

(12) **FASCÍCULO DE PATENTE DE INVENÇÃO**

(51) Classificação Internacional:

A01N 43/80 (2011.01) **A01N 43/78** (2011.01)
A01N 43/76 (2011.01) **A01N 43/56** (2011.01)
A01N 43/36 (2011.01) **A01N 43/32** (2011.01)
A01N 43/30 (2011.01) **A01N 43/10** (2011.01)
A01N 43/08 (2011.01) **A01N 37/20** (2011.01)
C07C 233/87 (2011.01) **C07D 333/40** (2011.01)
C07D 333/38 (2011.01) **C07D 319/20** (2011.01)
C07D 319/18 (2011.01)

(22) Data de pedido: **2005.08.10**

(30) Prioridade(s): **2004.08.12 JP 2004235634**
2005.06.17 JP 2005178614

(43) Data de publicação do pedido: **2007.04.25**

(45) Data e BPI da concessão: **2012.03.21**
101/2012

(73) Titular(es):

ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.
3-15, EDOBORI 1-CHOME, NISHI-KU OSAKA-
SHI, OSAKA 550-0002 JP

(72) Inventor(es):

TETSUO YONEDA JP
SHIGERU MITANI JP
YUJI NAKAMURA JP

(74) Mandatário:

ANTÓNIO JOÃO COIMBRA DA CUNHA FERREIRA
RUA DAS FLORES, Nº 74, 4º AND 1249-235 LISBOA PT

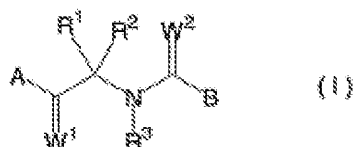
(54) Epígrafe: **COMPOSIÇÃO FUNGICIDA CONTENDO DERIVADO DE AMIDA DE ÁCIDO**

(57) Resumo:

MUITAS COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS CONVENCIONAIS TÊM TIDO PROBLEMAS PRÁTICOS POR O EFEITO PREVENTIVO OU O EFEITO CURATIVO SEREM INADEQUADOS, O EFEITO RESIDUAL TENDER A SER INADEQUADO, OU O EFEITO CONTROLADOR CONTRA DOENÇAS DAS PLANTAS TENDER A SER INADEQUADO DEPENDENDO DO LOCAL DE APLICAÇÃO, E DESEJA-SE UMA COMPOSIÇÃO FUNGICIDA QUE COLMATE ESSES PROBLEMAS. O PRESENTE INVENTO PROPORCIONA UMA COMPOSIÇÃO FUNGICIDA CONTENDO UM DERIVADO DE AMIDA DE ÁCIDO DE FÓRMULA (I) OU UM SEU SAL, COMO COMPONENTE ATIVO: ONDE A É FENILO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, BENZILO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, NAFTILO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, ANEL HETEROCÍCLICO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, ANEL HETEROCÍCLICO FUNDIDO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, OU OUTROS SEMELHANTES; B É ANEL HETEROCÍCLICO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, ANEL HETEROCÍCLICO FUNDIDO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO, OU NAFTILO QUE PODE SER SUBSTITUÍDO; CADA UM DE R1 E R2, QUE SÃO INDEPENDENTES UM DO OUTRO, É ALQUILO, OU SEMELHANTE; R3 É HIDROGÉNIO, OU SEMELHANTE; CADA UM DE W1 E W2, QUE SÃO INDEPENDENTES UM DO OUTRO, É OXIGÉNIO OU ENXOFRE.

RESUMO**"Composição fungicida contendo derivado de amida de ácido"**

Muitas composições fungicidas convencionais têm tido problemas práticos por o efeito preventivo ou o efeito curativo serem inadequados, o efeito residual tender a ser inadequado, ou o efeito controlador contra doenças das plantas tender a ser inadequado dependendo do local de aplicação, e deseja-se uma composição fungicida que colmate esses problemas. O presente invento proporciona uma composição fungicida contendo um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, como componente ativo:



onde A é fenilo que pode ser substituído, benzilo que pode ser substituído, naftilo que pode ser substituído, anel heterocíclico que pode ser substituído, anel heterocíclico fundido que pode ser substituído, ou outros semelhantes; B é anel heterocíclico que pode ser substituído, anel heterocíclico fundido que pode ser substituído, ou naftilo que pode ser substituído; cada um de R^1 e R^2 , que são independentes um do outro, é alquilo, ou semelhante; R^3 é hidrogénio, ou semelhante; cada um de W^1 e W^2 , que são independentes um do outro, é oxigénio ou enxofre.

DESCRIÇÃO

"Composição fungicida contendo derivado de amida de ácido"

Campo Técnico

O presente invento refere-se a uma composição fungicida contendo um derivado de amida de ácido.

Antecedentes do Invento

O pedido WO 00/73290 apresenta carboxamidas de isotiazole e a sua utilização como microbicidas. Da patente EP-A 0334134 conhecem-se benzotiazolonas dissustituídas nas posições 3,7.

Os pedidos WO 2001/60783 e WO 2003/27059 revelam que os derivados de amida de ácido que possuem determinadas estruturas químicas são úteis como componentes ativos para pesticidas, mas não existe qualquer divulgação de que os compostos da fórmula (I) dada a seguir possuam atividades fungicidas. Por outro lado, o pedido de patente japonesa N.º 2003-420864 pelos atuais requerentes, revela uma composição fungicida contendo um derivado de amida ácida como componente ativo, mas o composto componente ativo dessa composição é diferente do composto da fórmula (I) dada a seguir.

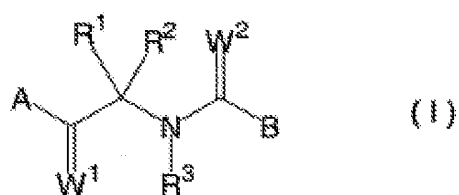
Muitas composições fungicidas convencionais têm tido problemas práticos por o efeito preventivo ou o efeito curativo ser inadequado, o efeito residual tender a ser inadequado, ou o efeito controlador contra doenças de plantas tender a ser inadequado dependendo do local de aplicação. Nesse sentido, deseja-se uma composição fungicida para colmatar esses problemas.

Divulgação do Invento

Os atuais inventores conduziram uma investigação para resolver os problemas anteriores e, como resultado, verificaram que uma composição fungicida contendo um derivado de amida de ácido de fórmula (I), dada a seguir,

exibe excelentes efeitos preventivos e curativos contra várias doenças provocadas por vários fungos nocivos como oomicetes, ascomicetes, basidiomicetes, ou deuteromicetes e, ao mesmo tempo, possui atividades residuais satisfatórias do ponto de vista prático. O presente invento foi realizado com base nesta constatação.

Especificamente, o presente invento proporciona uma composição fungicida contendo um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal como componente ativo:



onde

A é fenilo que pode ser substituído por X,

benzodioxolanilo que pode ser substituído por X, ou

benzodioxanilo que pode ser substituído por X;

B é furilo que pode ser substituído por Y, ou

tienilo que pode ser substituído por Y,

cada R^1 e R^2

é alquilo, ou

R^1 e R^2 podem formar, juntos, um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros;

X é flúor, cloro, iodo, alquilo, halogeneoalquilo, alcoxí, ou

halogenoalcoxí;

Y é halogéneo, alquilo, halogenoalquilo, alcoxí, ou halogenoalcoxí;

R^3 é hidrogénio; e

cada W^1 e W^2 é oxigénio.

O presente invento proporciona também uma composição de mistura de fungicidas compreendendo, como componentes ativos, um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, e um outro composto componente ativo fungicida.

