59, bem como um anel heterocíclico com cinco membros Q-60, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de cloro, flúor, iodo, ciano, trifluormetila e pentafluoretila,

ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila, em que o anel fenila pode ser eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente com cloro, flúor, iodo,

bromo, ciano, trifluormetila e pentafluoretila,



É dada ênfase aos compostos da fórmula (I-1)



na qual R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, A, Q e X têm os significados gerais, preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos mencionados acima.

5 Radicais substituídos por halogênio, por exemplo, haloalquila, são halogenados uma ou mais vezes até o máximo número de substituintes possíveis. Na halogenação múltipla, os átomos de halogênio podem ser iguais ou diferentes. Neste caso, halogênio representa flúor, cloro, bromo ou iodo, representa especialmente flúor, cloro ou bromo.

10 Compostos preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos são os compostos, que portam em cada caso os substituintes mencionados como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos.

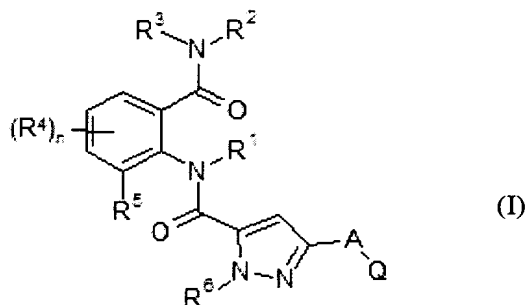
15 Radicais hidrocarboneto saturados ou insaturados, tais como alquila ou alquenila, também juntos com heteroátomos, tal como, por exemplo, no alcóxi, desde que possível, podem ser em cada caso em cadeia linear ou ramificada.

20 Radicais eventualmente substituídos podem ser substituídos uma ou mais vezes, sendo que nas substituições múltiplas os substituintes podem ser iguais ou diferentes.

25 As definições de radicais ou elucidações citadas geralmente acima ou em âmbitos preferenciais, contudo, também podem ser arbitrariamente combinadas entre si, isto é, entre os respectivos âmbitos e âmbitos preferenciais. Elas são válidas para os produtos finais, bem como de maneira correspondente para os pré-produtos e produtos intermediários.

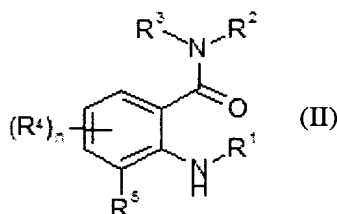
Além disso, foi verificado, que as antranilamidas da fórmula (I) são obtidas por um dos seguintes processos.

Antranilamidas da fórmula (I)

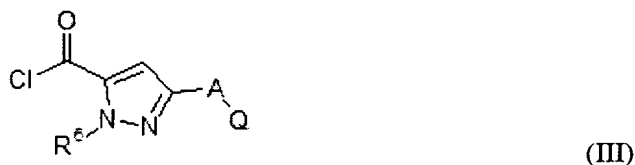


5 na qual A, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, Q e n têm os significados mencionados acima são obtidas

(A) reagindo anilinas da fórmula (II)

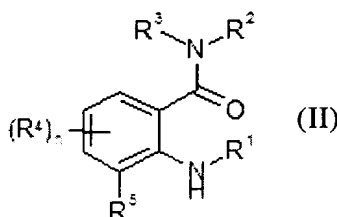


na qual A, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ e n têm os significados mencionados acima, com cloretos de ácido carboxílico da fórmula (III)



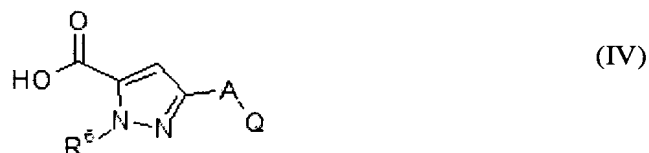
10 na qual R⁶, A e Q têm os significados mencionados acima, na presença de um agente ligante de ácido,

(B) reagindo anilinas da fórmula (II)



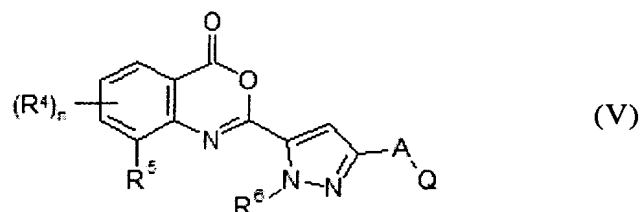
na qual A, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ e n têm os significados mencionados acima,

com um ácido carboxílico da fórmula (IV)

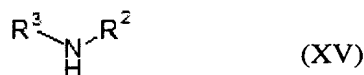


na qual R⁶, A e Q têm os significados mencionados acima, na presença de um agente de condensação ou em que

(C) para a síntese de antranilamidas da fórmula (I), na qual R¹ representa
5 hidrogênio, reagem-se benzoxazinonas da fórmula (V)



na qual R⁴, R⁵, R⁶, A, Q e n têm os significados mencionados acima, com uma amina da fórmula (XV)

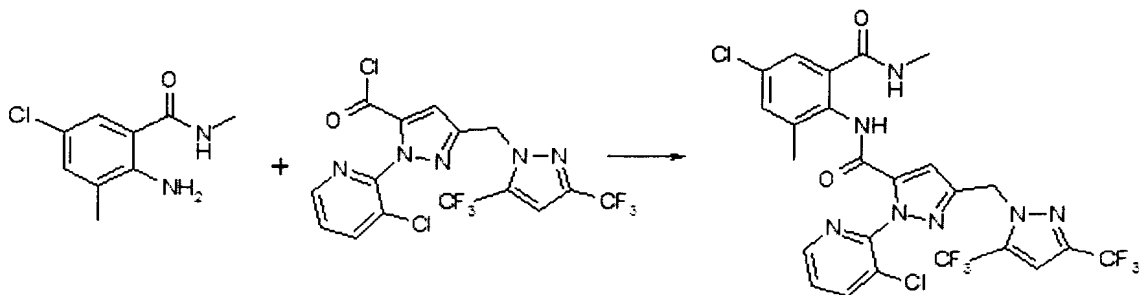


na qual R² e R³ têm os significados mencionados acima, na presença de um diluente.

10 Elucidação dos processos e produtos intermediários

Processo (A)

Utilizando-se, por exemplo, 2-amino-5-cloro-3-*N*-
dimetilbenzamida e cloreto de ácido 5-(3,5-bistrifluormetilpirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloropiridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico como materiais de partida, então
15 o decurso do processo (A) de acordo com a invenção, pode ser mostrado pelo seguinte esquema de fórmula.



As aminobenzamidas necessárias como materiais de partida na execução do processo (A) de acordo com a invenção, são definidas de modo geral pela fórmula (II). Nesta fórmula (II) A, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ e n representam preferentemente, de modo particularmente preferido, de modo muito particularmente preferido ou de modo especialmente preferido aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, como sendo preferidos, particularmente preferidos e outros, para esses radicais.

O processo (A) de acordo com a invenção, é efetuado na presença de um agente ligante de ácido. Para esse fim, são adequadas as bases inorgânicas ou orgânicas usuais para tais reações de copulação. Preferivelmente, são utilizáveis hidretos, hidróxidos, amidas, alcoolatos, acetatos, carbonatos ou bicarbonatos de metais alcalino-terrosos ou metais alcalinos, tais como, por exemplo, hidreto de sódio, amida de sódio, diisopropilamida de lítio, metilato de sódio, etilato de sódio, terc.-butilato de potássio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, acetato de sódio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio ou carbonato de amônio, bem como aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, diisopropiletilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbenzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diazabicycloundeceno (DBU). Do mesmo modo, eventualmente podem ser utilizados agentes ligantes de ácido protegidos por polímeros, tais como, por exemplo, diisopropilamida ligada ao polímero e dimetilaminopiridina ligada ao polímero.

O processo (A) de acordo com a invenção, pode ser eventualmente efetuado na presença de um diluente orgânico inerte usual para tais reações. Nesses incluem-se preferivelmente hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetraclorometano, dicloreto ou tri-

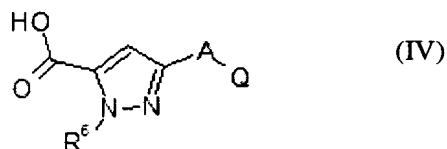
cloretano; éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-t-butílico, éter metil-t-amílico, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; cetonas, tais como acetona, butanona, metil-isobutilcetona ou ciclohexanona; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n- ou i-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida de ácido hexametilfosfórico; suas misturas com água ou água pura. Tolueno, tetrahydrofurano e N,N-dimetilformamida são utilizáveis de modo particularmente preferido.

As temperaturas de reação na execução do processo (A) de acordo com a invenção, podem variar em uma faixa mais ampla. Em geral, trabalha-se a temperaturas de 0°C até 150°C, preferivelmente a temperaturas de 20°C até 100°C.

O processo de acordo com a invenção, é geralmente efetuado sob pressão normal. Contudo, também é possível, efetuar o processo de acordo com a invenção, sob pressão elevada ou reduzida – em geral, entre 0,1 bar e 10 bar -.

Aminobenzamidas da fórmula (II) são conhecidas (compare, por exemplo, M. J. Kornet, *J. Heterocycl. Chem.* 1992, 29, 103-105; G. P. Lahm e outros, *Bioorg. Med. Chem. Letters* 2005, 15, 4898-4906; WO 2003/016284, WO 2006/062978).

Cloretos de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (III) são novos. Eles podem ser preparados, por exemplo, (D) reagindo derivados de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (IV)

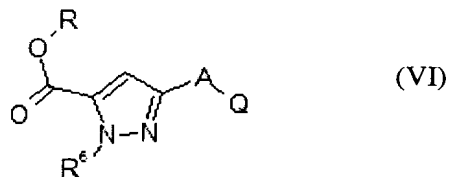


na qual A, Q e R⁶ têm os significados mencionados acima, com um agente de cloração (por exemplo, cloreto de tionila e cloreto de oxalila) na presença de um diluente inerte (por exemplo, tolueno e diclorometano) na presença de uma quantidade catalítica de N,N-dimetilformamida.

Derivados de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (IV) são novos.

Eles podem ser preparados, por exemplo,

(E) reagindo ésteres de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (VI)



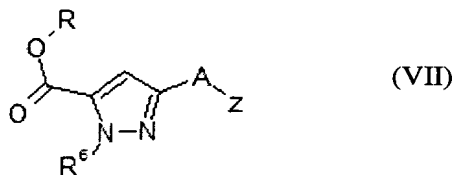
na qual A, Q e R⁶ têm os significados mencionados acima e R representa C₁-C₆-alquila,

- 5 com um hidróxido de metal alcalino (por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio) na presença de um diluente inerte (por exemplo, dioxano/água ou etanol/água).

Ésteres de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (VI) são novos.

Eles podem ser preparados, por exemplo,

- 10 (F) reagindo derivados de éster de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (VII)



na qual A, Q e R⁶ têm os significados mencionados acima e Z representa cloro, bromo, iodo, metilsulfonila ou toluenossulfonila, com um composto heteroaromático da fórmula (VIII) ou com um ácido borônico ou um éster de ácido borônico da fórmula (IX), na qual R' representa H, CH₃, C₂H₅ ou R'-R' representa C(CH₃)₂C(CH₃)₂ e Q tem os significados mencionados acima, na presença de um metal de transição (por exemplo, tetraquis(trifenilfosfin)paládio(0)) e de uma base (por exemplo, carbonato de potássio ou carbonato de sódio) na presença de um solvente (por exemplo, tetrahydrofurano, acetonitrila ou dioxano).

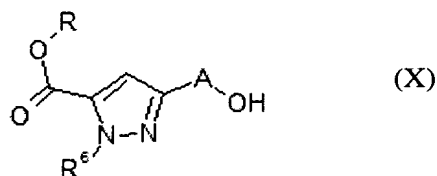


- 20 Compostos heteroaromáticos e heterociclos da fórmula (VIII) são conhecidos, em parte, mesmo, comercialmente disponíveis ou podem ser obtidos por processos conhecidos (compare, por exemplo, H. V. Dias e ou-

tros, *Organometallics* 1996, 15, 5374-5379; M. D. Threadgill e outros, *J. Fluorine Chem.* 1993, 65, 21-23; M. Abdul-Ghani e outros, *J. Fluorine Chem.* 1990, 48, 149-152; T. Kitazaki, *Chem. Pharm. Bull.* 1996, 44, 314-327; DE 1995-19504627; WO 2004080984, WO 2005095351).

5 Ácidos borônicos heterocíclicos ou boronatos da fórmula (IX) são conhecidos, em parte, mesmo comercialmente disponíveis ou podem ser obtidos por processos conhecidos (compare, por exemplo, W. Li, D.P. Nelson, M.S. Jensen, R.S. Hoerrner, D. Cai, R.D. Larsen, P.J. Reider, *J. Org. Chem.* 2002, 67, 5394-5397).

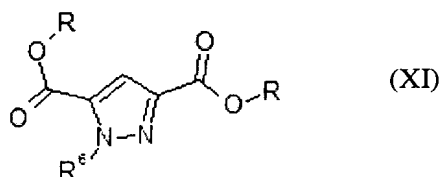
10 Derivados de éster de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (VII) podem ser preparados, por exemplo, (G) reagindo álcoois da fórmula (X)



na qual R, R⁶ e A têm os significados mencionados acima, com um cloreto de sulfonila (por exemplo, cloreto de ácido metilsulfônico ou cloreto de ácido toluenossulfônico) ou com um agente de halogenação (por exemplo, cloreto de tionila) eventualmente na presença de um solvente (por exemplo, diclorometano) e eventualmente na presença de uma base (por exemplo, trietilamina ou piridina).

20 As temperaturas de reação na execução do processo (G) de acordo com a invenção, podem variar em uma faixa mais ampla. Em geral, trabalha-se a temperaturas de 0°C a 150°C, preferivelmente a temperaturas de 0°C a 60°C.

Álcoois da fórmula (X) podem ser preparados, por exemplo, (H) reagindo ésteres de ácido pirazoldicarboxílico da fórmula (XI)

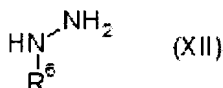


na qual R e R⁶ têm os significados mencionados acima, com um agente de redução (por exemplo, hidreto de lítioalumínio ou hidreto de diisobutilalumínio) na presença de um solvente (por exemplo, tetrahidrofurano ou éter dietílico).

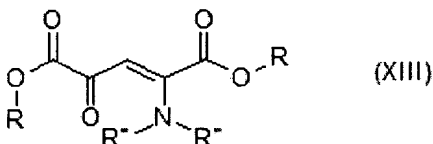
5 As temperaturas de reação na execução do processo (H) de acordo com a invenção, podem variar em uma faixa mais ampla. Em geral, trabalha-se a temperaturas de -100°C a 20°C, preferivelmente a temperaturas de -78°C a 0°C.

Ésteres de ácido pirazoldicarboxílico da fórmula (XI) podem ser preparados, por exemplo,

(I) reagindo hidrazinas ou seus sais correspondentes da fórmula (XII)



na qual R⁶ tem o significado mencionado acima, com uma tricetona (XIII) da fórmula (XIII)



na qual R tem o significado mencionado acima e R'' representa metila ou etila ou R''-R'' representa (CH₂)₄ ou (CH₂)₂O(CH₂)₂, na presença de um solvente (por exemplo, metanol ou etanol).

Hidrazinas ou seus sais correspondentes da fórmula (XII) são conhecidas, em parte, comercialmente disponíveis ou podem ser preparadas por métodos de síntese gerais (compare, por exemplo, *Advanced Organic Chemistry*, quarta edição, Jerry March, John Wiley & Sons, Inc. Nova York, 1992, página 1288).

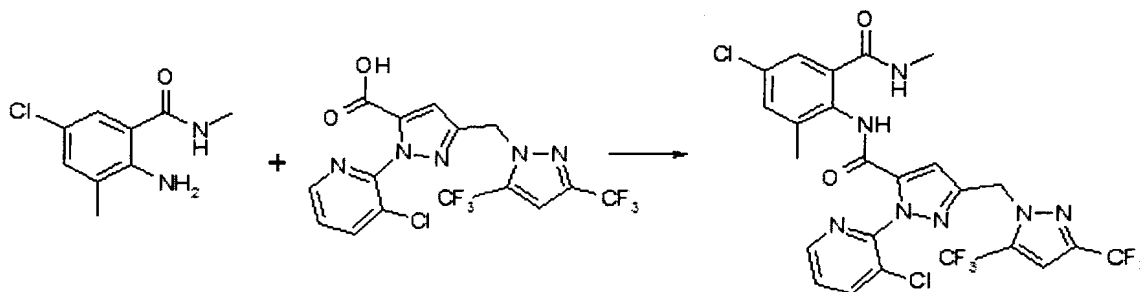
Tricetonas da fórmula (XIII) são conhecidas e podem ser preparadas por métodos de síntese gerais (compare por exemplo, Cvetovich, Raymond J.; Pipik, Brenda; Hartner, Frederick W.; Grabowski, Edward J. J.; *Tetrahedron Lett* 2003, 44, 5867 – 5870).