O presente invento proporciona também um método para controlar fungos nocivos, que compreende a aplicação de uma

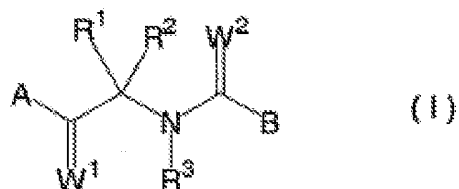
quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal.

O presente invento proporciona também um método para controlar doenças em plantas, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal.

O presente invento proporciona também um método para proteger plantas cultivadas, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal.

O presente invento proporciona também um método para melhorar o rendimento das culturas, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal.

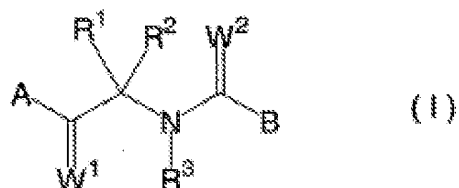
O presente invento proporciona também um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal:



onde A é fenilo que pode ser substituído por X, benzodioxolanilo que pode ser substituído por X, ou benzodioxanilo que pode ser substituído por X; B é furilo que pode ser substituído por Y, ou tienilo que pode ser substituído por Y, cada R^1 e R^2 é alquilo, ou R^1 e R^2 podem formar, juntos, um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é flúor, cloro, iodo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi; Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi; R^3 é hidrogénio; e cada W^1 e W^2 é oxigénio.

O presente invento proporciona também uma utilização de um derivado de amida de ácido de fórmula (I), apresentada a seguir, ou de um seu sal como fungicida agrícola ou hortícola para controlar fungos nocivos selecionados de

oomicetes, ascomicetes, Basidiomicetes ou deuteromicetes.



onde

A é fenilo que pode ser substituído por X, naftilo que pode ser substituído por X, anel heterocíclico que pode ser substituído por X, ou anel heterocíclico fundido que pode ser substituído por X; B é um anel heterocíclico de 5 membros que é substituído por Y; X é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxialquilo, dialquilaminoalquilo, alcinilo, trialquilsililalcinilo, hidroxí, alcoxi, halogeneto de alcoxi, alcoxialcoxi, cicloalquilo, nitro, fenilo, fenilalcinilo, piridiloxi, que pode ser substituído por halogeneto de alquilo, alquilcarboniloxi, alquilsulfoniloxi, ou anel heterocíclico (o anel heterocíclico pode ser substituído por halogéneo, alquilo, ou alquilcarbonilo); Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, halogeneto de alcoxi, cicloalquilo, ou formilo; cada R^1 e R^2 , independentemente do outro, é hidrogénio, ou alquilo; R^3 é hidrogénio, alquilo, alquilcarbonilo ou alcoxycarbonilo; e cada W^1 e W^2 , independentemente um do outro, é oxigénio ou enxofre.

Na fórmula (I) anterior, o número de substituintes X contidos em A pode ser um ou mais e, no caso de ser mais do que um, esses substituintes podem ser o mesmo ou diferentes.

O número de substituintes Y contidos em B pode ser um ou mais e, no caso de ser mais do que um, esses substituintes podem ser o mesmo ou diferentes.

O número de átomos de halogéneo, grupos alquilo ou alquilcarbonilo, que são substituintes no anel heterocíclico contido em X pode ser um ou mais e, no caso de ser mais do que um, esses substituintes podem ser o mesmo ou diferentes.

O anel heterocíclico em A, B ou X é, de preferência, um

anel heterocíclico de 3, 5 ou 6 membros, contendo de 1 a 4 átomos de pelo menos um tipo selecionado do grupo que consiste em O, S e N, e pode ser, por exemplo, um anel heterocíclico de 3 membros como o oxiranilo; um anel heterocíclico de 5 membros como o furilo, tetra-hidrofurilo, tienilo, pirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, dioxolanilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, pirazolilo, pirazolinilo, pirazolidinilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo ou tetrazolilo; anel heterocíclico de 6 membros como o piranilo, piridilo, piperidinilo, dioxanilo, oxazinilo, morfolinilo, tiazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piperazinilo ou triazinilo.

O anel heterocíclico fundido em A é, de preferência, um anel heterocíclico fundido de 8 a 10 membros, contendo de 1 a 4 átomos de pelo menos um tipo selecionado do grupo que consiste em O, S e N, e pode ser, por exemplo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, di-hidrobenzofuranilo, di-hidroisobenzofuranilo, benzotienilo, isobenzotienilo, di-hidrobenzotienilo, di-hidroisobenzotienilo, tetra-hidrobenzotienilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzodioxolanilo, benzodioxanilo, cromenilo, cromanilo, isocromanilo, cromonilo, cromanonilo, quinolilo, isoquinolilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, indolizininilo, quinolizininilo, imidazopiridilo, naftiridinilo, pteridinilo, di-hidrobenzoxazinilo, di-hidrobenzoxazolinonilo, di-hidrobenzoxazinonilo ou benzotioxanilo.

O alquilo ou a porção alquilo em X, Y ou R¹ a R³, podem ser lineares ou ramificados, e como seus exemplos específicos podem-se mencionar alquilos C₁₋₇ como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, t-butilo, pentilo, hexilo ou heptilo.

O cicloalquilo ou a porção cicloalquilo em X ou Y podem ser um que possua de 3 a 6 átomos de carbono, como ciclopropilo, ciclopentilo ou ciclo-hexilo. Também, um exemplo específico do anel carbocíclico saturado de 3 a 6 membros que R¹ e R² podem formar, juntos, pode ser

ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo ou ciclo-hexilo.

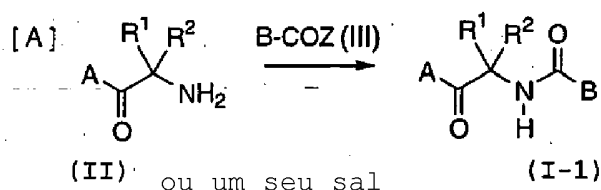
O alcinilo ou a porção alcinilo em X pode ser um linear ou ramificado que possua de 2 a 7 átomos de carbono, tal como etinilo, 2-butinilo, 2-pentinilo, 3-hexinilo ou 4-dimetil-2-pentinilo.

O halogéneo ou o halogéneo substituinte em A, X ou Y, pode ser um átomo de flúor, cloro, bromo ou iodo. O número de átomos de halogéneo como substituintes pode ser um ou mais e, no caso de ser mais do que um, esses halogéneos podem ser o mesmo ou diferentes. Ainda, esses halogéneos podem estar substituídos em qualquer uma das posições.

O sal do derivado de amida de ácido da fórmula (I) anterior pode ser qualquer sal desde que seja aceitável do ponto de vista agrícola. Por exemplo, pode ser um sal de metais alcalinos como por exemplo um sal de sódio ou um sal de potássio; um sal de metais alcalino-terrosos como por exemplo um sal de magnésio ou um sal de cálcio; um sal de ácidos inorgânicos como por exemplo um cloridrato, um perclorato, um sulfato ou um nitrato; ou um sal de ácidos orgânicos como por exemplo um acetato ou um metanossulfonato.

O derivado de amida de ácido de fórmula (I) anterior possui vários isómeros, como por exemplo isómeros óticos ou isómeros geométricos, e o presente invento inclui os isómeros e as misturas desses isómeros. Para além disso, o presente invento inclui também vários isómeros diferentes dos isómeros anteriores, do âmbito do vulgar conhecimento relacionado com a especialidade. Ainda, dependendo dos tipos de isómeros, estes podem possuir estruturas químicas diferentes da fórmula (I) anterior, mas encontram-se no âmbito do presente invento, desde que seja óbvio para os especialistas na matéria que estes são isómeros.

O derivado de amida de ácido de fórmula (I) anterior ou um seu sal pode ser produzido pelas seguintes reações (A) a (K), (U) a (W), ou por um processo vulgar para a produção de um sal.

Reação (A)

Na reação (A), A, B, R¹ e R², são conforme anteriormente definido. Z é hidroxí, alcóxi ou halogéneo, e o halogéneo pode ser um átomo de flúor, cloro, bromo ou iodo.

A reação (A) pode ser efetuada normalmente na presença de uma base e de um solvente.

A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um metal alcalino como o sódio ou o potássio; um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, etóxido de sódio ou butóxido terciário de potássio; um carbonato como o carbonato de sódio ou o carbonato de potássio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio; um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio; um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio; uma amina como a monometilamina, dimetilamina ou trimetilamina; uma piridina como a piridina ou a 4-dimetilaminopiridina; e um organolítio como o metil-lítio, n-butil-lítio ou diisopropilamida de lítio. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 3 moles, de preferência de 1 a 2 moles, por mole de composto de fórmula (II).

O solvente pode ser qualquer solvente desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclohexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente aprótico polar como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a

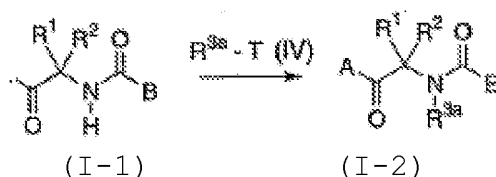
dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona, o acetonitrilo ou propionitrilo de piridina; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona.

A reação (A) pode ser efetuada, se necessário, na presença de um agente de condensação por desidratação. O agente de condensação por desidratação pode ser, por exemplo, N,N'-diciclo-hexilcarbodi-imida, isocianato de clorossulfonilo, N,N'-carbonildi-imidazole e anidrido trifluoroacético.

A temperatura reacional para a reação (A) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 0°C a 50°C, e o tempo de reação é normalmente de 0,5 a 48 horas, de preferência de 1 a 24 horas.

Reação (B)

[B]



Na reação (B), A, B, R¹ e R², são conforme anteriormente definido e R^{3a} é alquilo, alquilcarbonilo ou alcoxicarbonilo e T é halogéneo, e o halogéneo pode ser um átomo de flúor, cloro, bromo ou iodo.

A reação (B) pode ser efetuada normalmente na presença de uma base e de um solvente.

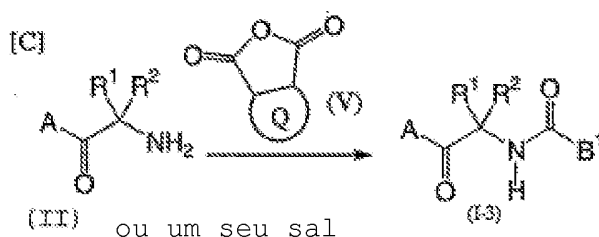
A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um metal alcalino como o sódio ou o potássio; um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, etóxido de sódio ou butóxido terciário de potássio; um carbonato como o carbonato de sódio ou o carbonato de potássio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio; um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio; um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio; uma amina como a monometilamina, dimetilamina ou trietilamina; e uma piridina como a piridina ou a 4-dimetilaminopiridina. A

base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 3 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (I-1).

O solvente pode ser qualquer solvente desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como o benzeno, o tolueno, o xileno ou o clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloroeto de carbono, o cloreto de metilo, o clorofórmio, o diclorometano, o dicloroetano, o tricloroetano, o hexano ou o ciclo-hexano; um éter como o dioxano, o tetra-hidrofurano, o éter dietílico ou o dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona.

A temperatura reacional para a reação (B) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 0°C a 50°C, e o tempo de reação é normalmente de 1 a 300 horas, de preferência de 1 a 150 horas.

Reação (C) (Referência)



Na reação (C), A, R¹ e R², são conforme anteriormente definido e B¹ é um anel heterocíclico substituído com -CO₂H, ou um anel heterocíclico fundido substituído com -CO₂H. A fórmula (V) é ácido dicarboxílico anidro de Q (fenilo, um heterociclo ou um heterociclo fundido).

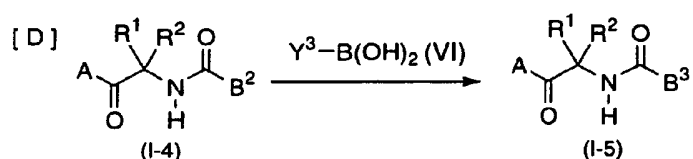
A reação (C) pode ser efetuada normalmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um

ou mais seleccionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como o benzeno, o tolueno, o xileno ou o clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, o cloreto de metilo, o clorofórmio, o diclorometano, o dicloroetano, o tricloroetano, o hexano ou o ciclo-hexano; um éter como o dioxano, o tetra-hidrofurano, o éter dietílico ou o dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; e um álcool como o metanol, o etanol, o propanol e o t-butanol.

A reação (C) pode ser efetuada, se necessário, na presença de uma base. A base pode ser uma ou mais seleccionadas corretamente de, por exemplo, um metal alcalino como o sódio ou o potássio; um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, o etóxido de sódio ou o butóxido terciário de potássio; um carbonato como o carbonato de sódio ou o carbonato de potássio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio; um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio; um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio; uma amina como a monometilamina, a dimetilamina ou a trietilamina; e uma piridina como a piridina ou a 4-dimetilaminopiridina. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 3 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (II).

A temperatura reacional para a reação (C) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 0°C a 80°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 96 horas, de preferência de 1 a 48 horas.

Reação (D) (Referência)



Na reação (D), A, R¹ e R², são conforme anteriormente definido. B² é um anel heterocíclico substituído com Y², ou um anel heterocíclico fundido substituído com Y²; B³ é um anel heterocíclico substituído com Y³, ou um anel heterocíclico fundido substituído com Y³; Y² é um átomo de cloro, bromo ou iodo, e Y³ é um anel heterocíclico insaturado (o anel heterocíclico insaturado pode ser substituído com halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi ou halogeneto de alcoxi).

A reação (D) pode ser efetuada normalmente na presença de um catalisador, uma base, um solvente e um gás inerte.

O catalisador pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, complexos de paládio como o *tetraquis*(trifenilfosfina)paládio(0), o *bis*(dibenzilidenoacetona)paládio(0), e o *tris*(dibenzilidenoacetona)-dipaládio(0).

A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um carbonato como o carbonato de sódio, o carbonato de potássio ou o carbonato de cálcio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio; e um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 20 moles, de preferência de 1 a 10 moles, por mole de composto de fórmula (I-4).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como o benzeno, o tolueno, o xileno ou o clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, o cloreto de metilo, o clorofórmio, o diclorometano, o dicloroetano, o tricloroetano, o hexano ou o ciclo-hexano; um éter como o dioxano, o tetra-hidrofurano, o éter dietílico ou o dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o

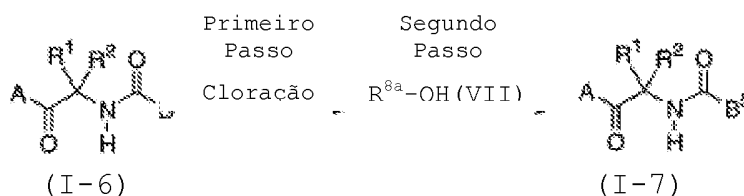
propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; e um álcool como o metanol, o etanol, o propanol e o t-butanol; e água.

O gás inerte pode ser, por exemplo, gás azoto ou gás árgon.

A temperatura reacional para a reação (D) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 15°C a 100°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 96 horas, de preferência de 1 a 48 horas.