As temperaturas de reação na execução do processo (I) de a-

cordo com a invenção, podem variar em uma faixa mais ampla. Em geral, trabalha-se a temperaturas de 0°C até 80°C, preferivelmente a temperaturas de 40°C até 60°C.

Processo (B)

- 5 Utilizando, por exemplo, 2-amino-5-cloro-3,*N*-dimetil-benzamida e ácido 5-(3,5-bis-trifluormetil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2*H*-pirazol-3-carboxílico como materiais de partida, então o decurso do processo (B) de acordo com a invenção, pode ser mostrado pelo seguinte esquema de fórmula.



- 10 As antranilamidas da fórmula (II) necessárias como materiais de partida na execução do processo (B) de acordo com a invenção, já foram descritas no contexto com o processo (A) de acordo com a invenção.

- Os ácidos carboxílicos heterocíclicos necessários, além disso, como materiais de partida na execução do processo (B) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (IV). Nesta fórmula (IV), R^6 , A e Q representam preferivelmente, de modo particularmente preferido, de modo muito particularmente preferido ou especialmente preferido aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, como sendo preferidos, particularmente preferidos e outros para esses radicais.
- 15
- 20

- O processo (B) de acordo com a invenção, é efetuado na presença de um agente de condensação. Para esse fim, são adequados todos os agentes usuais para tais reações de copulação. Por exemplo, sejam mencionados formadores de halogeneto de ácido, tais como fosgênio, tri-brometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, oxicloreto de fósforo ou cloreto de tionila, formadores de anidrido, tais como éster etíli-
- 25

co de ácido clorofórmico, éster metílico de ácido clorofórmico, éster isopropílico de ácido clorofórmico, éster isobutílico de ácido clorofórmico ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidas, tais como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) ou outros agentes de condensação usuais, tais como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, 1,1'-carbonildiimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloro de carbono, hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfônio, cloreto de bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfina ou hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloitris(dimetilamino)-fosfônio. Reagentes apoiados em polímeros, tal como, por exemplo, ciclohexilcarbodiimida ligado ao polímero, também podem ser usados.

O processo (B) de acordo com a invenção, é eventualmente efetuado na presença de um catalisador. Por exemplo, sejam mencionados 4-dimetilaminopiridina, 1-hidróxi-benzotriazol ou dimetilformamida.

O processo (B) de acordo com a invenção, pode ser eventualmente efetuado na presença de um diluente orgânico inerte usual para tais reações. Nesses incluem-se, preferivelmente, hidrocarbonetos alifáticos, alícíclicos ou aromáticos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetraclorometano, dicloreto ou tricloreto; éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-t-butílico, éter metil-t-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dietoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; cetonas, tais como acetona, butanona, metil-isobutilcetona ou ciclohexanona; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n- ou i-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida de ácido hexametilfosfórico; suas misturas com água ou água pura. O diclorometano e N,N-dimetilformamida são utilizáveis de modo particularmente preferido.

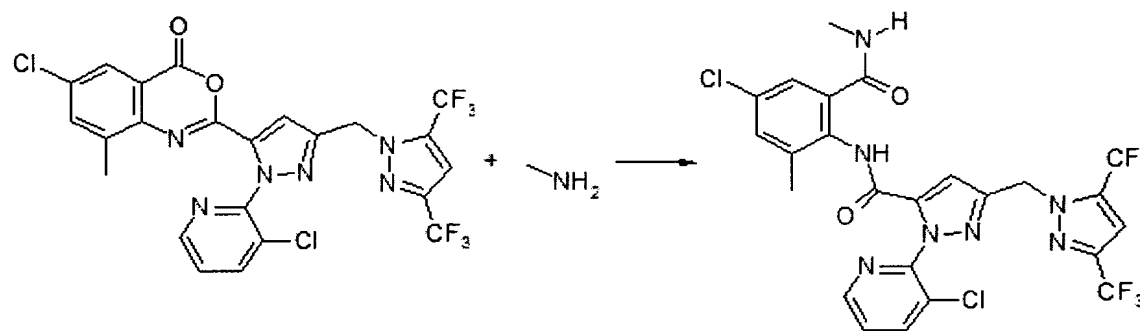
As temperaturas de reação na execução do processo (B) de acordo com a invenção, podem variar em uma faixa mais ampla. Em geral,

trabalha-se a temperaturas de 0°C até 150°C, preferivelmente a temperaturas de 0°C até 80°C.

O processo de acordo com a invenção, é geralmente efetuado sob pressão normal. Contudo, também é possível, efetuar o processo de acordo com a invenção, sob pressão elevada ou reduzida – em geral, entre

5 Processo (C)

Utilizando 2-[3-[[3,5-bis(trifluormetil)-1H-pirazol-1-il]metil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]-6-cloro-8-metil-4H-3,1-benzoxazin-4-ona e metilamina, então o decurso do processo (C) de acordo com a invenção,

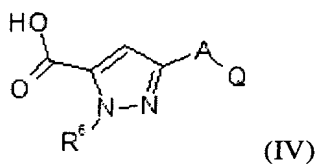


As benzoxazinas necessárias como materiais de partida na execução do processo (C) de acordo com a invenção, são definidas de modo geral pela fórmula (V). Nessa fórmula (V), R⁴, R⁵, R⁶, A, Q e n representam

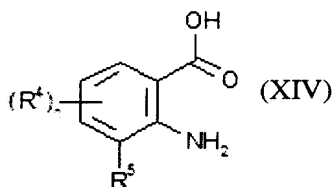
15 preferivelmente, de modo particularmente preferido, de modo muito particularmente preferido ou especialmente preferido aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, como sendo preferidos, particularmente preferidos e outros para esses radicais.

20 Benzoxazinonas da fórmula (V) são novas. Elas são obtidas, por exemplo,

(J) reagindo derivados de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (IV)



na qual R⁶, A e Q têm os significados mencionados acima, com ácidos antranílicos da fórmula (XIV)



na qual R⁴, R⁵ e n têm os significados mencionados acima, na presença de uma base (por exemplo, trietilamina ou piridina) e na presença de um cloreto de ácido sulfônico (por exemplo, cloreto de ácido metanossulfônico), bem como eventualmente na presença de um diluente (por exemplo, acetonitrila).

Os derivados de ácido pirazolcarboxílico necessários como materiais de partida na execução do processo (J) de acordo com a invenção, já foram descritos acima no contexto com o processo (A) de acordo com a invenção.

Os ácidos antranílicos além disso necessários como materiais de partida na execução do processo (J), são definidos de modo geral pela fórmula (XIV). Nessa fórmula (XIV), R⁴, R⁵ e n representam preferivelmente, de modo particularmente preferido, de modo muito particularmente preferido ou especialmente preferido aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, como sendo preferidos, particularmente preferidos e outros para esses radicais.

Ácidos antranílicos da fórmula (XIV) são conhecidos e podem ser preparados por métodos de síntese gerais (compare, por exemplo, Baker e outros, *J. Org. Chem.* 1952, 149-153; G. Reissenweber e outros, *Angew. Chem.* 1981, 93, 914-915, P. J. Montoya-Pelaez, *J. Org. Chem.* 2006, 71, 5921-5929; F. E. Sheibley, *J. Org. Chem.* 1983, 3, 414-423, WO 2006023783).

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

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

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

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

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

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

Da ordem dos Coleoptera, por exemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus spp.*, *Agelastica alni*, *Agriotes spp.*, *Amphimallon solstitialis*,
 30 *Anobium punctatum*, *Anoplophora spp.*, *Anthonomus spp.*, *Anthrenus spp.*, *Apogonia spp.*, *Atomaria spp.*, *Attagenus spp.*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus*

spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

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

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

30 Da classe dos helmintos, por exemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliense*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp.

lus filaria, Diphyllbothrium latum, Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrongylus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis
 5 *spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp., Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Strongyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudopsiralis, Trichostrongylus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.*

10 Além disso, é possível combater os protozoários, tais como Eimeria.

Da ordem dos Heteroptera, por exemplo, *Anasa tristis, Antestiopsis spp., Blissus spp., Calocoris spp., Campylomma livida, Cavelerius spp., Cimex spp., Creontiades dilutus, Dasynus piperis, Dichelops furcatus,*
 15 *Diconocoris hewetti, Dysdercus spp., Euschistus spp., Eurygaster spp., Heliopeletis spp., Horcias nobilellus, Leptocorisa spp., Leptoglossus phyllopus, Lygus spp., Macropes excavatus, Miridae, Nezara spp., Oebalus spp., Pentomidae, Piesma quadrata, Piezodorus spp., Psallus seriatus, Pseudacysta persea, Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophora spp., Stephant*
 20 *tis nashi, Tibraca spp., Triatoma spp.*

Da ordem dos Homoptera, por exemplo, *Acyrtosipon spp., Aeneolamia spp., Agonosцена spp., Aleurodes spp., Aleurolobus barodensis, Aleurothrixus spp., Amrasca spp., Anuraphis cardui, Aonidiella spp., Aphanostigma piri, Aphis spp., Arboridia apicalis, Aspidiella spp., Aspidiotus spp.,*
 25 *Atanus spp., Aulacorthum solani, Bemisia spp., Brachycaudus helichrysii, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carneoccephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Cocco-mytilus halli, Coccus*
 30 *spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Doralis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus,*

Geococcus coffeae, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya*
spp., *Idiocerus spp.*, *Idioscopus spp.*, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium spp.*,
Lepidosaphes spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum spp.*, *Mahanarva fimbri-*
lata, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella spp.*, *Metopolophium dirhodum*, *Mo-*
5 *nellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus spp.*, *Nasonovia ribisnigri*, *Ne-*
photettix spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia spp.*, *Orthezia praelonga*,
Parabemisia myricae, *Paratrioza spp.*, *Parlatoria spp.*, *Pemphigus spp.*, *Pe-*
regrinus maidis, *Phenacoccus spp.*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon hu-*
muli, *Phylloxera spp.*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus spp.*, *Proto-*
10 *pulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus spp.*, *Psyl-*
la spp., *Pteromalus spp.*, *Pyrilla spp.*, *Quadraspidotus spp.*, *Quesada gigas*,
Rastrococcus spp., *Rhopalosiphum spp.*, *Saissetia spp.*, *Scaphoides titanus*,
Schizaphis graminum, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata spp.*, *Sogatella furci-*
fera, *Sogatodes spp.*, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tino-*
15 *callis caryaefoliae*, *Tomaspis spp.*, *Toxoptera spp.*, *Trialeurodes vaporario-*
rum, *Trioza spp.*, *Typhlocyba spp.*, *Unaspis spp.*, *Viteus vitifolii*.

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

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

Da ordem dos *Isoptera*, por exemplo, *Reticulitermes spp.*, *Odonototermes spp.*.

Da ordem dos *Lepidoptera*, por exemplo, *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*,
Agrotis spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia spp.*, *Barathra bras-*
25 *sicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua*
reticulana, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo spp.*, *Choris-*
toneura fumiferana, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus spp.*, *Earias insulana*,
Ephestia kuehniella, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Galleria*
mellonella, *Helicoverpa spp.*, *Heliothis spp.*, *Hofmannophila pseudospretella*,
30 *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma spp.*, *Lithocolletis*
blancardella, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria spp.*,
Malacosoma neustria, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna sepa-*

rata, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.

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

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

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

Da ordem dos *Thysanoptera*, por exemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

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

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

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

As substâncias ativas podem ser convertidas para as formulações comuns, tais como soluções, emulsões, pós de pulverização, suspensões à base de água e óleo, pós, pós de pulverização, pastas, pós solúveis, granulados solúveis, granulados de espalhamento, concentrados de suspensão-emulsão, substâncias naturais impregnadas de substância ativa, substâncias sintéticas impregnadas de substância ativa, adubos, bem como encapsulamentos finíssimos em substâncias polímeras.

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

Como coadjuvantes podem ser usadas aquelas substâncias, que são adequadas, para emprestar propriedades particulares à própria composição ou e/ou às preparações derivadas da mesma (por exemplo, caldos de pulverização, desinfetantes de sementes), tais como certas propriedades técnicas e/ou também propriedades biológicas particulares. Como coadjuvantes típicos tomam-se em consideração: diluentes, solventes e excipientes.

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

No caso da utilização de água como diluente, por exemplo, solventes orgânicos também podem ser usados como solventes auxiliares. Como solventes líquidos tomam-se essencialmente em consideração: compostos aromáticos, tais como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, compostos

aromáticos clorados e hidrocarbonetos alifáticos clorados, tais como cloro-benzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno, hidrocarbonetos alifáticos, tais como ciclohexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, óleos minerais e vegetais, álcoois, tais como butanol ou glicol, bem como seus
5 éteres e ésteres, cetonas, tais como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona ou ciclohexanona, solventes fortemente polares, tal como dimetilsulfóxido, bem como água.

Como excipientes sólidos tomam-se em consideração:
por exemplo, sais de amônio e pós de pedras naturais, tais como caulim,
10 argilas, talco, giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terra de infusórios e pós de pedras sintéticas, tais como ácido silícico altamente disperso, óxido de alumínio e silicatos, como excipientes sólidos para granulados tomam-se em consideração: por exemplo, pedras naturais quebradas e fracionadas, tais como calcita, mármore, pedra-pomes, sepiolita, dolomita bem como gra-
15 nulados sintéticos de farinhas inorgânicas e orgânicas bem como granulados de material orgânico, tais como papel, serragem, cascas de coco, espigas de milho e caules de tabaco; como emulsificantes e/ou agentes produtores de espuma tomam-se em consideração: por exemplo, emulsificantes não ionogênicos e aniônicos, tais como éster de ácido polioxietileno-graxo, éter de
20 álcool polietileno-graxo, por exemplo, éter alquilarilpoliglicólico, sulfonatos de alquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de arila bem como hidrolisados de albumina; como agentes de dispersão tomam-se em consideração: substâncias não iônicas e/ou iônicas, por exemplo, das classes dos éteres de álcool-
25 POE e/ou éteres POP, ésteres de ácidos e/ou POP-POE, éteres alquil-arílicos e/ou POP-POE, produtos de adição de lipídios e/ou POP-POE, derivados de POE e/ou POP-poliol, produtos de adição de POE e/ou POP-sorbitano ou açúcar, sulfatos de alquila ou arila, sulfonatos e fosfatos ou os produtos de adição de PO-éteres correspondentes. Além disso, oligômeros e polímeros adequados, por exemplo, partindo de monômeros vinílicos, de
30 ácido acrílico, de EO e/ou PO sozinhos ou em combinação, por exemplo, com (poli-) álcoois ou (poli-) aminas. Além disso, podem ser usados a lignina e seus derivados de ácido sulfônico, celuloses simples e modificadas, ácidos

sulfônicos aromáticos e/ou alifáticos, bem como seus produtos de adição com formaldeído.

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

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

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

20 Além disso, podem estar contidos estabilizadores, tais como estabilizadores a frio, conservantes, agentes de proteção contra oxidação, agentes de proteção solar ou outros agentes químicos e/ou físicos que melhoram a estabilidade.

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

25 A substância ativa de acordo com a invenção, pode estar presente em suas formulações comerciais usuais, bem como nas formas de aplicação preparadas a partir dessas formulações em mistura com outras substâncias ativas, tais como inseticidas, engodos, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, substâncias reguladoras do crescimento, herbicidas, protetores, adubos ou produtos semi-químicos.