Reação (E) (Referência)

[E]



Na reação (E), A, R¹ e R², são conforme anteriormente definido e B⁴ é um anel heterocíclico substituído com -CO₂H, ou um anel heterocíclico fundido substituído com -CO₂H, B⁵ é um anel heterocíclico substituído com -CO₂R^{8a}, ou um anel heterocíclico fundido substituído com -CO₂R^{8a}, e R^{8a} é alquilo, halogeneto de alquilo, alcóxialquilo ou halogeneto de alcóxialquilo.

O primeiro passo na reação (E) pode ser efetuado na presença de um agente de cloração. O agente de cloração pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, cloreto de tionilo, cloreto de oxalilo e pentacloreto de fósforo.

O primeiro passo na reação (E) pode ser efetuado, se necessário, na presença de solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-

hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo.

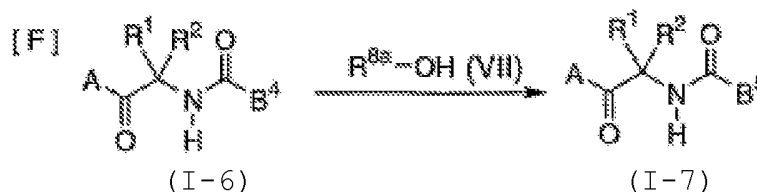
A temperatura reacional no primeiro passo da reação (E) é normalmente de 0°C a 200°C, de preferência de 15°C a 150°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 72 horas, de preferência de 0,5 a 3 horas.

O segundo passo na reação (E) pode ser efetuado, se necessário, na presença de uma base. A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um metal alcalino como o sódio ou o potássio; um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, etóxido de sódio ou butóxido terciário de potássio; um carbonato como o carbonato de sódio ou o carbonato de potássio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio; um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio; um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio; uma amina como a monometilamina, dimetilamina ou trietilamina; e uma piridina como a piridina ou a 4-dimetilaminopiridina. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 5 moles, de preferência de 1 a 2 moles, por mole de composto de fórmula (I-6).

O segundo passo na reação (E) pode ser efetuado, se necessário, na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona. Ainda, nesta reação, o composto de fórmula (VII) pode servir também como solvente se usado em excesso.

A temperatura reacional no segundo passo da reação (E) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 0°C a 50°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 48 horas, de preferência de 0,5 a 6 horas.

Reação (F) (Referência)



Na reação (F), A, B^4 , B^5 , R^1 e R^2 e R^{8a} são conforme foi anteriormente definido.

A reação (F) pode ser efetuada normalmente na presença de um catalisador ou de um agente de condensação por desidratação.

O catalisador pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um ácido mineral como o ácido clorídrico ou o ácido sulfúrico; um ácido orgânico como o ácido paratoluenossulfônico; e um ácido de Lewis como o eterato de trifluoreto de boro.

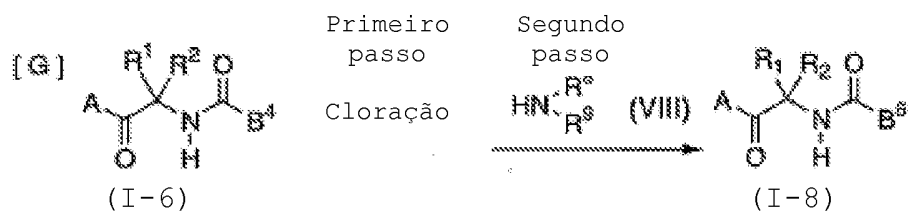
O agente de condensação por desidratação pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, N,N'-diciclo-hexilcarbodi-imida, isocianato de clorossulfonilo, N,N'-carbonildi-imidazole e anidrido trifluoroacético.

A reação (F) pode ser efetuada, se necessário, na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como

o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; e um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol. Ainda, nesta reação, o composto de fórmula (VII) pode servir também como solvente se usado em excesso.

A temperatura reacional na reação (F) é normalmente de 0°C a 200°C, de preferência de 0°C a 100°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 96 horas, de preferência de 0,5 a 24 horas.

Reação (G) (Referência)



Na reação (G), A, B⁴, R¹, R², R⁸ e R⁹ são conforme foi anteriormente definido, e B⁶ é um anel heterocíclico substituído com -CONR⁸R⁹, ou um anel heterocíclico fundido substituído com -CONR⁸R⁹ (onde cada R⁸ e R⁹, independentemente um do outro, é hidrogénio, alquilo, halogeneto de alquilo, alcóxialquilo, ou halogeneto de alcóxialquilo e onde R⁸ e R⁹ adjacentes podem juntos formar um anel).

O primeiro passo na reação (G) pode ser efetuado em conformidade com o primeiro passo na reação (E) atrás descrita.

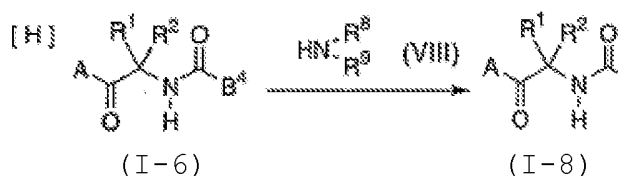
O segundo passo na reação (G) pode ser efetuado, se necessário, na presença de uma base. A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um metal alcalino como o sódio ou o potássio; um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, etóxido de sódio ou butóxido terciário de potássio; um carbonato como o carbonato de sódio ou o carbonato de potássio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de

potássio; um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio; um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio; uma amina como a monometilamina, dimetilamina ou trietilamina; e uma piridina como a piridina ou a 4-dimetilaminopiridina. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 10 moles, de preferência de 1 a 2 moles, por mole de composto de fórmula (I-6).

O segundo passo na reação (G) pode ser efetuado, se necessário, na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; e água.

A temperatura reacional no segundo passo da reação (G) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 0°C a 50°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 48 horas, de preferência de 0,5 a 6 horas.

Reação (H) (Referência)



Na reação (H), A, B⁴, B⁶, R¹, R², R⁸ e R⁹ são conforme foi anteriormente definido.

A reação (H) pode ser efetuada normalmente na presença de um agente de condensação por desidratação e de um

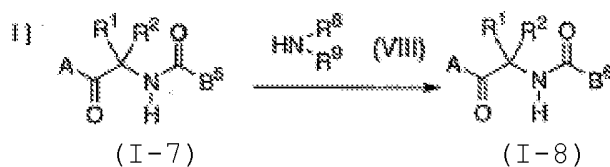
solvente.

O agente de condensação por desidratação pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, N,N'-diciclo-hexilcarbodi-imida, isocianato de clorossulfonilo, N,N'-carbonildi-imidazole e anidrido trifluoroacético.

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona.

A temperatura reacional na reação (H) é normalmente de 0°C a 200°C, de preferência de 0°C a 100°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 96 horas, de preferência de 0,5 a 24 horas.

Reação (I) (Referência)



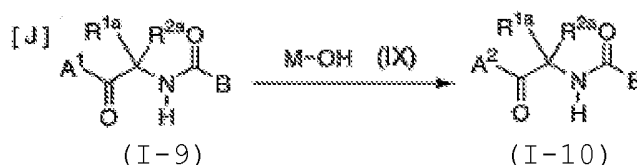
Na reação (I), A, B⁵, B⁶, R¹, R², R⁸ e R⁹ são conforme foi anteriormente definido.

A reação (I) pode ser efetuada normalmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um

hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclohexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; e água. Ainda, nesta reação, o composto de fórmula (VIII) pode servir também como solvente se usado em excesso.

A temperatura reacional na reação (I) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 0°C a 80°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 48 horas, de preferência de 0,5 a 24 horas.