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

Fungicidas:

Inibidores da síntese do ácido nucléico

- benalaxil, benalaxil-M, bupirimat, quiralexil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico
- Inibidores da mitose e divisão celular
- 5 benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metila, zoxamida
- Inibidores do complexo da cadeia respiratória I
- diflumetorim
- Inibidores do complexo da cadeia respiratória II
- 10 boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxin, pentiopirad, tifulzamida
- Inibidores do complexo da cadeia respiratória III
- azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadon, fenamidon, fluoxastrobin, kresoxim-metila, metominostrobin, orisastrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin
- 15 Desacopladores
- dinocap, fluazinam
- Inibidores da produção de ATP
- acetato de fentina, cloreto de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam
- Inibidores da biossíntese de aminoácido e proteína
- 20 andoprim, blasticidin-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrato do cloridrato de kasugamicina, mepanipirim, pirimetanil
- Inibidores da transdução de sinal
- fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen
- Inibidores da síntese de lipídios e membrana
- 25 clozolinat, iprodion, procimidon, vinclozolin, ampropilfos, potássio-ampropilfos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotiolan, pirazofos, tolclofos-metila, bifenila, iodocarb, propamocarb, cloridrato de propamocarb
- Inibidores da biossíntese do ergosterol
- fenexamida, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobu-
- 30

- trazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforin, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf,
- 5 dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, spiroxamina, naftifin, piributicarb, terbinafin.
- Inibidores da síntese da parede celular
- bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxins, polioxorim, validamicina A
- 10 Inibidores da biossíntese de melanina
- capropamida, diclocimet, fenoxanil, ftalid, piroquilon, triciclazol
- Indução de resistência
- acibenzolar-S-metila, probenazol, tiadinil
- Multisite
- 15 captafol, captan, clorotalonil, sais de cobre, tais como: hidróxido de cobre, naffenato de cobre, oxiclureto de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxin-cobre e mistura de Bordeaux, diclofluanid, ditianon, dodin, base livre de dodin, ferbam, folpet, fluorofolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadin, iminoctadinalbesilato, triacetato de iminoctadin, mancobre, mancozeb,
- 20 maneb, metiram, metiram zinco, propineb, enxofre e preparados de enxofre contendo polissulfeto de cálcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram.
- Mecanismo desconhecido
- amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvon, quinometionato, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, di-
- 25 clorofeno, dicloran, difenzoquat, sulfato de difenzoquat metila, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metassulfocarb, metrafenon, metil isotiocianato, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropila, octilnon, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol
- 30 e sais, 2-fenilfenol e sais, piperalina, propanosin-sódio, proquinazida, pirrolnitrina, quintozen, tecloftalam, tecnazen, triazóxido, triclamida, zarilamida e 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-

benzenossulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridinocarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metóxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluormetil)-fenil]-etiliden]-amino]-óxi]-metil]-fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metila, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinodicarbonitrila, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)-imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetilen)-benzacetato de metila, 4-cloro-alfa-propinilóxi-N-[2-[3-metóxi-4-(2-propinilóxi)fenil]etil]-benzacetamida, (2S)-N-[2-4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorfenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorfenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorfenil) [1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-{(Z)-[(ciclopropilmetóxi)-imino][6-(difluormetóxi)-2,3-difluorfenil]metil}-2-benzacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidróxi-benzamida, 2-[[[1-[3(1-fluor-2-feniletíl)óxi] fenil] etiliden]amino]óxi]metil]-alfa-(metoximino)-N-metil-alfaE-benzacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluormetil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluormetil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorbifenil-2-il)-3-(difluormetil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-metóxi-3-piridinil)-ciclopropan carboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotióico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenóxi)-5-fluorpirimidin-4-il]óxi]fenil)-2-(metoximino)-N-metilacetamida.

Bactericidas:

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilnon, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

Inseticidas/acaricidas/nematicidas:

Inibidores de acetilcolinesterase (AChE)

carbamatos,

por exemplo, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, cloetocarb, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metam-sódio, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, trimetacarb, XMC, xililcarb, triazamate

Organofosfatos,

por exemplo, acefato, azametifos, azinfos (-metila, -etila), bromofos-etila, bromofenvinfos (-metila), butatíofos, cadusafos, carbofenotion, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metila/-etila), coumafos, cianofenos, cianofos, clorfenvinfos, demeton-S-metila, demeton-S-metilsulfona, dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, dioxabenzofos, dissulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotion, fensulfotion, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilan, fostiazato, heptenofos, iodofenos, iprobenfos, isazofos, isofenos, O-salicilato de isopropila, isoxation, malation, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metila, paration (-metila/-etila), fentoato, forato, fosalon, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metila/-etila), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclofos, piridafention, piridation, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion.

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

Piretróides,

por exemplo, acrinatrin, aletrin (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrin, bifentrin, bioaletrin, isômero de bioaletrin-S-ciclopentila, bioetanometrin, biopermetrin, bioresmetrin, clovaportrin, cis-cipermetrin, cis-resmetrin, cis-permetrin, clodotrin, cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cipermetrin (alfa, beta, teta, zeta), cifenotrin, deltametrin, empentrin (isômero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrin, fenpropatrin, fenpiritrin, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufen-

- prox, flumetrin, fluvalinato, fubfenprox, gama-cihalotrin, imiprotrin, kadetrin, lambda-cihalotrin, metoflutrín, permetrin (cis-, trans-), fenotrin (isômero 1R-trans), praletrin, proflutrín, protrifenbuto, piresmetrin, resmetrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinate, teflutrín, teraletrin, tetrametrin (isômero 1R), tra-
- 5 lometrin, transflutrín, ZXI 8901, piretrins (piretrum)
- DDT
- Oxadiazinas,
- por exemplo, indoxacarb,
- Semicarbazonas,
- 10 por exemplo, metaflumizona (BAS 3201)
- Agonistas/antagonistas do receptor acetilcolina
- cloronicotinilas,
- por exemplo, acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid, tiametoxam.
- 15 Nicotina, bensultap, cartap
- Moduladores do receptor acetilcolina
- spinosina,
- por exemplo, spinosad.
- Antagonistas do canal de cloreto regulado por GABA
- 20 organoclorinas,
- por exemplo, camfeclor, clordano, endosulfan, gama-HCH, HCH, heptacloro, lindano, metoxiclor
- Fipróis
- por exemplo, acetoprol, etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol, vaniliprol
- 25 Ativadores do canal de cloreto
- mectinas,
- por exemplo, abamectina, emamectina, benzoatos de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemicina.
- Miméticos do hormônio juvenil,
- 30 por exemplo, diofenolan, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifen, tripreno.
- Agonistas/disruptores de ecdison

diacil-hidrazinas,

por exemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida

Inibidores da biossíntese de quitina

benzoiluréias,

- 5 por exemplo, bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloخورon, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron

Buprofezina

Ciromazina.

- 10 buprofezina
ciromazina

Inibidores da fosforilação oxidativa, disruptores de ATP

diafentiuron

Compostos organoestanho,

- 15 por exemplo, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina

Desacopladores da fosforilação oxidativa mediante interrupção do gradiente do próton H

pirróis,

por exemplo, clorfenapir

- 20 Dinitrofenóis,
por exemplo, binapacril, dinobuton, dinocap, DNOC

Inibidores do transporte de elétrons do lado I

METI'S,

por exemplo, fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad,

- 25 tolfenpirad

Hidrametilnon

Dicofol

Inibidores do transporte de elétrons do lado II

rotenona

- 30 Inibidores do transporte de elétrons do lado III
acequinocil, fluaciripirim

Disruptores microbianos da membrana intestinal de insetos

- cepas de *Bacillus thuringiensis*
 Inibidores da síntese de lipídios
 ácidos tetrônicos,
 por exemplo, spirodiclofen, spiromesifen
- 5 Ácidos tetrâmicos,
 por exemplo, spirotetramato, cis-3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidróxi-8-metóxi-1-azaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona
 carboxamidas,
 por exemplo, flonicamid
- 10 Agonistas octopaminérgicos,
 por exemplo, amitraz
 Inibidores da ATPase estimulada pelo magnésio,
 por exemplo, propargite
 Análogos de nereistoxina
- 15 por exemplo, hidrogeno oxalato de tiociclâm, tiossultap-sódio
 Agonistas do receptor rianodina,
 dicarboxamidas de ácido benzóico,
 por exemplo, flubendiamida
 antranilamidas,
- 20 por exemplo, rinaxapir (3-bromo-N-{4-cloro-2-metil-6-
 [(metilamino)carbonil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida)
 Biológicos, hormônios ou feromônios
azadiractin, Bacillus spec., Beauveria spec., Codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., Thuringiensin, Verticillium spec.
- 25 Substâncias ativas com mecanismos de ação desconhecidos ou não específicos
 Agentes de gaseificação,
 por exemplo, fosfetos de alumínio, brometos de metila, fluoretos de sulfurila
 Inibidores de devoração,
- 30 por exemplo, criolita, flonicamid, pimetrozina
 Inibidores do crescimento de ácaros,
 por exemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox

amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezin, quinometionato, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrin, clotiazoben, ciclopreno, cifluometofeno, diciclanil, fenoxacrim, fentrifanil, flubenzimina, flufenerim, flutenzin, Gossylplure, hidrametilnona, japonilure, metoxadiazinona, petróleo, butóxido de piperonila, oleato de potássio, piridalil, sulfluramid, tetradifon, tetrasul, triaratene, verbutin.

Também é possível uma mistura com outras substâncias ativas conhecidas, tais como herbicidas, adubos, reguladores do crescimento, protetores, produtos semi-químicos ou também com agentes para melhorar as características próprias das plantas.

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

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

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

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

De acordo com a invenção, todas as plantas e partes das plan-

tas podem ser tratadas. Neste caso, entendem-se por plantas, todas as plantas e populações de plantas, como plantas selvagens ou plantas cultivadas desejáveis e indesejáveis (inclusive plantas cultivadas de origem natural). Plantas cultivadas podem ser plantas, obtidas por métodos de cultivo e otimização convencionais ou por métodos biotecnológicos e genéticos ou combinações destes métodos, inclusive das plantas transgênicas e inclusive das espécies de plantas protegíveis ou não protegíveis por leis de proteção de espécie. Por partes de plantas devem ser entendidas todas as partes aéreas e subterrâneas e órgãos das plantas, tais como broto, folha, flor e raiz, sendo enumerados por exemplo, folhas, espinhos, caules, troncos, flores, corpo do fruto, frutos e sementes, bem como raízes, tubérculos e rizomas. Nas partes das plantas incluem-se também material de colheita bem como material de crescimento vegetativo e generativo, por exemplo, estacas, tubérculos, rizomas, tanchões e sementes.

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

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

De modo particularmente preferido, plantas das espécies de

plantas em cada caso disponíveis no comércio ou que estão em uso são tratadas de acordo com a invenção. Por espécies de plantas entendem-se plantas com novas propriedades ("traits"), que foram cultivadas tanto através de cultivo convencional, através de mutagênese ou por técnicas de DNA re-

5 combinantes. Essas podem ser espécies, biótipos e genótipos.

Dependendo dos tipos de plantas ou das espécies de plantas, seu local e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, nutrição) podem ocorrer também efeitos superaditivos ("sinérgicos") através do tratamento de acordo com a invenção. Dessa maneira, por exemplo,

10 são possíveis quantidades de aplicação reduzidas e/ou aumentos do espectro de ação e/ou um reforço do efeito das substâncias e composições aplicáveis de acordo com a invenção, melhor crescimento das plantas, alta tolerância contra altas ou baixas temperaturas, alta tolerância contra seca ou contra teor de sal na água ou no solo, alto poder de florescência, colheita

15 facilitada, aceleração do amadurecimento, maior rendimento da colheita, maior qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior capacidade de armazenagem e/ou capacidade de beneficiamento dos produtos colhidos, que excedem os efeitos a serem propriamente esperados.

As plantas ou espécies de plantas transgênicas (obtidas através

20 de engenharia genética) que devem ser preferivelmente tratadas de acordo com a invenção, incluem todas as plantas, que em virtude da modificação genética, receberam material genético, que conferem propriedades ("traits") valiosas particularmente vantajosas a essas plantas. Exemplos de tais propriedades são melhor crescimento da planta, alta tolerância contra altas ou

25 baixas temperaturas, alta tolerância contra seca ou contra teor de sal na água ou solo, alto poder de florescência, colheita facilitada, aceleração do amadurecimento, maior rendimentos da colheita, maior qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior capacidade de armazenagem e/ou capacidade de beneficiamento dos produtos colhidos. Outros exemplos

30 e particularmente destacados de tais propriedades são uma alta defesa das plantas contra parasitas animais e microbianos, tais como contra insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e/ou vírus, bem como uma alta to-

lerância das plantas contra determinadas substâncias ativas herbicidas. Como exemplos de plantas transgênicas mencionam-se as plantas cultivadas importantes, tais como cereais (trigo, arroz), milho, soja, batata, beterrabas sacarinas, tomates, ervilhas e outras espécies de hortaliças, algodão, tabaco, colza, bem como plantas frutíferas (com os frutos maçã, pêra, frutos cítricos e uvas), destacando-se particularmente o milho, soja, batata, algodão, tabaco e colza. Como propriedades ("traits") destacam-se particularmente a alta defesa das plantas contra insetos, aracnídeos, nematódios e caracóis devido as toxinas formadas nas plantas, especialmente aquelas, que são produzidas nas plantas pelo material genético de *Bacillus Thuringiensis* (por exemplo, pelos genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF, bem como suas combinações) (a seguir, "plantas BT"). Como propriedades ("traits") destacam-se particularmente também a alta defesa das plantas contra fungos, bactérias e vírus através da resistência sistêmica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores, bem como genes de resistência e proteínas e toxinas expressadas de maneira correspondente. Como propriedades ("traits") destacam-se, além disso, particularmente a alta tolerância das plantas contra determinadas substâncias ativas herbicidas, por exemplo, imidazolinonas, sulfoniluréias, glifosato ou fosfinotricina (por exemplo, gene "PAT"). Os genes que conferem as propriedades desejadas em questão, também podem ocorrer em combinações uns com os outros nas plantas transgênicas. Como exemplos de "plantas Bt", sejam mencionadas espécies de milho, espécies de algodão, espécies de soja e espécies de batata, que são vendidas sob os nomes comerciais YIELD GARD® (por exemplo, milho, algodão, soja), KnockOut® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), Nucoton® (algodão) e NewLeaf® (batata). Como exemplos de plantas tolerantes aos herbicidas mencionam-se espécies de milho, espécies de algodão e espécies de soja, que são vendidas sob os nomes comerciais Roundup Ready® (tolerância contra glifosato, por exemplo, milho, algodão, soja), Liberty Link® (tolerância contra fosfinotricina, por exemplo, colza), IMI® (tolerância contra imidazolinonas) e STS® (tolerância contra sulfoniluréias, por exemplo, mi-

lho). Como plantas resistentes aos herbicidas (cultivadas convencionalmente para tolerância aos herbicidas) sejam mencionadas também as espécies vendidas sob o nome Clearfield® (por exemplo, milho). Naturalmente, estas informações valem também para as espécies de plantas a serem desenvolvidas no futuro ou que chegarão futuramente no mercado com estas propriedades genéticas ou a serem futuramente desenvolvidas ("traits").

As plantas listadas podem ser tratadas de maneira particularmente vantajosa de acordo com a invenção, com os compostos da fórmula geral I ou com as misturas de substâncias ativas de acordo com a invenção.

As escalas preferidas indicadas acima para as substâncias ativas ou misturas, valem também para o tratamento dessas plantas. Destaque particular é dado ao tratamento de plantas com os compostos ou misturas especialmente listados no presente texto.

As substâncias ativas de acordo com a invenção, não agem somente contra parasitas de plantas, higiene e alimentos armazenados, mas sim, também no setor de medicina veterinária contra parasitas animais (ecto- e endoparasitas), tais como carrapatos de couraça, carrapatos do couro, sarnas, ácaros corredores, moscas (picadoras e lambedoras), larvas de moscas parasitárias, piolhos, lêndeas, lêndeas de penas e pulgas. Esses parasitas incluem:

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

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

Da ordem dos *Diptera* e das subordens *Nematocerina* bem como *Brachycerina*, por exemplo, *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Cal-*

liphora spp., *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*, *Melophagus spp.*.

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

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

Da ordem dos *Blattarida*, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella spp.*.

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

15 Da ordem dos *Actinedida* (*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.*,
20 *Notoedres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, *Laminosioptes spp.*.

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

A aplicação das substâncias ativas de acordo com a invenção, no setor veterinário e na pecuária é efetuada de maneira conhecida através de administração entérica na forma, por exemplo, de comprimidos, cápsulas, bebidas, drenos, granulados, pastas, bolos, do processo "feed-through", de 5 sunitórios, através de administração parenteral, tal como, por exemplo, por injeções (intramuscular, subcutânea, intravenosa, intraperitoneal e outros), implantes, através da aplicação nasal, através da aplicação dérmica na forma, por exemplo, da imersão ou banho (mergulho), pulverização ("spray"), infusão ("pour-on e spot-on"), da lavagem, do polvilhamento bem como com 10 auxílio de artigos moldados contendo substância ativa, tais como coleira, marcas nas orelhas, marcas nas caudas, faixas articulares, cabrestos, dispositivos de marcação e outros.

Para a aplicação no gado, aves, animais domésticos e outros, as substâncias ativas da fórmula (I) podem ser empregadas como formulações 15 (por exemplo, pós, emulsões, agentes escoáveis), que contêm as substâncias ativas em uma quantidade de 1 até 80 %, em peso, diretamente ou após a diluição de 100 até 10.000 vezes ou elas podem ser aplicadas como banho químico.

Além disso, foi verificado que os compostos de acordo com a 20 invenção, mostram um alto efeito contra insetos, que destroem materiais técnicos.

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

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

30 *Himenópteros*, tais como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Térmites tais como, *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*.

- 5 Traças tal como *Lepisma saccharina*.

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

- 10 As composições prontas para o uso podem conter eventualmente ainda outros inseticidas e eventualmente ainda um ou mais fungicidas.

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

- 15 Ao mesmo tempo, os compostos de acordo com a invenção, podem ser usados para a proteção contra incrustações de objetos, especialmente de corpos de navios, peneiras, redes, edifícios, ancoradouros e sinaleiras, os quais entram em contato com água do mar ou água salobre.

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

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

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

Da ordem dos *Acarina*, por exemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Orni-*

thodorus moubat, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

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

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

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

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

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

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

15 Da ordem dos *Blattaria*, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

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

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

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

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

25 Da ordem dos *Coleoptera*, por exemplo, *Anthrenus spp.*, *Attage-nus spp.*, *Dermestes spp.*, *Latheticus oryzae*, *Necrobia spp.*, *Ptinus spp.*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus ze-amais*, *Stegobium paniceum*.

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

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

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

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

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

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

15 A aplicação no âmbito dos inseticidas domésticos é efetuada isoladamente ou em combinação com outras substâncias ativas adequadas, tais como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretróides, neonicotinóides, reguladores do crescimento ou substâncias ativas de outras classes de inseticidas conhecidos.

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

Os seguintes exemplos de preparação e utilização ilustram a invenção, sem limitá-la.

Exemplos de preparação

30 Exemplo 1

(4-cloro-2-metil-6-metilcarbamoil-fenil)-amida de ácido 5-(3,5-bis-trifluormetil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico (1-1-1):

300 mg (509 μ mol) de 2-[5-(3,5-bis-trifluormetil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metil-benzo[d][1,3]oxazin-4-ona são previamente introduzidos em 3,3 ml de tetrahydrofurano e 764 μ l (1,53 mmol) de uma solução 2 M de metilamina é acrescentada às gotas em tetrahydrofurano. Agita-se por 1 hora a 50°C, após resfriar remove-se o solvente no vácuo e purifica-se o resíduo em sílica-gel (ciclohexano/acetato de etila = 2 : 1 \rightarrow 1 : 1).

Rendimento: 200 mg (logP: 3,67).

De maneira análoga ao exemplo (I-1-) mostrado acima, bem como à descrição geral, obtêm-se os seguintes compostos da fórmula (I-1).

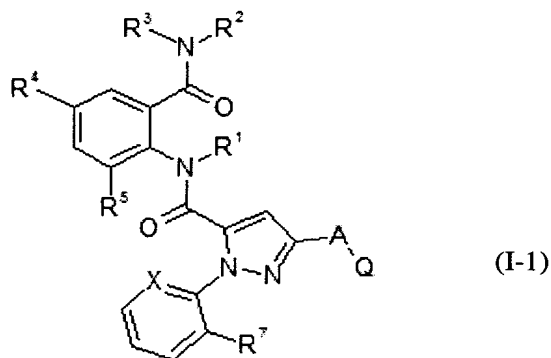
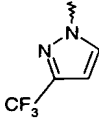
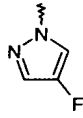
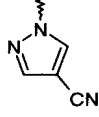

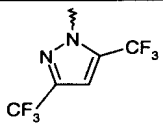
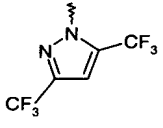
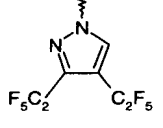
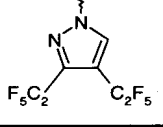
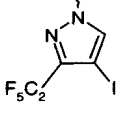
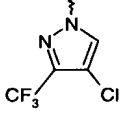
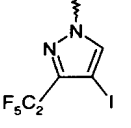
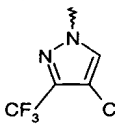
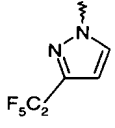
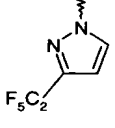
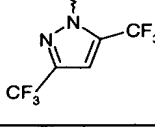
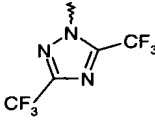
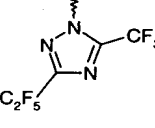
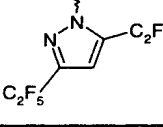
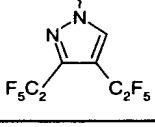
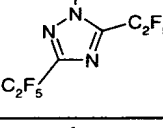
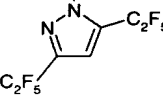


Tabela 1

N ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R ⁷	logP
I-1-2	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,08
I-1-3	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,39
I-1-4	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,54
I-1-5	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,88

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-6	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,27
I-1-7	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,70
I-1-8	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,57
I-1-9	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,45
I-1-10	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		CH	Cl	4,70
I-1-11	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		CH	Cl	4,12
I-1-12	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,89
I-1-13	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,98
I-1-14	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,29
I-1-15	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,85
I-1-16	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,79

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-17	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,35
I-1-18	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,75
I-1-19	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,29
I-1-20	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,16
I-1-21	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,02
I-1-22	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,91
I-1-23	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,25
I-1-24	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,49
I-1-25	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,39
I-1-26	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,17
I-1-27	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,45

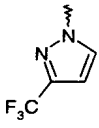
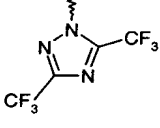
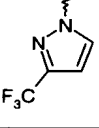
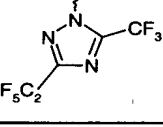
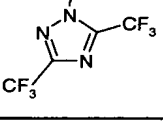
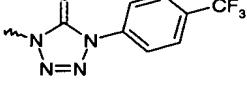
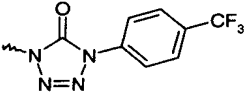
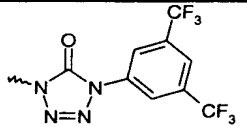
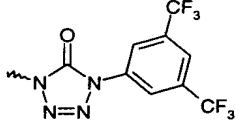
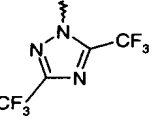
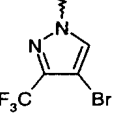
Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-28	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,63
I-1-29	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,64
I-1-30	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,77
I-1-31	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,21
I-1-32	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,70
I-1-33	H	H	CH ₂ CN	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,28
I-1-34	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,80
I-1-35	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,43
I-1-36	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,52
I-1-37	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,73
I-1-38	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,28

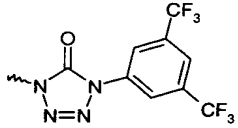
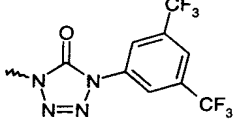
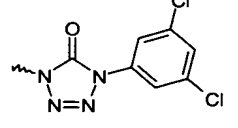
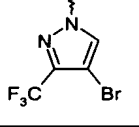
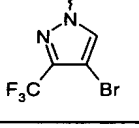
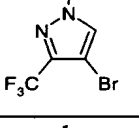
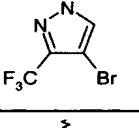
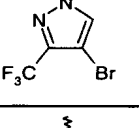
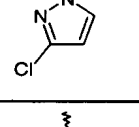
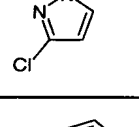
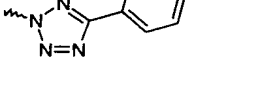
Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-39	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,31
I-1-40	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		CCl	Cl	4,58
I-1-41	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		CCl	Cl	4,13
I-1-42	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,76
I-1-43	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,20
I-1-44	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,92
I-1-45	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,67
I-1-46	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,58
I-1-47	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,31
I-1-48	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,15
I-1-49	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,97

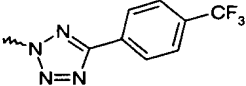
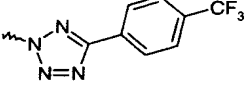
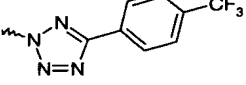
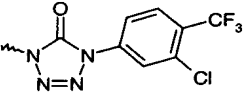
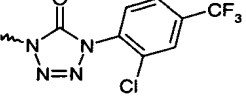
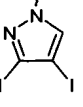
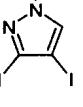
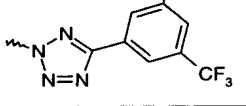
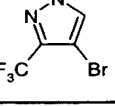
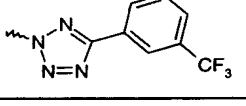
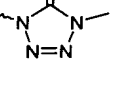
N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-50	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,88
I-1-51	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,52
I-1-52	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,59
I-1-53	H	H	H	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,17
I-1-54	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,61
I-1-55	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,40
I-1-56	H	H	CH ₂ CN	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,44
I-1-57	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,67
I-1-58	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,76
I-1-59	H	H	CH ₂ CN	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,65
I-1-60	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,91

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-61	H	H	H	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,53
I-1-62	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,41
I-1-63	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,85
I-1-64	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,21
I-1-65	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,67
I-1-66	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,38
I-1-67	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,78
I-1-68	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,46
I-1-69	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,92
I-1-70	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,94
I-1-71	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,40

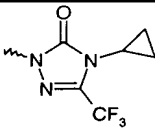
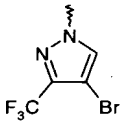
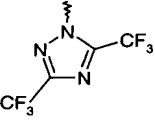
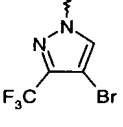
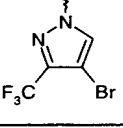
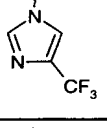
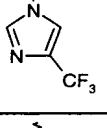
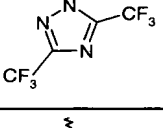
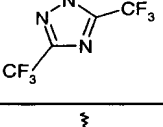
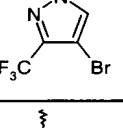
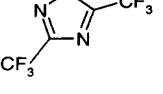
N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-72	H	H	<i>c</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,14
I-1-73	H	H	CH ₂ CN	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,87
I-1-74	H	H	H	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,68
I-1-75	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,04
I-1-76	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,49
I-1-77	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ O(C=O)NHC ₂ H ₅)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,58
I-1-78	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ O(C=O)NHCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,36
I-1-79	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,62
I-1-80	H	H	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,99
I-1-81	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,46
I-1-82	H	H	<i>c</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,18

N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-83	H	H	H	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,75
I-1-84	H	H	(S)-CH(CH ₂ SCH ₃)	H	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,62
I-1-85	H	H	CH ₂ CN	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,98
I-1-86	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,78
I-1-87	H	H	(S)-CH(CH ₂ SO ₂ CH ₃)	H	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,92
I-1-88	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,61
I-1-89	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,96
I-1-90	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,08
I-1-91	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,51
I-1-92	H	H	(S)-CH(CH ₂ SOCH ₃)	H	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,65
I-1-93	H	H	<i>c</i> -Pr	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,69

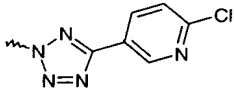
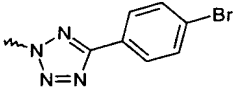
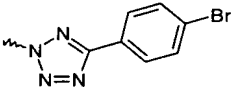
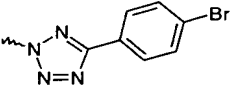
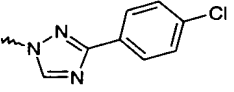
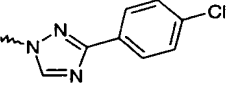
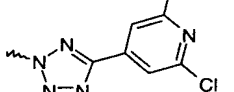
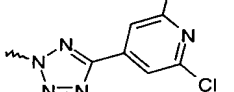
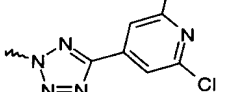
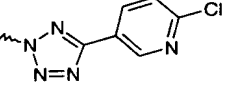
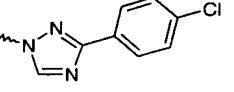
N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-94	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,85
I-1-95	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,01
I-1-96	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,90
I-1-97	H	H	CH ₂ CN	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,45
I-1-98	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,47
I-1-99	H	H	(S)-CH(CH ₃) CH ₂ SCH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,10
I-1-100	H	H	H	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,24
I-1-101	H	H	(S)-CH(CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,32
I-1-102	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,51
I-1-103	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,96
I-1-104	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,79

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-105	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,14
I-1-106	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,46
I-1-107	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,65
I-1-108	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,90
I-1-109	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,51
I-1-110	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,13
I-1-111	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,58
I-1-112	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,28
I-1-113	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SOCH ₃)	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,97
I-1-114	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,03
I-1-115	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,31

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-116	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,44
I-1-117	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,85
I-1-118	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,10
I-1-119	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,54
I-1-120	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ SO(=N)CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,75
I-1-121	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,57
I-1-122	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,51
I-1-123	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,92
I-1-124	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,13
I-1-125	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,56
I-1-126	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,18

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-127	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,74
I-1-128	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,25
I-1-129	H	H	(S)-CH(CH ₃) CH ₂ SO ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,27
I-1-130	H	H	(S)-CH(CH ₃) CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,11
I-1-131	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,48
I-1-132	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,39
I-1-133	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,77
I-1-134	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SCH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,63
I-1-135	H	H	(S)-CH(CH ₃) CH ₂ SCH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,24
I-1-136	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,23
I-1-137	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,22

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-138	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SOCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,91
I-1-139	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,50
I-1-140	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SOCH ₃)	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,05
I-1-141	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SO ₂ CH	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,26
I-1-142	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,67
I-1-143	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,20
I-1-144	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SOCH ₃	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,38
I-1-145	H	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ SO ₂ CH	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,56
I-1-146	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SO ₂ CH	Br	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,36
I-1-147	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SOCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,95
I-1-148	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,91

N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-149	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,41
I-1-150	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,70
I-1-151	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,20
I-1-152	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,41
I-1-153	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,07
I-1-154	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,56
I-1-155	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,69
I-1-156	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,17
I-1-157	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,36
I-1-158	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,67
I-1-159	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,78

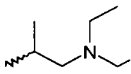
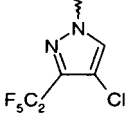
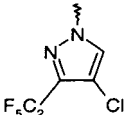
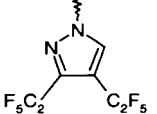
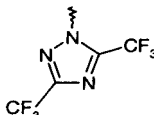
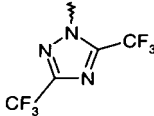
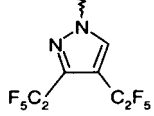
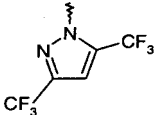
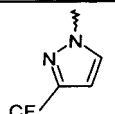
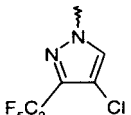
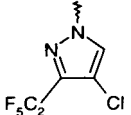
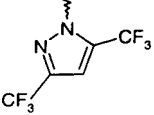
N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-160	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,39
I-1-161	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,87
I-1-162	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,10
I-1-163	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,15
I-1-164	H	H	NH[S(=O) ₂ N(CH ₃) ₂]	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,35
I-1-165	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,09
I-1-166	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,60
I-1-167	H	=S(<i>i</i> -Pr) ₂		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,44
I-1-168	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,79
I-1-169	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,55
I-1-170	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,08

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R ⁷	logP
I-1-171	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,44
I-1-172	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,87
I-1-173	H	H	<i>o</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,59
I-1-174	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,20
I-1-175	H	H	CH ₂ CN	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,40
I-1-176	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,11
I-1-177	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,53
I-1-178	H	H	<i>o</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,31
I-1-179	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,91
I-1-180	H	H	CH ₂ CN	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,11
I-1-181	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,57

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-182	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,96
I-1-183	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,75
I-1-184	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,42
I-1-185	H	H	CH ₂ CN	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,62
I-1-186	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,35
I-1-187	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,80
I-1-188	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,56
I-1-189	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,15
I-1-190	H	H	CH ₂ CN	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,28
I-1-191	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,29
I-1-192	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,91

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-193	H	H	CH ₂ CN	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,04
I-1-194	H			CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2.18
I-1-195	H	H	(S)-CH(CH ₂ SCH ₃)	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,13
I-1-196	H	H		F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,90
I-1-197	H	H		CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,50
I-1-198	H	H		CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,11
I-1-199	H	H		F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,55
I-1-200	H			F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2.19
I-1-201	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,21
I-1-202	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,30
I-1-203	H	H		F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,14

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-204	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SO ₂ CH	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,34
I-1-205	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,88
I-1-206	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,41
I-1-207	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,37
I-1-208	H	H		CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,90
I-1-209	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SCH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,05
I-1-210	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SO ₂ CH	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,34
I-1-211	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SOCH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,02
I-1-212	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SOCH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,25
I-1-213	H	H	(S)-CH(CH CH ₂ SO ₂ CH	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,60
I-1-214	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,77

N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-215	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,62
I-1-216	H	H	(S)-CH(CH ₂ SOCH ₃)	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,03
I-1-217	H	H	<i>i</i> Pr	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,47
I-1-218	H	H	<i>i</i> Pr	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,55
I-1-219	H	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,12
I-1-220	H	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,06
I-1-221	H	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,32
I-1-222	H	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,58
I-1-223	H	H	CH ₃	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,47
I-1-224	H	H	<i>i</i> Pr	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,89
I-1-225	H	H	<i>i</i> Pr	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,77


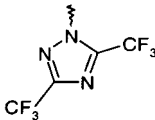

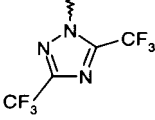
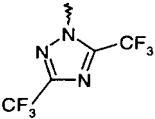

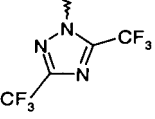

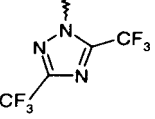

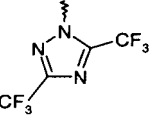

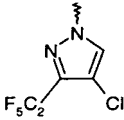

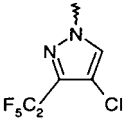

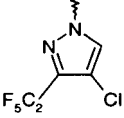
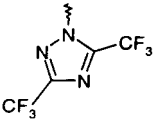
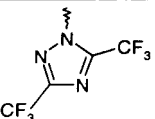
Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-226	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,00
I-1-227	H	H	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,87
I-1-228	H	H	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,06
I-1-229	H	H	<i>n</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,33
I-1-230	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,29
I-1-231	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,01
I-1-232	H	H	CH ₂ CF ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	5,28
I-1-233	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,55
I-1-234	H	H	H	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,56
I-1-235	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,34
I-1-236	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,80