Reação (J)



Na reação (J), B é conforme foi anteriormente definido, A¹ é fenilo substituído com -OR⁴, naftilo substituído com -OR⁴, um anel heterocíclico substituído com -OR⁴, ou um anel heterocíclico fundido substituído com -OR⁴ (onde R⁴ é -C(=W³)R¹², -C(HW³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR¹²R¹³, -S(O)_mR¹², -S(O)_mNR¹²R¹³, ou um anel heterocíclico (o anel heterocíclico pode ser substituído com halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, halogeneto de alcoxi, ou alquilcarbonilo);

Cada R¹² e R¹³, independentemente do outro, é alquilo que pode ser substituído com E³, alcoxi, halogeneto de alcoxi, cicloalquilo que pode ser substituído com J, ou fenilo (o fenilo pode ser substituído com halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, halogeneto de alcoxi, ou

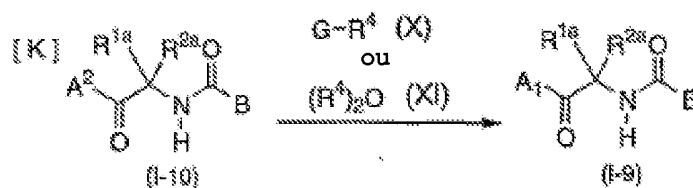
alquilcarbonilo); ou R^{12} e R^{13} adjacentes podem juntos formar um anel; cada W^3 é oxigénio ou enxofre; cada m e n, independentemente do outro, é um inteiro de 0 a 2;

E^3 é halogéneo/ alcoxí, alquiltio, amina, monoalquilamina, dialquilaraina, cicloalquilo, ciano, alcoxycarbonilo, halogeneto de alcoxí, halogeneto de alquiltio/ ou fenilo (o fenilo pode ser substituído com halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxí, halogeneto de alcoxí, ou alquilcarbonilo); e J é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo/ alcoxí, ou halogeneto de alcoxí.

A^2 é fenilo substituído com -OH, naftilo substituído com -OH, um anel heterocíclico substituído com -OH ou um anel heterocíclico fundido substituído com -OH, cada R^{1a} e R^{2a} é alquilo, e R^{1a} e R^{2a} podem juntos formar um anel carbocíclico saturado de 3 a 6 membros; e M é sódio ou potássio.

A reação (J) pode ser efetuada normalmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclohexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; e água.

A temperatura reacional na reação (J) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 20°C a 80°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 24 horas, de preferência de 0,1 a 12 horas.

Reação (K)

Na reação (K), A^1 , A^2 , B, R^{1a} , R^{2a} e R^4 são conforme foi anteriormente definido, G é um átomo de cloro, bromo ou iodo.

A reação (K) pode ser efetuada normalmente na presença de uma base e de um solvente.

A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, o etóxido de sódio ou o butóxido terciário de potássio; um carbonato como o carbonato de sódio ou o carbonato de potássio; um bicarbonato como o bicarbonato de sódio ou o bicarbonato de potássio; um hidróxido de metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio; um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio; uma amina como a monometilamina, a dimetilamina ou a trietilamina; e uma piridina como a piridina ou a 4-dimetilaminopiridina. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 2 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (I-10).

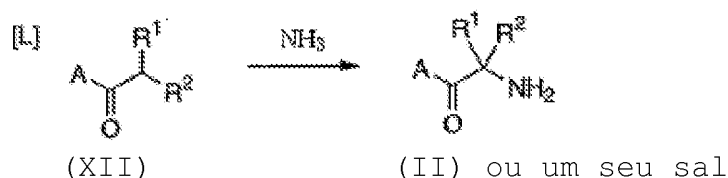
O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como tetracloreto de carbono, cloreto de metilo, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclohexano; um éter como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um nitrilo como o acetonitrilo, o

propionitrilo ou o acrilonitrilo; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona.

A temperatura reacional na reação (K) é normalmente de -20°C a 100°C, de preferência de 0°C a 50°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 24 horas, de preferência de 0,1 a 12 horas.

O composto de fórmula (II) a utilizar nas reações (A) ou (C) anteriores pode ser produzido pelas reações (L) a (N) que se seguem.

Reação (L)



Na reação (L), A, R¹ e R² são conforme foi anteriormente definido. Na reação (L) pode ser produzido um sal do composto (II) por tratamento posterior da reação ou em conformidade com uma reação vulgar para a formação de um sal.

A reação (L) pode ser efetuada normalmente na presença de um agente de oxidação e de um solvente.

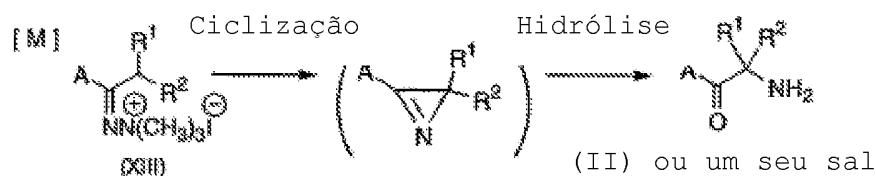
O agente de oxidação pode ser, por exemplo, ferrocianeto de potássio. O agente de oxidação pode ser utilizado numa quantidade de 1 a 10 moles, de preferência de 1 a 5 moles, por mole de composto de fórmula (XII).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais seleccionados corretamente de, por exemplo, um éter como o dioxano, o tetra-hidrofurano, o éter dietílico ou o dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona, a piridina, o acetonitrilo ou o propionitrilo; e uma cetona como a acetona

ou a etilmetilcetona.

A temperatura reacional na reação (L) é normalmente de 20°C a 150°C, de preferência de 50°C a 100°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 30 horas, de preferência de 1 a 20 horas.

Reação (M)



Na reação (M), A, R¹ e R² são conforme foi anteriormente definido. Na reação (M) pode ser produzido um sal do composto (II) por tratamento posterior da reação ou em conformidade com uma reação vulgar para a formação de um sal.

A reação de ciclização na reação (M) pode ser efetuada normalmente na presença de uma base e de um solvente.

A base pode ser uma ou mais selecionadas corretamente de, por exemplo, um metal alcalino como o sódio ou o potássio; um alcóxido de metal alcalino como o metóxido de sódio, etóxido de sódio ou t-butóxido de potássio; e um hidreto de metal como o hidreto de sódio ou o hidreto de potássio. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 3 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (XIII).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um éter como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; e um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo.

A temperatura reacional na reação de ciclização da reação

(M) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 30°C a 100°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 24 horas, de preferência de 1 a 12 horas.

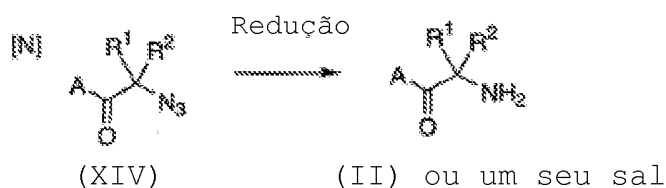
A reação hidrolítica da reação (M) pode ser efetuada em conformidade com uma vulgar reação hidrolítica e pode ser efetuada normalmente na presença de um ácido ou de uma base e de um solvente.

O ácido pode ser, por exemplo, cloreto de hidrogénio ou ácido sulfúrico. A base pode ser, por exemplo, um hidróxido de um metal como o hidróxido de sódio ou o hidróxido de potássio.

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; um nitrilo como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; e água.

A temperatura reacional na reação hidrolítica da reação (M) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 20°C a 80°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 12 horas, de preferência de 0,1 a 1 hora.

Reação (N)



Na reação (N), A, R¹ e R² são conforme foi anteriormente definido. Na reação (N) pode ser produzido um sal do composto (II) por tratamento posterior da reação ou em conformidade com uma reação vulgar para a formação de um sal.

A reação de redução na reação (N) pode ser, por exemplo, redução catalítica, redução por um hidreto de metal (como o

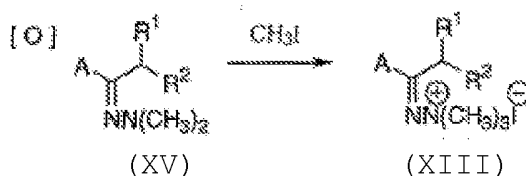
boro-hidreto de sódio, ou hidreto de alumínio-lítio); redução por, por exemplo, trifenilfosfina, sulfureto de dimetilo ou sulfureto de difenilo; ou redução num sistema reacional constituído por um metal como o ferro ou o cobre e um ácido carboxílico como o ácido fórmico ou o ácido acético. A redução catalítica é normalmente efetuada numa atmosfera de hidrogénio usando um catalisador, como a platina, o óxido de platina, o negro de platina, o níquel de Raney, o paládio, o paládio-carbono, o ródio ou o ródio-alumina.

A reação (N) pode ser efetuada normalmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno ou xileno; um hidrocarboneto alifático como o hexano ou o ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona, a piridina, o acetonitrilo ou o propionitrilo; uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; e água.

A temperatura reacional na reação (N) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 0°C a 80°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 96 horas, de preferência de 1 a 48 hora.

O composto de fórmula (XIII) a usar na reação (M) anterior pode ser produzido pela reação (O) que se segue.

Reação (O)



Na reação (O), A, R¹ e R² são conforme foi anteriormente

definido.

A reação (O) pode ser efetuada, se necessário, na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação, e por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; um solvente polar aprótico como o acetonitrilo, o propionitrilo ou o acrilonitrilo; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona.

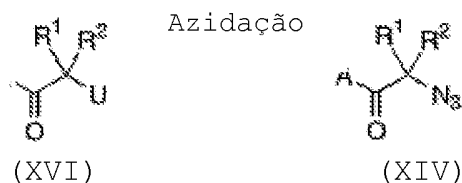
O iodeto de metilo na reação (O) pode ser utilizado numa quantidade de 1 a 10 moles, de preferência de 1 a 3 moles, por mole de composto de fórmula (XV). Para além disso, o iodeto de metilo pode servir também como solvente se usado em excesso.

A temperatura reacional na reação (O) é normalmente de 0°C a 100°C, de preferência de 10°C a 50°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 48 horas, de preferência de 1 a 24 horas.

O composto de fórmula (XIV) a usar na reação (N) anterior pode ser produzido pela reação (P) que se segue.

Reação (P)

[P]



Na reação (P), A, R¹ e R² são conforme foi anteriormente definido, U é um átomo de cloro ou bromo.

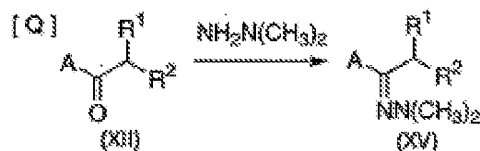
A reação (P) pode ser efetuada na presença de um agente de azidação. O agente de azidação pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, azida de sódio, azida de potássio e azida de trimetilsililo.

A reação (P) pode ser efetuada normalmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona, a piridina, o acetonitrilo ou o propionitrilo; e uma cetona como a acetona ou a etilmetilcetona; um álcool como o metanol, o etanol, o propanol ou o t-butanol; e água.

A temperatura reacional na reação (P) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 20°C a 90°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 96 horas, de preferência de 0,5 a 12 horas.

O composto de fórmula (XV) a usar na reação (O) anterior pode ser produzido pela reação (Q) que se segue.

Reação (Q)



Na reação (Q), A, R¹ e R² são conforme foi anteriormente definido.

A reação (Q) pode ser efetuada em conformidade com uma vulgar reação de síntese de hidrazona e, se necessário, na

presença de um agente de desidratação e/ou um catalisador.

Como agente de desidratação pode mencionar-se, por exemplo, um peneiro molecular. O agente de desidratação pode ser utilizado normalmente de 1 a 30 vezes, de preferência de 5 a 10 vezes, em relação ao peso do composto de fórmula (XII).

O catalisador pode ser, por exemplo, tetracloreto de titânio.

A dimetil-hidrazina na reação (Q) pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 30 moles, de preferência de 5 a 10 moles, por mole de composto de fórmula (XII).

A temperatura reacional na reação (Q) é normalmente de 20°C a 150°C, de preferência de 50°C a 120°C. O tempo de reação é normalmente de 5 a 200 horas, de preferência de 24 a 120 horas.

O composto de fórmula (XVI) a usar na reação (P) anterior pode ser produzido pela reação (R) que se segue.

Reação (R)



Na reação (R), A, R¹, R² e U são conforme foi anteriormente definido.

A reação (R) pode ser efetuada na presença de um agente de cloração ou de um agente de bromação. O agente de cloração pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, cloro e N-clorosuccinimida. O agente de bromação pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, bromo, N-bromosuccinimida e tribrometo de feniltrimetilamónio.

A reação (R) pode ser efetuada normalmente na presença

de um solvente. O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto alifático como o tetracloreto de carbono, o cloreto de metilo, o clorofórmio, o diclorometano, o dicloroetano, o tricloroetano, o hexano ou o ciclo-hexano; um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster como o acetato de metilo ou o acetato de etilo; um solvente polar aprótico como o sulfóxido de dimetilo, o sulfolano, a dimetilacetamida, a dimetilformamida, a N-metilpirrolidona ou a piridina; um ácido orgânico como o ácido acético ou o ácido propiônico; e água.

A reação (R) pode ser efetuada, se necessário, na presença de uma base ou de um ácido.

A base pode ser, por exemplo, di-isopropilamida de lítio. A base é utilizada numa quantidade de 1 a 2 moles, de preferência de 1 a 1,2 moles, por mole de composto de fórmula (XII).

Quando a reação é efetuada na presença de uma base, o solvente pode ser normalmente um ou mais selecionados corretamente de éteres como o tetra-hidrofurano e o éter dietílico.

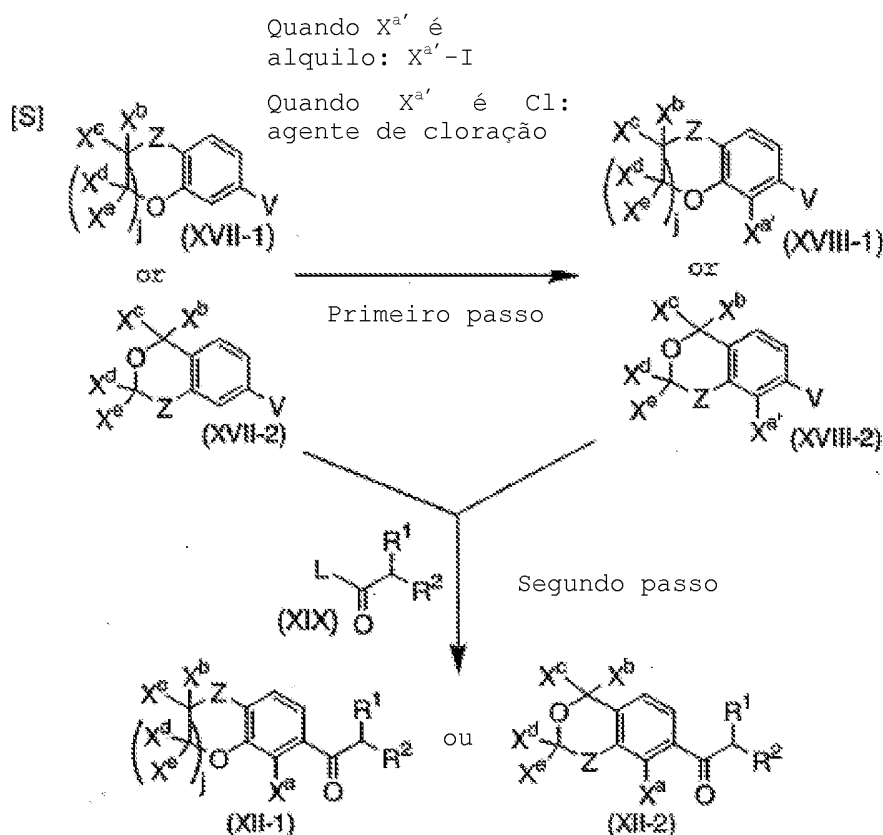
O ácido pode ser um ou mais selecionados de, por exemplo, um ácido orgânico como o ácido acético ou o ácido propiônico, e cloreto de alumínio. O ácido é utilizado normalmente numa quantidade catalítica. Também, se for utilizado em excesso, o ácido orgânico usado como solvente pode servir como solvente e como ácido.