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-237	H	H	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,60
I-1-238	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,06
I-1-239	H	H	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,51
I-1-240	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,96
I-1-241	H	H	CH ₂ CN	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,73
I-1-242	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,40
I-1-243	H	H	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,96
I-1-244	H	H	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,83
I-1-245	H	H	CH ₂ CN	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,53
I-1-246	H	H	CH ₂ CN	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,85
I-1-247	H	H	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,05

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-248	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,51
I-1-249	H	H	<i>o</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,27
I-1-250	H	H	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,28
I-1-251	H	H	CH ₂ CN	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,04
I-1-252	H	H	<i>o</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,81
I-1-253	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,13
I-1-254	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,47
I-1-255	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,60
I-1-256	H	CH ₃	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,84
I-1-257	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,92
I-1-258	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,32

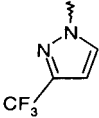
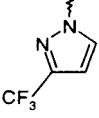







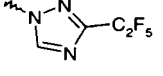
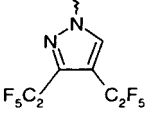
Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-259	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,27
I-1-260	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,12
I-1-261	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,08
I-1-262	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,31
I-1-263	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,13
I-1-264	H	H		Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,39
I-1-265	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	1,94
I-1-266	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,99
I-1-267	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,67
I-1-268	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,44
I-1-269	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,4

N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R ⁷	logP
I-1-270	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,95
I-1-271	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,17
I-1-272	H	H	H	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,38
I-1-273	H	H	H	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,84
I-1-274	H	H	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,74
I-1-275	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,71
I-1-276	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,15
I-1-277	H	H	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,17
I-1-278	H	H	CH ₃	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,25
I-1-279	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,47
I-1-280	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	6,56

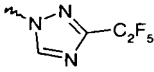
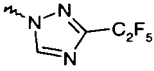
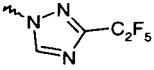
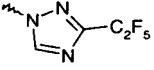
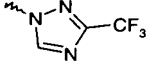
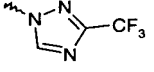
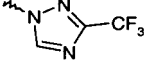
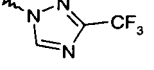
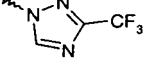
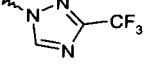
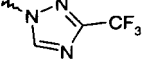
N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-281	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,54
I-1-282	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,18
I-1-283	H	H	C ₂ H ₅	I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,89
I-1-284	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,16
I-1-285	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,23
I-1-286	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,52
I-1-287	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,69
I-1-288	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,79
I-1-289	H	H		I	CH ₃	CH ₂		N	Cl	4,63
I-1-290	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,40
I-1-291	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,76

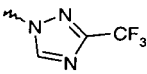
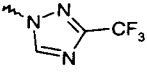
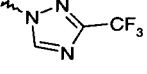
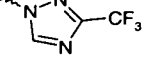
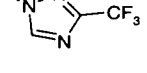
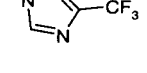
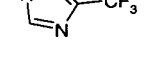
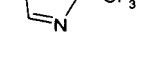
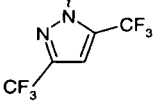
N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-292	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,83
I-1-293	H	H		Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,22
I-1-294	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	4,00
I-1-295	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,95
I-1-296	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,43
I-1-297	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,59
I-1-298	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,61
I-1-299	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,53
I-1-300	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,19
I-1-301	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,60
I-1-302	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,80

N ^o	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-303	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,98
I-1-304	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,01
I-1-305	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,40
I-1-306	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,18
I-1-307	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,95
I-1-308	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,18
I-1-309	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,53
I-1-310	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,13
I-1-311	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,21
I-1-312	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,37
I-1-313	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,43

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-314	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,77
I-1-315	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,54
I-1-316	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	1,03
I-1-317	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	1,31
I-1-318	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	1,62
I-1-319	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,02
I-1-320	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	1,49
I-1-321	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	1,41
I-1-322	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	1,94
I-1-323	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	3,01
I-1-324	H	H	(<i>S</i>)-CH(CH ₂ SCH ₃)	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	*

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-325	H	H	(S)-CH(CH ₂ SOCH ₃)	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,54
I-1-326	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,55
I-1-327	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,97
I-1-328	H	H	(S)-CH(CH ₂ SO ₂ CH ₃)	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	3,63
I-1-329	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,57
I-1-330	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,39
I-1-331	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,78
I-1-332	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,59
I-1-333	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,25
I-1-334	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,66
I-1-335	H	H	<i>o</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,69

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-336	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,32
I-1-337	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,56
I-1-338	H	H	<i>c</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,45
I-1-339	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,11
I-1-340	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,55
I-1-341	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,63
I-1-342	H	H	CH ₃	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,15
I-1-343	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,02
I-1-344	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,37
I-1-345	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,42
I-1-346	H	H	H	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,01

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	A	Q	X	R'	logP
I-1-347	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,19
I-1-348	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,21
I-1-349	H	H	CH ₂ CN	Cl	Cl	CH ₂		N	Cl	2,19
I-1-350	H	H	H	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	1,75
I-1-351	H	H	CH ₂ CN	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	1,96
I-1-352	H	H	CH ₃	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	1,91
I-1-353	H	H	<i>o</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,08
I-1-354	H	H	<i>i</i> -Pr	CN	CH ₃	CH ₂		N	Cl	2,23
I-1-355	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃	C=NOCH ₃		N	Cl	4,07

De maneira análoga aos exemplos mostrados acima, bem como à descrição geral, obtêm-se os seguintes compostos da fórmula (I-2).

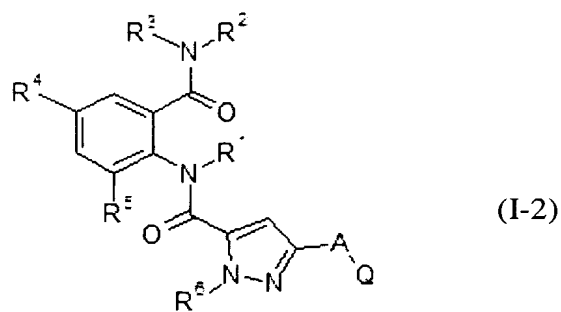
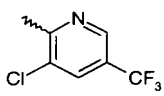
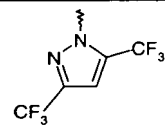
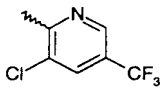
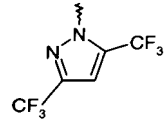
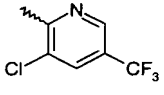
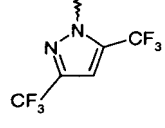
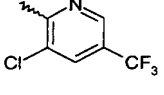
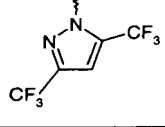
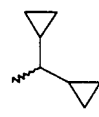
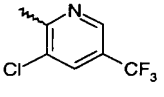
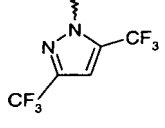

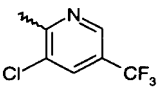
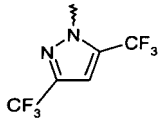
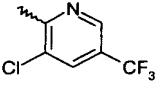
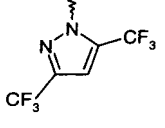
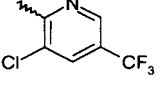
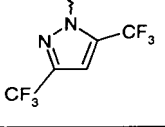
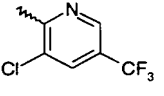
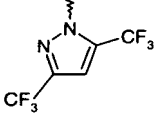
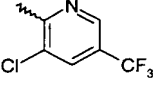
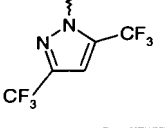
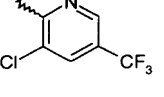
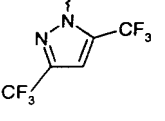


Tabela 2

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A	Q	logP
I-2-1	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₂		4,08
I-2-2	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CH ₂		3,85
I-2-3	H	H	CH ₃	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	CH ₂		3,31
I-2-4	H	H	CH ₃	Cl	Cl		CH ₂		*
I-2-5	H	H	CH ₃	Cl	Cl		CH ₂		2,83
I-2-6	H	H	CH ₃	Cl	Cl		CH ₂		2,99
I-2-7	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl		CH ₂		*
I-2-8	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl		CH ₂		4,68
I-2-9	H	H	<i>i</i> -Pr	I	CH ₃		CH ₂		4,98

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A	Q	logP
I-2-10	H	H	<i>c</i> -Pr	I	CH ₃		CH ₂		4,73
I-2-11	H	H	<i>i</i> -Pr	Cl	CH ₃		CH ₂		4,78
I-2-12	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	CH ₃		CH ₂		4,52
I-2-13	H	H	<i>c</i> -Pr	Cl	Cl		CH ₂		4,46
I-2-14	H	H		Cl	CH ₃		CH ₂		5,27
I-2-15	H	H		Cl	CH ₃		CH ₂		4,04
I-2-16	H	H	<i>t</i> -Bu	Cl	CH ₃		CH ₂		5,12
I-2-17	H	H	H	Cl	CH ₃		CH ₂		4,09
I-2-18	H	H	CH ₂ CN	Cl	CH ₃		CH ₂		4,23
I-2-19	H	H	<i>c</i> -Pr	F	CH ₃		CH ₂		4,11
I-2-20	H	H	<i>i</i> -Pr	F	CH ₃		CH ₂		4,47

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	A	Q	logP
I-2-21	H	H	<i>i</i> -Pr	Br	CH ₃		CH ₂		4,75
I-2-22	H	H	CH ₃	Cl	CH ₃		CH ₂		3,53
I-2-23	H	H	CH ₃	Cl	Cl		CH ₂		3,54
I-2-24	H	H	<i>o</i> -Pr	Br	CH ₃		CH ₂		4,63

De maneira análoga aos exemplos mostrados acima, bem como à descrição geral, obtêm-se os seguintes compostos da fórmula (I-3).

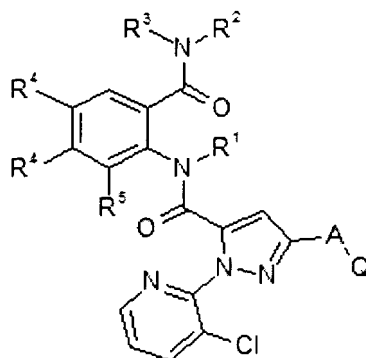


Tabela 3

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴ -R ⁴	R ⁵	A	Q	logP
I-3-1	H	H	<i>i</i> -Pr	-CH=CH-CH=CH-	Cl	CH ₂		4,08

Dados de RMN-¹H de compostos selecionados:

5 I-1-21 (400 MHz, DMSO): 1,11 (d, 6 H), 2,14 (s, 3 H), 3,91 (m, 1 H), 5,55 (s, 2 H), 7,12 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,76 (d, 1 H), 7,99 (s, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,43 (d, 1 H), 8,61 (s, 1 H), 10,12 (s, 1 H).

I-1-22 (400 MHz, DMSO): 1,18 (d, 6 H), 2,14 (s, 3 H), 3,90 (m, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,24 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,53 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,80 (d, 1 H),

8,08 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,07 (s, 1 H).

I-1-26 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 2,67 (d, 3 H), 5,93 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,00 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,12 (s, 1 H).

5 I-1-48 (400 MHz, DMSO): 2,13 (s, 3 H), 5,69 (s, 2 H), 7,18 (s, 1 H), 7,41 (s, 2 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,10 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 8,80 (s, 1 H), 10,19 (s, 1 H).

I-1-65 (400 MHz, DMSO): 1,06 (d, 6 H), 2,17 (s, 3 H), 3,95 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 7,15 (s, 1 H), 7,31 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,58 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 7,92 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 8,47 (s, 1 H), 10,04 (s, 1 H).

10 I-1-75 (400 MHz, DMSO): 1,09 (d, 6 H), 2,00 (s, 3 H), 2,15 (s, 3 H), 2,44 (dd, 1 H), 2,53 (dd, 1 H), 3,99 (m, 1 H), 5,86 (s, 2 H), 7,23 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,92 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,04 (s, 1 H).

I-1-88 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 2,67 (d, 3 H), 5,38 (s, 2 H), 7,28 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,96 (d, 2 H), 8,00 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,17 (d, 2 H), 8,46 (d, 1 H), 10,10 (s, 1 H).

15 I-1-104 (400 MHz, DMSO): 2,13 (s, 3 H), 2,64 (d, 3 H), 6,18 (s, 2 H), 7,28 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,92 (d, 2 H), 8,00 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,30 (d, 2 H), 8,45 (d, 1 H), 10,10 (s, 1 H).

20 I-1-117 (400 MHz, DMSO): 1,02 (d, 6 H), 2,15 (s, 3 H), 3,34 (s, 3 H), 3,92 (m, 1 H), 5,10 (s, 2 H), 7,17 (s, 1 H), 7,29 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,01 (s, 1 H).

I-1-126 (400 MHz, DMSO): 0,99-1,10 (m, 4 H), 1,03 (d, 6 H), 2,15 (s, 3 H), 3,00-3,08 (m, 1 H), 3,92 (m, 1 H), 5,05 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,29 (s, 1 H), 25 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,01 (s, 1 H).

I-1-139 (400 MHz, DMSO): 1,38 (s, 6 H), 2,14 (s, 3 H), 2,89 (s, 3 H), 3,68 (s, 2 H), 5,87 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,31 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,79 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 9,93 (s, 1 H).

30 I-1-148 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 2,66 (d, 3 H), 6,18 (s, 2 H), 7,29 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,11 (d, 1 H), 8,45 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 9,07 (s, 1 H), 10,10 (s, 1 H).

I-1-161 (400 MHz, DMSO): 1,04 (d, 6 H), 1,31 (s, 9 H), 2,14 (s, 3 H), 3,90 (m, 1 H), 5,46 (s, 2 H), 7,11 (s, 1 H), 7,29 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,78 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,40 (s, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,10 (s, 1 H).

5 I-1-172 (400 MHz, DMSO): 1,04 (d, 6 H), 2,15 (s, 3 H), 3,90 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,93 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,32 (s, 1 H).

I-1-175 (400 MHz, DMSO): 2,21 (s, 3 H), 4,16 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,86 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 10,32 (s, 1 H).

10 I-1-176 (400 MHz, DMSO): 2,19 (s, 3 H), 2,68 (d, 1 H), 5,88 (s, 2 H), 7,25 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,80 (s, 1 H), 7,97 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,15 (d, 1 H), 8,44 (d, 1 H), 10,40 (s, 1 H).

I-1-180 (400 MHz, DMSO): 2,21 (s, 3 H), 4,16 (d, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,27 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,77 (s, 1 H), 7,86 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 8,96 (d, 1 H), 10,34 (s, 1 H).

I-1-182 (400 MHz, DMSO): 1,04 (d, 6 H), 2,19 (s, 3 H), 3,92 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,74 (s, 1 H), 7,15 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,78 (s, 1 H), 7,91 (d, 1 H), 8,06 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,30 (s, 1 H).

20 I-1-190 (400 MHz, DMSO): 2,21 (s, 3 H), 4,15 (d, 1 H), 5,69 (s, 2 H), 7,18 (s, 1 H), 7,53 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,76 (s, 1 H), 7,85 (s, 1 H), 8,07 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 8,95 (s, 1 H), 10,30 (s, 1 H).

I-1-195 (400 MHz, DMSO): 1,11 (d, 6 H), 2,00 (s, 3 H), 2,15 (s, 3 H), 2,44 (dd, 1 H), 2,53 (dd, 1 H), 4,02 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,08 (d, 1 H), 7,15 (s, 1 H), 7,20 (d, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,84 (d, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,30 (s, 1 H).

25 I-1-196 (400 MHz, DMSO): 2,15 (s, 3 H), 4,34 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,19 (d, 1 H), 6,29 (d, 1 H), 7,10 (s, 1 H), 7,13 (d, 1 H), 7,22 (d, 1 H), 7,43 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 8,55 (t, 1 H), 10,30 (s, 1 H).

30 I-1-201 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 4,33 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,19 (d, 1 H), 6,29 (d, 1 H), 7,10 (s, 1 H), 7,33 (s, 1 H), 7,44 (2 d, 2 H), 7,55 (dd, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 8,55 (t, 1 H), 10,34 (s, 1 H).

- I-1-208 (400 MHz, DMSO): 2,14 (s, 3 H), 4,33 (d, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,19 (d, 1 H), 6,29 (d, 1 H), 7,13 (s, 1 H), 7,45 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,75 (s, 1 H), 7,80 (s, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,69 (br s, 1 H), 8,55 (t, 1 H), 10,34 (s, 1 H).
- 5 I-1-241 (400 MHz, DMSO): 1,02 (d, 3 H), 2,11 (s, 3 H), 3,91 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,12 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,57 (s, 1 H), 7,69 (s, 1 H), 7,76 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,37 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- I-1-243 (400 MHz, DMSO): 2,10 (s, 3 H), 2,67 (d, 3 H), 3,07 (q, 2 H), 5,57 (s, 2 H), 7,13 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,60 (s, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,98 (d, 1 H),
10 8,10 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,09 (s, 1 H).
- I-1-244 (400 MHz, DMSO): 0,99 (t, 3 H), 2,11 (s, 3 H), 3,07 (q, 2 H), 5,87 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,59 (s, 1 H), 7,70 (s, 1 H), 7,98 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,05 (s, 1 H).
- I-1-248 (400 MHz, DMSO): 1,01 (d, 6 H), 2,10 (s, 3 H), 3,89 (m, 1 H), 5,56 (s, 2 H), 6,73 (s, 1 H), 7,11 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,56 (s, 1 H), 7,76 (s, 1 H),
15 7,75 (d, 1 H), 8,04 (s, 1 H), 8,09 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,01 (s, 1 H).
- I-1-274 (400 MHz, DMSO): 0,99 (t, 3 H), 2,10 (s, 3 H), 3,07 (q, 2 H), 5,68 (s, 2 H), 7,15 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,60 (s, 1 H), 7,97 (s, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,09 (s, 1 H).
- 20 I-1-275 (400 MHz, DMSO): 0,40-0,47 (m, 2 H), 0,55-0,60 (m, 2 H), 2,10 (s, 3 H), 2,65-2,71 (m, 1 H), 5,69 (s, 2 H), 7,17 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,56 (s, 1 H), 7,69 (s, 1 H), 8,00 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,45 (s, 1 H), 8,79 (d, 1 H), 10,05 (s, 1 H).
- I-1-276 (400 MHz, DMSO): 0,41-0,45 (m, 2 H), 0,56-0,61 (m, 2 H), 2,10 (s, 3 H), 2,65-2,71 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 7,14 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,55 (s, 1 H),
25 7,69 (s, 1 H), 8,01 (d, 1 H), 8,08 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- I-1-279 (400 MHz, DMSO): 1,34-1,60 (m, 6 H), 1,71-1,78 (m, 2 H), 2,10 (s, 3 H), 4,01-4,08 (m, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,21 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,57 (s, 1 H),
30 7,70 (s, 1 H), 7,85 (d, 1 H), 8,07 (d, 1 H), 8,43 (s, 1 H), 10,02 (s, 1 H).
- I-1-280 (400 MHz, DMSO): 1,13-1,51 (m, 20 H), 1,71-1,78 (m, 2 H), 2,07 (s, 3 H), 3,93-3,96 (m, 1 H), 5,83 (s, 2 H), 7,13 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,61 (s, 1

H), 7,68 (d, 1 H), 8,02 (s, 1 H), 8,07 (d, 1 H), 8,43 (s, 1 H), 10,02 (s, 1 H).

I-1-282 (400 MHz, DMSO): 1,36 (s, 2 H), 1,56-1,65 (m, 2 H), 1,84-1,94 (m, 2 H), 2,07 (s, 3 H), 4,18-4,24 (m, 1 H), 5,87 (s, 2 H), 7,18 (s, 1 H), 7,55 (dd, 1 H), 7,59 (s, 1 H), 7,70 (d, 1 H), 8,07 (s, 1 H), 8,19 (d, 1 H), 8,43 (s, 1 H),
5 10,02 (s, 1 H).

I-1-290 (400 MHz, CDCl₃): 2,90 (d, 3 H), 5,74 (s, 2 H), 6,10 (d, 1 H), 7,23 (s, 1 H), 7,23 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,87 (d, 1 H), 8,46 (d, 1 H), 9,74 (s, 1 H).

I-1-296 (400 MHz, CDCl₃): 5,54 (s, 2 H), 5,62 (s, 1 H), 6,11 (s, 1 H), 7,12 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,48 (s, 1 H), 7,90 (d, 1 H), 7,94 (s, 1 H),
10 8,48 (d, 1 H), 9,45 (s, 1 H).

I-1-310 (400 MHz, CDCl₃): 4,18 (d, 2 H), 5,48 (s, 2 H), 6,74 (t, 1 H), 7,08 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,43 (dd, 1 H), 7,48 (s, 1 H), 7,92 (d, 1 H), 7,94 (s, 1 H), 8,50 (d, 1 H), 8,93 (s, 1 H).

I-1-314 (400 MHz, CDCl₃): 1,10 (d, 6 H), 4,08 (m, 1 H), 5,50 (s, 2 H), 5,92 (d, 1 H), 6,57 (s, 1 H), 7,15 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,39 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H),
15 7,57 (s, 1 H), 7,87 (d, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 9,65 (s, 1 H).

I-1-324 (400 MHz, CDCl₃): 1,24 (d, 3 H), 2,10 (s, 3 H), 2,60 (m, 2 H), 4,22 (m, 1 H), 5,51 (d, 1 H), 5,58 (d, 1 H), 6,13 (d, 1 H), 7,17 (s, 1 H), 7,35 (s, 1 H),
20 7,39 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,87 (d, 1 H), 7,90 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 9,60 (s, 1 H).

I-1-331 (400 MHz, CDCl₃): 0,55 (m, 2 H), 0,85 (m, 2 H), 2,16 (s, 3 H), 2,77 (m, 1 H), 5,57 (s, 2 H), 6,18 (d, 1 H), 7,12 (s, 1 H), 7,18 (s, 1 H), 7,24 (s, 1 H), 7,41 (dd, 1 H), 7,88 (d, 1 H), 8,35 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,15 (s, 1 H).

I-1-334 (400 MHz, CDCl₃): 1,24 (d, 6 H), 2,23 (s, 3 H), 4,18 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 5,99 (d, 1 H), 7,12 (s, 1 H), 7,28 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,58 (d, 1 H),
25 7,88 (d, 1 H), 8,36 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,62 (s, 1 H).

I-1-340 (400 MHz, CDCl₃): 1,24 (d, 6 H), 4,08 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 5,92 (d, 1 H), 7,21 (s, 1 H), 7,30 (s, 1 H), 7,32 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,77 (d, 1 H),
30 8,36 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,06 (s, 1 H).

I-1-345 (400 MHz, CDCl₃): 0,55 (m, 2 H), 0,85 (m, 2 H), 2,77 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 6,20 (d, 1 H), 7,14 (s, 1 H), 7,20 (s, 1 H), 7,22 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1

H), 7,88 (d, 1 H), 8,32 (s, 1 H), 8,45 (d, 1 H), 10,12 (s, 1 H).

I-1-354 (400 MHz, CDCl₃): 1,21 (d, 6 H), 4,15 (m, 1 H), 5,58 (s, 2 H), 7,16 (s, 1 H), 7,18 (s, 1 H), 7,40 (dd, 1 H), 7,58 (s, 1 H), 7,75 (s, 1 H), 7,84 (d, 1 H), 8,38 (s, 1 H), 8,48 (d, 1 H), 10,95 (s, 1 H).

5 I-2-4 (400 MHz, CDCl₃): 1,74 (m, 3 H), 2,16 (m, 2 H), 2,40 (m, 1 H), 2,86 (d, 3 H), 3,70 (m, 1 H), 3,88 (m, 1 H), 5,75 (s, 2 H), 5,80 (m, 1 H), 6,45 (s, 1 H), 6,80 (s, 1 H), 7,16 (s, 1 H), 7,42 (s, 1 H), 7,56 (s, 1 H), 9,08 (s, 1 H).

I-2-7 (400 MHz, CDCl₃): 1,24 (m, 6 H), 1,74 (m, 3 H), 2,20 (m, 2 H), 2,40 (m, 1 H), 3,70 (m, 1 H), 3,88 (m, 1 H), 4,10 (m, 1 H), 5,80 (m, 3 H), 6,25 (s, 1 H),
10 6,80 (s, 1 H), 7,40 (s, 1 H), 7,52 (s, 1 H), 8,85 (s, 1 H).

A determinação dos dados de RMN-¹H mostrados acima, é efetuada com um Bruker Avance 400, equipado com um sistema BEST (60 µl de volume celular) ou com um Bruker Avance 400, com tetrametilsilano como referência (0,0 ppm) e com os solventes CDCl₃ a 298 Kelvin ou d6-DMSO a 304 Kelvin. A caracterização da dissociação do sinal é efetuada com s = singleto, d = dubleto, t = tripleto, q = quarteto, m = multipeto, dd =
15 dubleto duplo.

A determinação dos valores logP indicados nas tabelas e exemplos de preparação acima é efetuada de acordo com a diretriz EEC 79/831 Annex V.A8 por meio de HPLC (High Performance Liquid Chromatography) em uma coluna de inversão de fases (C 18). Temperatura: 43°C.
20

A determinação com a LC-MS na escala de acidez é efetuada em pH 2,7 com ácido fórmico aquoso a 0,1 % e acetonitrila (contém 0,1 % de ácido fórmico) como eluentes; gradiente linear de 10 % de acetonitrila até
25 95 % de acetonitrila.

A calibração é efetuada com alcan-2-onas não ramificadas (com 3 a 16 átomos de carbono), cujos valores logP são conhecidos (determinação dos valores logP com base nos tempos de retenção através da interpolação linear entre duas alcanonas sucessivas).

30 Os valores lambda-max são determinados com base nos espectros UV de 200 nm a 400 nm nos máximos dos sinais cromatográficos.

Preparação de materiais de partida da fórmula (V)

Exemplo 2

2-[5-(3,5-bistrifluormetilpirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-il]-6-cloro-8-metilbenzo[d][1,3]oxazin-4-ona

Sob argônio 0,12 ml (1,60 mmol) de cloreto de ácido metanosulfônico em 3 ml de acetonitrila são resfriados a 0°C e em seguida, uma
 5 solução de 540 mg (1,228 mmol) de ácido 5-(3,5-bis-trifluormetil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico em 0,17 ml (2,09 mmol) de piridina e 6 ml de acetonitrila é acrescentada às gotas. Deixa-se agitar por 15 minutos nesta temperatura e em seguida, acrescenta-se às gotas
 10 uma solução de 228 mg (1,228 mmol) de 2-amino-5-cloro-3,N-dimetilbenzamida em 0,35 ml (4,30 mmols) de piridina e 6 ml de acetonitrila. Após mais 15 minutos a 0°C, adicionam-se 0,12 ml (1,60 mmol) de cloreto de ácido metanossulfônico e durante a noite aquece-se lentamente à temperatura ambiente. Remove-se o solvente no vácuo, adicionam-se 15 ml de água e
 15 aspiram-se os cristais formados.

Rendimento: 500 mg (logP: 5,11).

Preparação de materiais de partida da fórmula (IV)

Exemplo 3

20 Ácido 5-(3,5-bistrifluormetil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico:

A uma solução de 610 mg (1,34 mmol) de éster metílico de ácido 5-(3,5-bis-trifluormetil-pirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloro-piridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico em 9 ml de etanol acrescenta-se às gotas uma solução de 699 mg (1,78 mmol) de hidróxido de sódio em 7 ml de água. Deixa-se agitar por
 25 2 horas à temperatura ambiente, concentra-se no evaporador rotativo para cerca de 5 ml. Adicionam-se 5 ml de éter terc-butilmetílico e em seguida, lava-e a fase orgânica com água. As fases aquosas combinadas são ajustadas para um valor de pH de cerca de 3 com ácido clorídrico concentrado e extraídas três vezes com 50 ml cada de acetato de etila. As fases orgânicas
 30 combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio e, em seguida, o solvente é removido no evaporador rotativo.

Rendimento: 560 mg (logP: 2,86).

Preparação de materiais de partida da fórmula (IV)

Exemplo 4

Éster metílico de ácido 5-(3,5-bis-trifluormetilpirazol-1-ilmetil)-2-(3-cloropiridin-2-il)-2H-pirazol-3-carboxílico:

5 Uma solução de 700 mg (2,03 mmols) de éster metílico de ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-metanossulfoniloximetil-2H-pirazol-3-carboxílico em 15 ml de acetonitrila é sucessivamente adicionada a 336 mg (2,43 mmols) de carbonato de potássio e 413 mg (2,03 mmols) de 3,5-bis(trifluormetil)pirazol e em seguida, é agitada por uma hora a 60°C. Após
10 resfriar à temperatura ambiente, o solvente é concentrado no evaporador rotativo, adicionado a água e extraído três vezes com 50 ml cada de acetato de etila. As fases orgânicas combinadas são secadas sobre sulfato de magnésio e em seguida, o solvente é removido no evaporador rotativo.

Rendimento: 970 mg (logP: 3,71).

15 Preparação de materiais de partida da fórmula (VII)

Exemplo 5

Éster metílico de ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-metanossulfoniloximetil-2H-pirazol-3-carboxílico

20 Sob argônio, 2,10 g (7,85 mmols) de éster metílico de ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-hidroximetil-2H-pirazol-3-carboxílico são previamente introduzidos em 13 ml de diclorometano, resfriados a 0°C e sucessivamente adicionados às gotas a 1,64 ml (11,8 mmols) de trietilamina e 0,67 ml (8,63 mmols) de cloreto de ácido metanossulfônico. Deixa-se agitar por 30 minutos
25 nesta temperatura, dilui-se com 50 ml de diclorometano e lava-se sucessivamente respectivamente com 50 ml de solução de hidrogenossulfato de sódio aquosa saturada, ácido clorídrico aquoso a 10 % e solução de cloreto de sódio aquosa saturada. A fase orgânica é secada sobre sulfato de magnésio e em seguida, o solvente é removido no evaporador rotativo.

Rendimento: 2,65 g (logP: 1,55)

30 Preparação de materiais de partida da fórmula (X)

Exemplo 6

Éster metílico de ácido 2-(3-cloropiridin-2-il)-5-hidroximetil-2H-pirazol-3-

carboxílico:

Sob argônio, 12,3 g (41,7 mmols) de éster dimetílico de ácido 1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-3,5-dicarboxílico são previamente introduzidos em 430 ml de tetrahidrofurano, resfriados a -72°C e adicionados às gotas a
 5 100 ml (100 mmol de uma solução 1 M em hexano) de hidreto de diisobutíla-lumínio. Deixa-se aquecer durante a noite a 0°C e cuidadosamente acrescentam-se 65 ml de água. Os solventes são removidos no evaporador rotativo e o resíduo é exaustivamente extraído no Soxhlet com metanol. Após re-
 10 mover o solvente, o resíduo é purificado em sílica-gel (ciclohexano/acetato de etila = 2 : 1 → 1 : 1).

Rendimento: 9,26 g (logP: 1,26).

Preparação de materiais de partida da fórmula (XI)Exemplo 7Éster dimetílico de ácido 1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-3,5-dicarboxílico

15 A uma solução de 15,6 g (64,8 mmols) de éster dimetílico de ácido 2-pirrolidino-4-oxo-2-pentenodocarboxílico e 20,4 g (64,8 mmols) de 3-cloro-2-piridin-2-il-hidrazina sal de ácido toluenossulfônico em 84 ml de metanol, coloca-se uma pitada de ácido toluenossulfônico e aquece-se por 5 horas a 50°C. Em seguida, adicionam-se 12,3 g (64,8 mmols) de monohidra-
 20 to de ácido toluenossulfônico e agita-se inicialmente por 1 hora a 50°C e 1 hora sob refluxo. Após resfriar a 0°C, os cristais precipitados são aspirados e filtrados através de sílica-gel (ciclohexano/éster acético = 1 : 1).

Rendimento: 8,56 g (logP: 1,97).

25 Exemplos em relação à eficácia biológica dos compostos de acordo com a invenção

Exemplo nº 1Teste com *Heliiothis virescens*

Solvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)

1 % de álcool diacetônico

30 Corante: sulfoflavina brilhante para tingir a água.

Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se a substância ativa com as quantidades de solvente indicadas e

dilui-se o concentrado com a água tingida para a concentração desejada.

Os ovos de *Heliothis virescens* são tratados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

5 Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todos os ovos/larvas foram mortos; 0 % significa, que nenhum dos ovos/larvas foram mortos.

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

Teste com *Heliothis virescens*

substância ativa	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade após 6-7 dias em %
I-1-13	300	100
I-1-14	300	100
I-1-15	300	100

10 Exemplo nº 2

Teste com *Myzus persicae*

Solvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)

1 % de álcool diacetônico

Corante: sulfoflavina brilhante para tingir a água.

15 Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se a substância ativa com as quantidades de solvente indicadas e dilui-se o concentrado com a água tingida para a concentração desejada.

Uma preparação de substância ativa da concentração desejada para absorção é posta à disposição do *Myzus persicae*.

20 Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

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

Teste com *Myzus persicae*

substância ativa	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade após 6-7 dias em %
I-1-13	30	100
I-1-14	30	100
I-1-15	30	100

Exemplo n° 3

Teste com *Aedes aegypti*

Solvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)

5 1 % de álcool diacetônico

Corante: sulfoflavina brilhante para tingir a água.

Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se a substância ativa com as quantidades de solvente indicadas e dilui-se o concentrado com a água tingida para a concentração desejada.

10 As larvas de *Aedes aegypti* são tratadas com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todos os *Aedes aegypti* foram mortos; 0 % significa, que os *Aedes aegypti* não foram mortos.