A temperatura reacional na reação (R) é normalmente de -100°C a 150°C, de preferência de -78°C a 110°C. O tempo de reação é normalmente de 0,1 a 48 horas, de preferência de 0,5 a 24 horas. No entanto, se for efetuada na presença de uma base, a temperatura reacional será normalmente de -100°C a 0°C, de preferência de -78°C a -20°C e o tempo de reação será normalmente de 0,1 a 12 horas, de preferência de 0,5 a 6 horas. Se for efetuada na presença de um ácido, a temperatura reacional será normalmente de 0°C a 150°C, de

preferência de 20°C a 110°C e o tempo de reação será normalmente de 0,1 a 48 horas, de preferência de 1 a 24 horas.

O composto de fórmula (XII) a usar na reação (Q) anterior é um composto conhecido, ou pode ser produzido pelas seguintes reações (S) a (T) ou por métodos em conformidade com as mesmas.

Reação (S)



Na reação (S), R^1 e R^2 são conforme foi anteriormente definido, e Z é um átomo de oxigénio ou $-C(G^1JG^2-$, X^a é um átomo de hidrogénio, átomo de cloro ou alquilo, $X^{a'}$ é um átomo de cloro ou alquilo, cada X^b , X^c , X^d , X^e , G^1 e G^2 é um átomo de hidrogénio, flúor ou cloro, V é um átomo de bromo ou de iodo, e j é 0 ou 1.

O primeiro passo na reação (S) pode ser efetuado na presença de uma base e de um solvente.

A base pode ser corretamente selecionada de um composto

organolítio como a di-isopropilamida de lítio. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 2 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1) ou (XVII-2).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um éter como o dioxano, tetra-hidrofurano e éter dietílico.

O agente de cloração a usar no primeiro passo da reação (S) pode ser, por exemplo, N-clorosuccinimida.

A fórmula: $X^{a'}-I$ a usar no primeiro passo da reação (S) pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 10 moles, de preferência de 1 a 5 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1) ou (XVII-2). Ainda, o agente de cloração a usar no primeiro passo da reação (S) é usado numa quantidade de 1 a 5 moles, de preferência de 1 a 3 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1) ou (XVII-2).

O primeiro passo da reação (S) pode ser efetuado, se necessário, na presença de um gás inerte. O gás inerte pode ser selecionado corretamente de, por exemplo, gás azoto ou gás argon.

A temperatura reacional no primeiro passo na reação (S) é normalmente de -100°C a 50°C , de preferência de -70°C a 25°C . O tempo de reação é normalmente de 1 a 48 horas, de preferência de 1 a 20 horas.

O segundo passo da reação (S) pode ser efetuado, normalmente na presença de uma base e de um solvente.

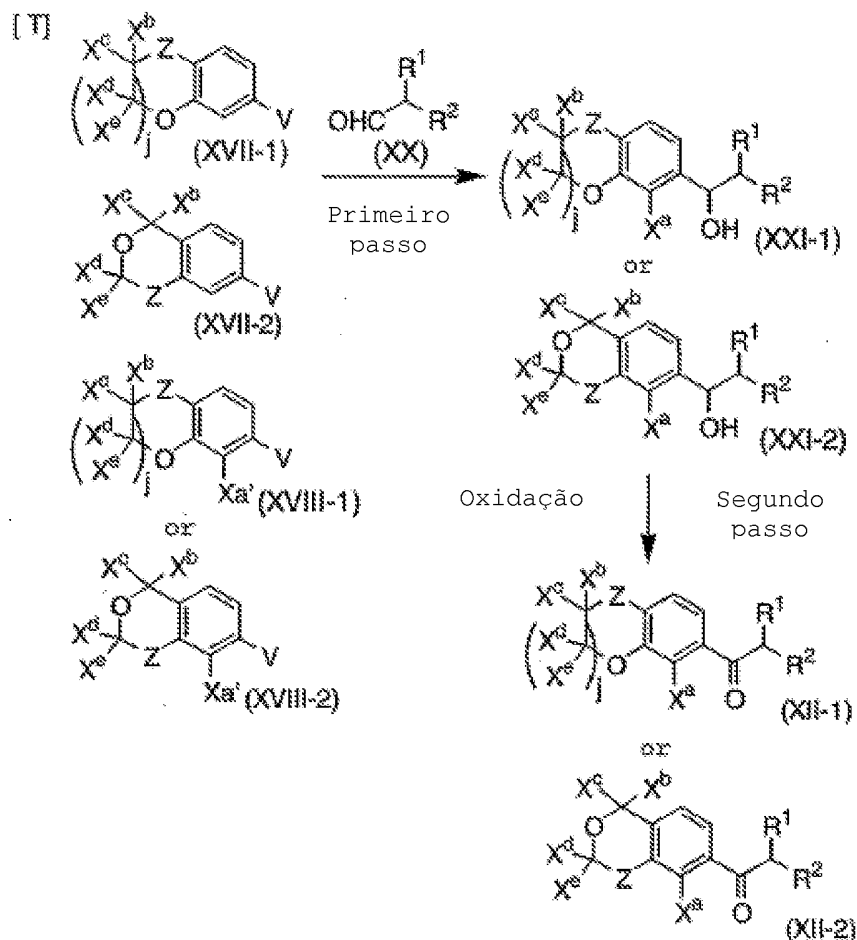
A base pode ser uma ou mais corretamente selecionada de, por exemplo, um composto organolítio como o metil-lítio e o n-butil-lítio; e compostos de Grignard como o cloreto de isopropilmagnésio. A base pode ser utilizada numa quantidade de 1 a 2 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) ou (XVIII-2).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um éter como o dioxano, o tetra-hidrofurano e o éter dietílico.

O composto de fórmula (XIX) a usar no segundo passo da reação (S) é usado numa quantidade de 1 a 3 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) ou (XVIII-2).

O segundo passo da reação (S) pode ser efetuado, se necessário, na presença de um gás inerte. O gás inerte pode ser selecionado corretamente de, por exemplo, gás azoto e gás árgon.

A temperatura reacional no segundo passo da reação (S) é normalmente de -100°C a 50°C, de preferência de -70°C a 25°C. O tempo de reação é normalmente de 1 a 48 horas, de preferência de 1 a 20 horas.

Reação (T)

Na reação (T), R^1 , R^2 , Z , X^a , $X^{a'}$, X^b , X^c , X^d , X^e , V e j são conforme foi anteriormente definido.

O primeiro passo da reação (T) pode ser efetuado normalmente na presença de uma base e de um solvente.

A base pode ser uma ou mais corretamente selecionadas de, por exemplo, compostos organolítio como o metil-lítio e o n-butil-lítio; e compostos de Grignard como o cloreto de isopropilmagnésio.

A base é utilizada numa quantidade de 1 a 2 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) ou (XVIII-2).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou

mais selecionados corretamente de, por exemplo, um éter como o dioxano, o tetra-hidrofurano e o éter dietílico.