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

Teste com *Aedes aegypti*

substância ativa	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade após 2-4 dias em %
I-1-13	30	100
I-1-14	30	100
I-1-15	30	100

Exemplo n° 4

Tese com *Diabrotica undecimpunctata*

20 Solvente: 1 % de N-metilpirrolidona (NMP)

1 % de álcool diacetônico

Corante: sulfoflavina brilhante para tingir a água.

Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se a substância ativa com as quantidades de solvente indicadas e dilui-se o concentrado com a água tingida para a concentração desejada.

5 Os ovos de *Diabrotica undecimpunctata* são tratados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todos os ovos/larvas foram mortos; 0 % significa, que nenhum dos ovos/larvas foram mortos.

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

Teste com *Diabrotica undecimpunctata*

substância ativa	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade após 2-5 dias em %
I-1-13	300	100
I-1-14	300	100
I-1-15	300	100

Exemplo n° 5

Teste com *Phaedon* (tratamento por pulverização)

15 Solvente: 78,0 partes em peso, de acetona

1,5 partes em pesos, de dimetilformamida

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

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

20 Discos de couve da China (*Brassica pekinensis*) são pulverizados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada e depois de secos, infestados com larvas do besouro da raiz-forte (*Phaedon cochleariae*).

25 Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todas as larvas do besouro foram mortas; 0 %

significa, que as larvas não foram mortas.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram uma eficácia \geq de 80 % com uma quantidade de aplicação de 100 g/ha:

- 5 exemplo nº I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-10, I-1-11, I-1-12, I-1-13, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-22, I-1-23, I-1-24, I-1-25, I-1-28, I-1-29, I-1-30, I-1-31, I-1-32, I-1-33, I-1-34, I-1-35, I-1-36, I-1-37, I-1-38, I-1-39, I-1-40, I-1-217, I-1-218, I-1-219, I-1-220, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-225, I-1-226, I-1-38, I-1-42, I-1-43, I-1-44, I-1-45, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-49, I-1-50,
- 10 I-1-51, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-58, I-1-59, I-1-60, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-70, I-1-71, I-1-72, I-1-73, I-1-74, I-1-75, I-1-76, I-1-77, I-1-78, I-1-79, I-1-80, I-1-81, I-1-82, I-1-83, I-1-84, I-1-85, I-1-86, I-1-87, I-1-92, I-1-93, I-1-97, I-1-99, I-1-100, I-1-101, I-1-113, I-1-120, I-1-121, I-1-125, I-1-128, I-1-129, I-1-130, I-1-131, I-1-134, I-
- 15 1-135, I-1-137, I-1-138, I-1-139, I-1-140, I-1-141, I-1-142, I-1-144, I-1-145, I-1-146, I-1-147, I-1-148, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-152, I-1-155, I-1-156, I-1-157, I-1-158, I-1-163, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-1-169, I-1-170, I-1-171, I-1-172, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-
- 20 1-189, I-1-190, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-195, I-1-196, I-1-199, I-1-201, I-1-203, I-1-204, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-212, I-1-213, I-1-214, I-1-215, I-1-216, I-1-227, I-1-228, I-1-230, I-1-231, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-236, I-1-237, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-251, I-1-252, I-1-253, I-
- 25 1-255, I-1-258, I-1-259, I-1-260, I-1-267, I-1-272, I-1-273, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-279, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-286, I-1-287, I-1-288, I-1-289, I-1-290, I-1-291, I-1-292, I-1-293, I-1-294, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-302, I-1-303, I-1-304, I-1-305, I-1-307, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-312, I-1-313, I-1-324, I-1-326, I-1-327, I-1-328, I-1-
- 30 329, I-1-330, I-1-331, I-1-332, I-1-333, I-1-334, I-1-335, I-1-336, I-1-337, I-1-338, I-1-339, I-1-340, I-1-342, I-1-343, I-1-346, I-1-347, I-1-348, I-1-349, I-1-350, I-1-352, I-1-353, I-1-354, I-1-355, I-2-2.

Exemplo nº 6Teste com *Spodoptera frugiperda*

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

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

10 Folhas de couve (*Brassica oleracea*) são tratadas por imersão na preparação de substância ativa da concentração desejada e infestadas com lagartas da beterraba (*Spodoptera frugiperda*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

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

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

Teste com *Spodoptera frugiperda*

substância ativa	concentração da substância ativa em g/ha	grau de mortalidade após 7 dias em %
I-1-1	100	100
I-1-2	100	100
I-1-3	100	100
I-1-4	100	100
I-1-5	100	100
I-1-6	100	100
I-1-7	100	100
I-1-8	100	100
I-1-10	100	100
I-1-11	100	100
I-1-12	100	100
I-1-13	100	100

substância ativa	concentração da substância ativa em g/ha	grau de mortalidade após 7 dias em %
I-1-14	100	100
I-1-15	100	100
I-1-16	100	100
I-1-17	100	100
I-1-18	100	100
I-1-19	100	100
I-1-20	100	100
I-1-21	100	100
I-1-22	100	100
I-1-23	100	100
I-1-24	100	100
I-1-25	100	100
I-1-26	100	100
I-1-27	20	83
I-1-28	100	100
I-1-29	100	100
I-1-30	100	100
I-1-31	100	100
I-1-32	100	100
I-1-33	100	100
I-1-34	100	100
I-1-35	100	100
I-1-36	100	100
I-1-37	100	100
I-1-39	100	100
I-1-40	100	100

Exemplo nº 7Teste com Spodoptera exigua

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada. Caso seja necessário acrescentar sais de amônio, promotores de penetração ou sais de amônio e promotores de penetração, estes são acrescentados por pipetagem em uma concentração de 1000 ppm após a diluição, em cada caso, à solução de preparação pronta. Os exemplos I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22 são testados sem adição de sais de amônio ou promotores de penetração.

Plantas de couve (*Brassica oleracea*) são tratadas através de pulverização da preparação de substância ativa com a concentração desejada e infestadas com lagartas de pupas de beterraba (*Spodoptera exigua*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

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

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 4 ppm:

exemplo nº I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-11, I-1-31, I-1-35, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-55, I-1-57, I-1-170, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-54.

Exemplo nº 8

Teste com *Plutella xylostella*

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada. Caso seja necessário acrescentar sais de amônio, promotores de penetração ou sais de amônio e promotores de penetração, estes são acrescentados por pipetagem em uma

concentração de 1000 ppm após a diluição, em cada caso, à solução de preparação pronta. Os exemplos I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22 são testados sem adição de sais de amônio ou promotores de penetração.

5 Folhas de couve (*Brassica oleracea*) são tratadas através de pulverização da preparação de substância ativa com a concentração desejada e infestadas com lagartas da barata da couve (*Plutella xylostella*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

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

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 20 ppm:

15 exemplo n° I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22, I-1-65, I-1-239, I-1-240, I-1-245, I-1-217, I-1-220, I-1-223, I-1-224, I-1-31, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-63, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-76, I-1-92, I-1-97, I-1-98, I-1-101, I-1-113, I-1-121, I-1-147, I-1-170, I-1-192, I-1-195, I-1-204, I-1-206, I-1-209, I-1-210, I-1-212, I-1-215, I-1-238, I-1-244, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-25, I-1-35, I-1-36, I-1-38,
20 I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-104, I-1-106, I-1-107, I-1-108, I-1-143, I-1-88, I-1-139.

Exemplo n° 9

Teste com Spodoptera frugiperda

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

25 Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

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

30 Folhas de couve (*Brassica oleracea*) são tratadas por imersão na preparação de substância ativa da concentração desejada e infestadas com lagartas da beterraba (*Spodoptera frugiperda*), enquanto as folhas ain-

da estão úmidas.

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

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

Teste com Spodoptera frugiperda

substâncias ativas	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade após 7 dias em %
I-1-3	0,8	100
I-1-5	0,8	100
I-1-6	0,8	100
I-1-8	0,8	100
I-1-9	100	100
I-1-22	4	100

Exemplo n° 10

Teste com Heliothis armigera

- 10 Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

- 15 Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada. Caso seja necessário acrescentar sais de amônio, promotores de penetração ou sais de amônio e promotores de penetração, estes são acrescentados por pipetagem em uma concentração de 1000 ppm após a diluição, em cada caso, à solução de preparação pronta. Os exemplos I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8 e I-1-22 são testados sem adição de sais de amônio ou promotores de penetração.
- 20

Plantas de algodão (*Gossypium hirsutum*) são tratadas através de pulverização da preparação de substância ativa com a concentração desejada e infestadas com lagartas do verme encapsulado do algodão (*Heliothis armigera*), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

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

5 Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 20 ppm:

exemplo n° I-1-3, I-1-5, I-1-6, I-1-8, I-1-22, I-1-63, I-1-65, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-192, I-1-240, I-1-245, I-1-217, I-1-220, I-1-223, I-1-224, I-1-31, I-1-35, I-1-36, I-1-38, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-76, I-1-88, I-1-131, I-1-139, I-1-92, I-1-97, I-1-98, I-1-100, I-1-101, I-1-113, I-1-121, I-1-147, I-1-170, I-1-195, I-1-204, I-1-206, I-1-212, I-1-215, I-1-238, I-1-244, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-104, I-1-106, I-1-107, I-1-108, I-1-143.

15 Exemplo n° 11

Teste com Spodoptera exigua; cepa resistente

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

20 Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada. Caso seja necessário acrescentar sais de amônio, promotores de penetração ou sais de amônio e promotores de penetração, estes são acrescentados por pipetagem em uma
25 concentração de 1000 ppm após a diluição, em cada caso, à solução de preparação pronta. Os exemplos I-1-5, I-1-6, I-1-22 são testados sem adição de sais de amônio ou promotores de penetração.

30 Plantas de couve (*Brassica oleracea*) são tratadas através de pulverização da preparação de substância ativa com a concentração desejada e infestadas com lagartas de pupas de beterraba (*Spodoptera exigua*, cepa resistente), enquanto as folhas ainda estão úmidas.

Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste

caso, 100 % significam, que todas as lagartas foram mortas; 0 % significa, que as lagartas não foram mortas.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 4 ppm:

exemplo nº I-1-5, I-1-6, I-1-22, I-1-31, I-1-35, I-1-38, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-56, I-1-57, I-1-170, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299.

Exemplo nº 12

Liriomyza trifolii

10 Solvente: 78 partes em peso, de acetona

1,5 parte em peso, de dimetilformamida

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

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

15 Discos de folhas de feijão (*Phaseolus vulgaris*), que estão infestados por larvas de moscas de mina (*Liriomyza trifolii*), são pulverizados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada.

20 Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 %, que todas as moscas de mina foram mortas; 0 % significa, que as moscas de mina não foram mortas.

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

25 Teste com Liriomyza trifolii

substância ativa	concentração da substância ativa em ppm	grau de mortalidade após 7 dias em %
I-1-3	500	98
I-1-4	500	95
I-1-22	500	98

Exemplo nº 13

Teste com Lucilia cuprina

Solvente: dimetilsulfóxido

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

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

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %. Neste caso, 100 % significam, que todas as larvas foram mortas; 0 % significa, que as larvas não foram mortas.

10 Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito de ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 100 ppm:

exemplo n° I-1-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-8, I-1-9, I-1-12, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-21, I-1-22, I-1-29, I-1-30, I-1-31, I-1-217, I-1-220, I-1-223, I-1-224, I-1-42, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-67, I-1-68, I-1-74, I-1-88, I-1-92, I-1-97, I-1-104, I-1-107, I-1-108, I-1-109, I-1-111, I-1-114, I-1-122, I-1-123, I-1-192, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-244, I-1-247, I-1-274, I-1-275, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-323.

Exemplo n° 14

Teste com *Boophilus microplus* (injeção)

Solvente: dimetilsulfóxido

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

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

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

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos

de preparação mostram um efeito $\geq 80\%$ com uma quantidade de aplicação de 20 $\mu\text{g}/\text{animal}$:

exemplo n° I-1-1, I-1-2, I-1-3, I-1-4, I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-8, I-1-9, I-1-12, I-1-14, I-1-15, I-1-16, I-1-17, I-1-18, I-1-19, I-1-21, I-1-29, I-1-30, I-1-31, I-1-217,
5 I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-42, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-67, I-1-68, I-1-74, I-1-88, I-1-92, I-1-97, I-1-104, I-1-107, I-1-108, I-1-109, I-1-111, I-1-114, I-1-122, I-1-123, I-1-192, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-244, I-1-247, I-1-274, I-1-275, I-1-291, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-299, I-1-323.

10 Exemplo n° 15

Teste com *Musca domestica*

Solvente: dimetilsulfóxido

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

Recipientes, que contêm uma esponja, que foi tratada com a preparação de substância ativa da concentração desejada, são infestados com *Musca domestica adulta*.

Após o tempo desejado, a mortalidade é determinada em %.
20 Neste caso, 100 % significam, que todas as moscas foram mortas; 0 % significa, que as moscas não foram mortas. No caso dos exemplos I-1-16, I-1-19 e I-1-30 trata-se de um efeito knock-down.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito $\geq 80\%$ com uma quantidade de aplicação
25 de 100 ppm:

exemplo n° I-1-16, I-1-19, I-1-30, I-1-217, I-1-42, I-1-43, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-52, I-1-53, I-1-55, I-1-64, I-1-66, I-1-107, I-1-114, I-1-192, I-1-274, I-1-275, I-1-296, I-1-297, I-1-299.

Exemplo n° 16

30 Teste com *Spodoptera frugiperda* (tratamento por pulverização)

Solvente: 78,0 partes em peso, de acetona

1,5 partes em pesos, de dimetilformamida

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

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

Discos de folhas de milho (*Zea mays*) são pulverizados com uma preparação de substância ativa da concentração desejada e depois de secos, infestados com lagartas da beterraba (*Spodoptera frugiperda*).

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

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram uma eficácia \geq de 80 % com uma quantidade de aplicação de 100 g/ha:

exemplo n° I-1-217, I-1-218, I-1-219, I-1-220, I-1-221, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-38, I-1-42, I-1-43, I-1-44, I-1-45, I-1-46, I-1-47, I-1-48, I-1-49, I-1-50, I-1-51, I-1-52, I-1-53, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-58, I-1-59, I-1-60, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-64, I-1-65, I-1-66, I-1-68, I-1-69, I-1-70, I-1-71, I-1-72, I-1-73, I-1-74, I-1-75, I-1-76, I-1-77, I-1-78, I-1-79, I-1-80, I-1-81, I-1-82, I-1-83, I-1-84, I-1-85, I-1-86, I-1-87, I-1-92, I-1-93, I-1-97, I-1-99, I-1-100, I-1-101, I-1-102, I-1-103, I-1-113, I-1-116, I-1-117, I-1-118, I-1-119, I-1-120, I-1-121, I-1-125, I-1-126, I-1-127, I-1-128, I-1-129, I-1-130, I-1-131, I-1-134, I-1-135, I-1-136, I-1-137, I-1-138, I-1-139, I-1-140, I-1-141, I-1-142, I-1-144, I-1-145, I-1-146, I-1-147, I-1-148, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-152, I-1-153, I-1-154, I-1-155, I-1-156, I-1-157, I-1-158, I-1-160, I-1-161, I-1-163, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-3-1, I-1-169, I-1-170, I-1-171, I-1-172, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-1-189, I-1-190, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-195, I-1-196, I-1-199, I-1-200, I-1-201, I-1-202, I-1-203, I-1-204, I-1-205, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-212, I-1-213, I-1-214, I-1-215, I-1-216, I-1-225, I-1-226, I-1-227, I-1-228, I-1-231, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-237, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-

244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-252, I-1-253, I-1-255, I-1-257, I-1-258, I-1-259, I-1-260, I-1-261, I-1-262, I-1-263, I-1-264, I-1-266, I-1-267, I-1-268, I-1-269, I-1-270, I-1-271, I-1-272, I-1-273, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-279, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-286, I-1-287, I-1-289, I-2-8, I-2-12, I-2-17, I-2-19, I-1-290, I-1-291, I-1-292, I-1-293, I-1-294, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-301, I-1-302, I-1-303, I-1-304, I-1-305, I-1-307, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-311, I-1-312, I-1-313, I-1-314, I-1-315, I-1-318, I-1-324, I-1-326, I-1-327, I-1-328, I-1-329, I-1-330, I-1-331, I-1-332, I-1-333, I-1-334, I-1-335, I-1-336, I-1-337, I-1-338, I-1-339, I-1-341, I-1-343, I-1-344, I-1-346, I-1-347, I-1-348, I-1-349, I-1-350, I-1-351, I-1-352, I-1-353, I-1-354, I-1-355, I-2-2, I-2-3.

Exemplo n° 17

Teste com Myzus (tratamento por pulverização)

Solvente: 78,0 partes em peso, de acetona
 15 1,5 partes em pesos, de dimetilformamida

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

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

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

25 Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito de ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 100 g/ha:

exemplo n° I-1-64, I-1-68, I-1-74, I-1-75, I-1-76, I-1-77, I-1-78, I-1-80, I-1-81, I-1-83, I-1-84, I-1-92, I-1-97, I-1-99, I-1-100, I-1-101, I-1-113, I-1-116, I-1-117,

I-1-118, I-1-120, I-1-121, I-1-126, I-1-127, I-1-128, I-1-130, I-1-131, I-1-134, I-1-135, I-1-36, I-1-137, I-1-138, I-1-139, I-1-142, I-1-144, I-1-145, I-1-146, I-1-150, I-1-152, I-1-163, I-1-174, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-198, I-1-203, I-1-207, I-1-209, I-1-211, I-1-212, I-1-216, I-1-272, I-2-10, I-1-308, I-1-326, I-1-327, I-1-329, I-1-330, I-1-331, I-1-332, I-1-333, I-1-336, I-1-338, I-1-339, I-1-354.

Exemplo n° 18

Teste com *Aphis gossypii*

Solvente: 7 partes em peso, de dimetilformamida

10 Emulsificante: 2 partes em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para produzir uma preparação adequada de substância ativa, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água contendo emulsificante para a concentração desejada. Caso seja necessário acrescentar sais de amônio, promotores de penetração ou sais de amônio e promotores de penetração, estes são acrescentados por pipetagem em uma concentração de 1000 ppm após a diluição, em cada caso, à solução de preparação pronta.

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

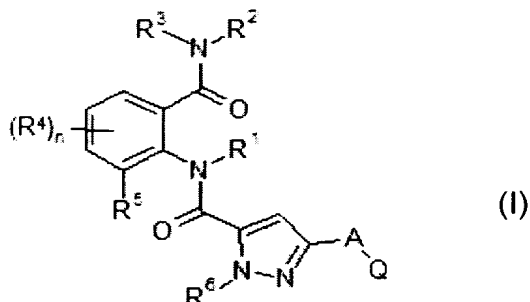
Após o tempo desejado, o efeito é determinado em %. Neste caso, 100 % significam, que todos os pulgões foram mortos; 0 % significa, que os pulgões não foram mortos.

25 Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostram um efeito de ≥ 80 % com uma quantidade de aplicação de 100 g/ha:

exemplo n° I-1-68, I-1-75, I-1-76, I-1-88, I-1-98, I-1-99, I-1-104, I-1-108, I-1-113, I-1-131, I-1-139, I-1-143, I-1-176, I-1-251.

REIVINDICAÇÕES

1. Compostos da fórmula (I)



na qual

R¹ representa hidrogênio, amino, hidróxi ou C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-
5 alquenila, C₂-C₆-alquinila ou C₃-C₆-cicloalquila em cada caso eventualmente
substituída uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes
independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano,
nitro, hidróxi, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-
alquilsulfonila, (C₁-C₄-alcóxi)carbonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-
10 alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino ou (C₁-C₄-alquil)C₃-C₆-cicloalquilamino,

R² representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-
alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-
alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, C₂-C₆-alcoxicarbonila ou C₂-C₆-
alquilcarbonila,

15 R³ representa hidrogênio ou C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₂-C₆-
alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₁₂-cicloalquila, C₃-C₁₂-cicloalquil-C₁-C₆-alquila
e C₄-C₁₂-bicicloalquila, em que os substituintes independentes uns dos ou-
tros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, amino, C₁-
C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-cicloalquilamino, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-
20 haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-
alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-
C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-
alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₂-C₆-alcoxicarbonila,
C₂-C₆-alquilcarbonila, C₃-C₆-trialquilsilila ou um anel heteroaromático com 5
25 ou 6 membros,

R² e R³ juntos podem estar ligados através de dois a seis áto-

mos de carbono e formam um anel, que eventualmente contém adicionalmente um outro átomo de nitrogênio, enxofre ou oxigênio e que pode ser eventualmente substituído uma a quatro vezes com C₁-C₂-alquila, halogênio, ciano, amino ou C₁-C₂-alcóxi ou

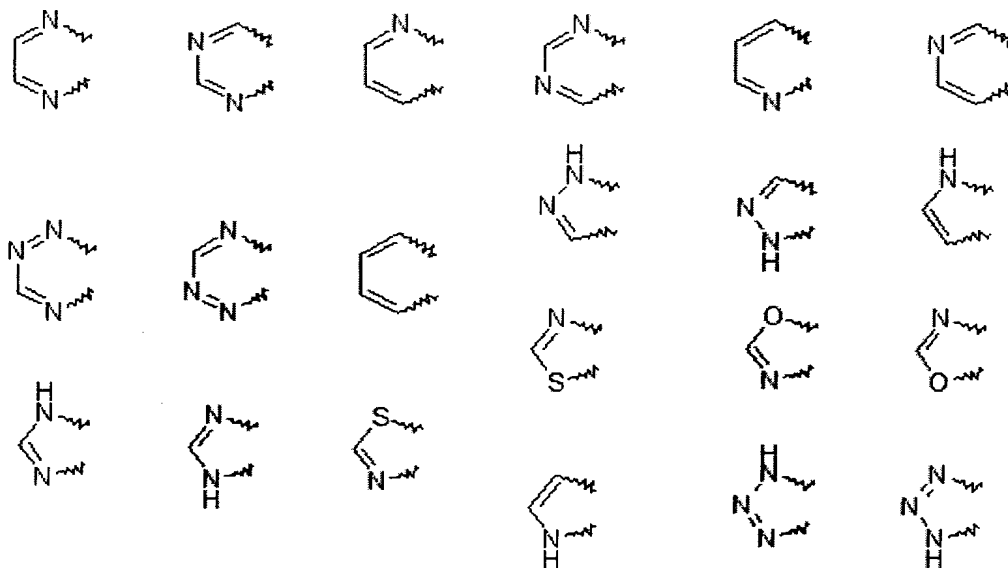
5 R² e R³ juntos representam =S(C₁-C₄-alquila)₂, =S(O)(C₁-C₄-alquila)₂,

R⁴ representa hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-alquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, SF₅, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, (C₁-C₄-alcóxi)imino, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino, (C₁-C₄-haloalquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino ou C₃-C₆-trialquilsilila ou

15 dois R⁴, através de átomos de carbono adjacentes, formam um anel, que representa -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH=CH-)₂-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-, -OCF₂O-, -(CF₂)₂O-, -O(CF₂)₂O-, -(CH=CH-CH=N)- ou -(CH=CH-N=CH)- ou

20 dois R⁴, através de átomos de carbono adjacentes, formam os seguintes anéis anelados, que são eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio(C₁-C₆-alquila), C₁-C₄-alquilsulfinil(C₁-C₆-alquila), C₁-C₄-alquilsulfonil(C₁-C₆-alquila), C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino ou C₃-C₆-cicloalquilamino,

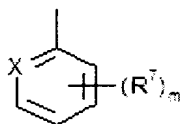
25



n representa 0 a 3,

R⁵ representa C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₁-C₆-halocicloalquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-alquinila, C₂-C₆-haloalquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, halogênio, ciano, nitro ou C₃-C₆-trialquilsilila,

R⁶ representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₃-C₆-cicloalcóxi, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila ou



R⁷ independente um do outro, representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio ou C₁-C₄-haloalquiltio,

m representa 0 a 4,

X representa N, CH, CF, CCl, CBr ou Cl,

A representa -CH₂-, -CH₂O-, -CH₂OCH₂-, -CH₂S-, -CH₂SCH₂-, -CH₂N(C₁-C₆-alquila)-, -CH₂N(C₁-C₆-alquila)CH₂-, -CH[CO₂(C₁-C₆-alquila)]-, -CH(CN)-, -CH(C₁-C₆-alquila)-, -C(di-C₁-C₆-alquila)-, -CH₂CH₂- ou -C=NO(C₁-

C₆-alquila)-,

Q representa um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros ou um sistema de anel aromático, com 8, 9 ou 10 membros, anelado, heterobifurcado, em que o anel ou o sistema de anel é eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente e em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, CO₂H, CO₂NH₂, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, (C₁-C₆-alquil)carbonila, (C₁-C₆-alcóxi)carbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di-(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila, tri-(C₁-C₂)alquilsilila, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino ou

Q representa um anel heteroaromático ou heterocíclico com 5 ou 6 membros ou um sistema de anel aromático com 8, 9 ou 10 membros, anelado, heterobifurcado, em que o anel ou o sistema de anel é eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente e em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, CO₂H, CO₂NH₂, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, (C₁-C₆-alquil)carbonila, (C₁-C₆-alcóxi)carbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di-(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila, tri-(C₁-C₂)alquilsilila, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino, ou em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, sendo que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-

alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

bem como seus N-óxidos e sais.

5 2. Compostos da fórmula (I) de acordo com a reivindicação 1, na qual

R¹ representa hidrogênio, amino, hidróxi ou C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila ou C₃-C₆-cicloalquila em cada caso eventualmente substituída uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, (C₁-C₄-alcóxi)carbonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino ou (C₁-C₄-alquil)C₃-C₆-cicloalquilamino,

15 R² representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, C₂-C₆-alcoxicarbonila ou C₂-C₆-alquilcarbonila,

20 R³ representa hidrogênio ou C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila em cada caso eventualmente substituída uma ou mais vezes, igual ou diferente, em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de halogênio, ciano, nitro, hidróxi, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquilsulfimino, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfimino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₁-C₄-alquilsulfoximino, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alquilsulfoximino-C₂-C₅-alquilcarbonila, C₂-C₆-alcoxicarbonila, C₂-C₆-alquilcarbonila ou C₃-C₆-trialquilsilila,

30 R⁴ representa hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-alquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, SF₅, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-

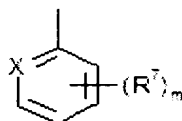
cicloalquilamino, (C₁-C₄-alcóxi)imino, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino, (C₁-C₄-haloalquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino ou C₃-C₆-trialquilsilila ou

dois R⁴, através de átomos de carbono adjacentes, formam um anel, que representa -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -(CH₂)₅-, -(CH=CH-)₂-, -OCH₂O-, -
 5 O(CH₂)₂O-, -OCF₂O-, -(CF₂)₂O-, -O(CF₂)₂O-, -(CH=CH-CH=N)- ou -(CH=CH-N=CH)-,

n representa 0 a 3,

R⁵ representa C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₁-C₆-halocicloalquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-
 10 C₆-alquinila, C₂-C₆-haloalquinila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, halogênio, ciano, nitro ou C₃-C₆-trialquilsilila,

R⁶ representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila ou
 15



R⁷ independente um do outro, representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio ou C₁-C₄-haloalquiltio,

m representa 0 a 4,

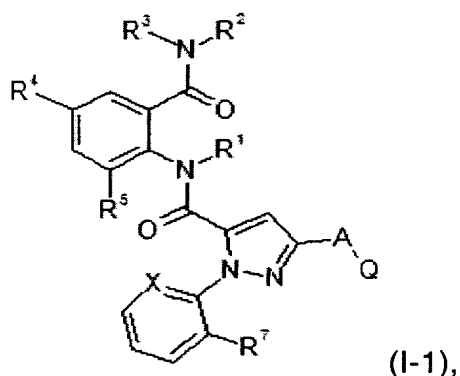
20 X representa N, CH, CF, CCl, CBr ou Cl,

A representa -CH₂-, CH(CH)₃, C(CH₃)₂ ou CH₂CH₂,

Q representa um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros ou um sistema de anel aromático, com 8, 9 ou 10 membros, anelado, heterobifurcado, em que o anel ou o sistema de anel é eventualmente substituído uma
 25 ou mais vezes, igual ou diferente e em que os substituintes independentes uns dos outros, podem ser selecionados de hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, CO₂H, CO₂NH₂, NO₂, OH, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-

C₄-alquilsulfínica, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfínica, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, C₃-C₆-cicloalquilamino, (C₁-C₆-alquil)carbonila, (C₁-C₆-alcóxi)carbonila, (C₁-C₆-alquil)aminocarbonila, di-(C₁-C₄-alquil)aminocarbonila, tri-(C₁-C₂)alquilsilila, (C₁-C₄-alquil)(C₁-C₄-alcóxi)imino, bem como seus N-óxidos e sais.

3. Compostos da fórmula (I-1)



na qual

R¹ representa hidrogênio,

10 R² representa hidrogênio,

R³ representa C₁-C₄-alquila (metila, etila, n-propila, iso-propila, n-butila, iso-butila, sec-butila ou terc-butila) ou ciano-C₁-C₃-alquila (cianometila, 1-cianoetila, 2-cianoetila, 1-ciano-n-propila, 2-ciano-n-propila, 3-ciano-n-propila, 1-ciano-iso-propila, 2-ciano-iso-propila),

15 R⁴ representa hidrogênio, metila, trifluormetila, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo ou trifluormetóxi,

R⁵ representa metila, flúor, cloro, bromo ou iodo,

R⁷ representa flúor, cloro ou bromo,

X representa N, CCl ou CH,

20 A representa CH₂ ou CH(CH₃),

Q representa um anel heterocíclico aromático eventualmente substituído uma ou mais vezes da série Q-37, Q-38, Q-39, Q-40, Q-58 e Q-59, bem como um anel heterocíclico Q-60 com cinco membros, em que os substituintes independentes uns dos outros podem ser selecionados de C₁-C₃-alquila, C₁-C₃-haloalquila, C₁-C₂-alcóxi, halogênio, ciano, hidróxi, nitro ou

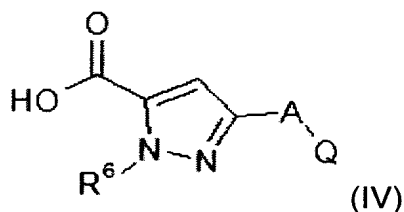
25

C₁-C₂-haloalcóxi,

ou em que os substituintes independentes uns dos outros podem ser selecionados de fenila ou de um anel heteroaromático com 5 ou 6 membros, em que a fenila ou o anel podem ser eventualmente substituídos uma ou mais vezes, igual ou diferente com C₁-C₆-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₂-C₆-alquinila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₆-haloalquila, C₂-C₆-haloalquenila, C₂-C₆-haloalquinila, C₃-C₆-halocicloalquila, halogênio, CN, NO₂, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-haloalcóxi,

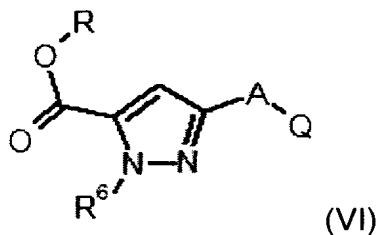
bem como seus N-óxidos e sais.

10 4. Derivados de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (IV)



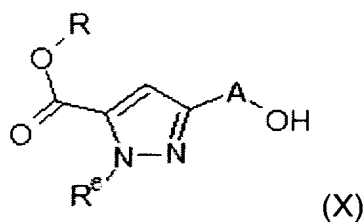
na qual A, Q, R⁶ têm o significado mencionado nas reivindicações 1 a 2.

5. Ésteres de ácido pirazolcarboxílico da fórmula (VI)



na qual A, Q e R⁶ têm o significado mencionado nas reivindicações 1 a 2 e R representa C₁-C₆-alquila.

15 6. Álcoois da fórmula (X)



na qual A e R⁶ têm o significado mencionado nas reivindicações 1 a 2 e R representa C₁-C₆-alquila.

7. Utilização de compostos da fórmula (I) como definido nas rei-

vindicações 1 a 2 para o combate de parasitas animais.

8. Processo para o combate de parasitas animais, caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (I) de acordo com as reivindicações 1 a 2 agem sobre parasitas animais e/ou fungos fitopatogênicos e/ou seu habitat e/ou semente.

9. Processo para a produção de composições agroquímicas, caracterizado pelo fato de que compostos da fórmula (I) como definidos nas reivindicações 1 a 2 são misturados com diluentes e/ou substâncias tensoativas.

10. Utilização de compostos da fórmula (I) como definidos nas reivindicações 1 a 2 para o tratamento de semente.

11. Utilização de compostos da fórmula (I) como definidos nas reivindicações 1 a 2 para o tratamento de plantas transgênicas.

12. Utilização de compostos da fórmula (I) como definidos nas reivindicações 1 a 2 para o tratamento de semente de plantas transgênicas.

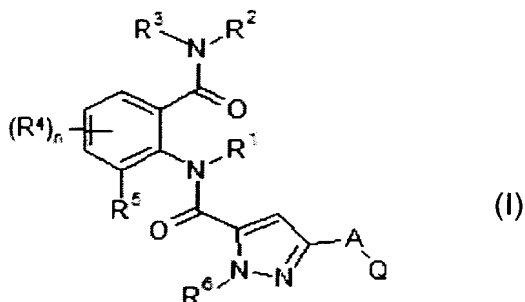
13. Semente, a qual foi tratada com um composto da fórmula (I) como definido nas reivindicações 1 a 2.

RESUMO

Patente de Invenção: "DERIVADOS DE DIAMIDA DE ÁCIDO ANTRANÍLICO COM SUBSTITUINTES HETEROAROMÁTICOS E HETEROCÍCLICOS".

5

A presente invenção refere-se a novos inseticidas da fórmula (I),



na qual R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , A, Q e n podem ter os significados mencionados no relatório descritivo, vários processos para a sua preparação e seu uso como substâncias ativas, especialmente seu uso como composições praguicidas.