O composto de fórmula (XX) a usar no primeiro passo da reação (T) é usado numa quantidade de 1 a 3 moles, de preferência de 1 a 1,5 moles, por mole de composto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) ou (XVIII-2).

O primeiro passo da reação (T) pode ser efetuado, se necessário, na presença de um gás inerte. O gás inerte pode ser selecionado corretamente de, por exemplo, gás azoto e gás argon.

A temperatura reacional no primeiro passo da reação (T) é normalmente de -100°C a 50°C, de preferência de -70°C a 25°C. O tempo de reação é normalmente de 1 a 48 horas, de preferência de 1 a 20 horas.

O segundo passo da reação (T) pode ser efetuado, normalmente na presença de um agente de oxidação e de um solvente.

O agente de oxidação pode ser um ou mais corretamente selecionado de, por exemplo, clorocromato de piridínio e dióxido de manganês. O agente de oxidação é usado numa quantidade de 1 a 10 moles, de preferência de 1 a 3 moles, por mole de composto de fórmula (XXI-1) ou (XXI-2).

O solvente pode ser qualquer um desde que seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, pode ser um ou mais selecionados corretamente de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; e um hidrocarboneto alifático como tetracloreto de carbono, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano.

A temperatura reacional no segundo passo da reação (T) é normalmente de 0°C a 150°C, de preferência de 20°C a 100°C. O tempo de reação é normalmente de 0,5 a 24 horas, de preferência de 1 a 12 horas.

para a reação, e pode ser um ou mais selecionados corretamente de hidrocarbonetos aromáticos tal como benzeno, tolueno e xileno; hidrocarbonetos alifáticos como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, lingroina e benzina de petróleo; éteres como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetra-hidrofurano e dioxano; e dissulfureto de carbono.

A reação (1) pode ser efetuada a uma temperatura de -20°C a 150°C , de preferência de 0 a 110°C , e o tempo de reação é normalmente de 0,1 a 48 horas.

Na reação (1), o agente de tiocarbonilação pode ser usado numa quantidade de 0,4 a 2 mole, por mole de composto de fórmula (XII).

A reação (2) pode ser efetuada em conformidade com a reação (R) anterior.

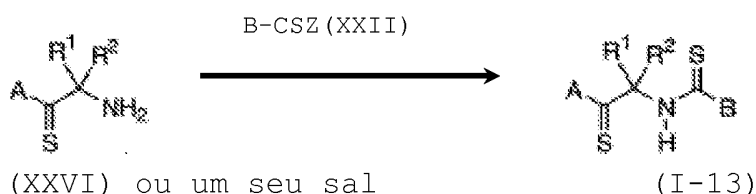
A reação (3) pode ser efetuada em conformidade com a reação (P) anterior.

A reação (4) pode ser efetuada em conformidade com a reação (N) anterior.

A reação (5) pode ser efetuada em conformidade com a reação (A) anterior.

Reação (W)

[W]



Na reação (W), A, B, R^1 , R^2 e Z são conforme foi anteriormente definido.

A reação (W) pode ser efetuada em conformidade com a reação (A) anterior.

Ainda, o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou o seu sal pode ser produzido com referência ao método divulgado em WO 2001/60783 ou WO 2003/27059, conforme a necessidade do caso.

Uma composição fungicida contendo, como componente ativo, um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal (referido neste documento simplesmente como composição do presente invento) consegue controlar fungos nocivos numa dose baixa e, deste modo, é útil, por exemplo, como composição fungicida agrícola ou hortícola.

Melhor forma de concretizar o invento

Serão agora descritas as concretizações preferidas da composição do presente invento.

A composição do presente invento é útil como composição fungicida capaz de controlar fungos nocivos numa dose baixa, o que é particularmente útil como composição fungicida agrícola ou hortícola. Quando usada como composição fungicida agrícola ou hortícola, a composição do presente invento consegue controlar fungos nocivos como oomicetes, ascomicetes, basidiomicetes, deuteromicetes e é particularmente eficaz no controlo de fungos nocivos pertencentes a, por exemplo, ascomicetes ou deuteromicetes.

Como exemplos específicos dos fungos nocivos anteriores, podem ser mencionados os seguintes.

Os oomicetes podem ser, por exemplo, do género Phytophthora, como o agente patogénico do míldio da batata e do tomate (Phytophthora infestans), ou o agente patogénico de *haiiro-eki-byo* do tomate (Phytophthora capsici); do género Pseudoperonospora, como o agente patogénico do oídio do pepino (Pseudoperonospora cubensis); do género Plasmopara, como o agente patogénico do míldio da videira (Plasmopara viticola); e do género Pythium, como o agente patogénico do míldio das plântulas de arroz (Pythium graminicola), ou o agente patogénico da podridão da raiz do trigo (Pythium iwayamai).

Os ascomicetes podem ser, por exemplo, o género Erysiphe, como o agente patogénico do oídio do trigo (Erysiphe graminis); o género Sphaerotheca, como o agente patogénico do oídio do pepino (Sphaerotheca fuliginea), ou o agente patogénico do oídio do morangueiro (Sphaerotheca humuli); o género Uncinula, como o agente patogénico do oídio da videira (Uncinula necator); o género Podosphaera, como o agente patológico do oídio da macieira (Podosphaera leucotricha); o género Mycosphaerella, como o agente patogénico do míldio de Mycosphaerella da ervilha (Mycosphaerella pinodes), o agente patogénico das manchas da maçã (Mycosphaerella pomi), o agente patogénico da sigatoka negra da bananeira (Mycosphaerella musicola), o agente patogénico das manchas foliares circulares do diospiro (Mycosphaerella nawae), ou o agente patogénico da mancha das folhas do morangueiro (Mycosphaerella fragariae); o género Venturia, como o agente patogénico do pedrado da macieira (Venturia inaequalis), ou agente patogénico do pedrado da pereira (Venturia nashicola); o género Pyrenophora, como o agente patogénico da mancha reticular da cevada (Pyrenophora teres), ou o agente patogénico da helmintosporiose da cevada (Pyrenophora graminea); o género Sclerotinia, como vários agentes patogénicos de doenças esclerotínia (Sclerotinia sclerotiorum), o agente patogénico da podridão do caule do feijão comum, o agente patogénico da podridão de esclerotínia do pepino, o agente patogénico da podridão de esclerotínia da couve, o agente patogénico da podridão de esclerotínia da couve chinesa, o agente patogénico da podridão de esclerotínia do pimento vermelho, o agente patogénico da podridão de esclerotínia do pimento doce, ou o agente patogénico da podridão mole aquosa da cebola, o agente patogénico do míldio da neve de esclerotínia do trigo (Sclerotinia borealis), o agente patogénico de *syoryu-kinkaku* do tomateiro (Sclerotinia minor), ou o agente patogénico da podridão de esclerotínia da alfafa e podridão da coroa (Sclerotinia trifoliorum); o género Botryolinia, como o agente patogénico da podridão de esclerotínia do amendoim (Botryolinia arachidis); agentes patogénicos do género Cochliobolus, como o agente patogénico da mancha castanha do arroz (Cochliobolus miyabeanus); o género Didymella, o agente patogénico do cancro gomoso do caule no pepino (Didymella bryoniae); o género Gibberella, como o

agente patogénico de fusariose do trigo (*Gibberella zeae*); o género *Elsinoe*, como o agente patogénico da antracnose da videira (*Elsinoe ampelina*), ou agente patogénico da sarna dos citrinos (*Elsinoe fawcettii*); o género *Diaporthe*, como o agente patogénico da melanose dos citrinos (*Diaporthe citri*), ou o agente patogénico da escoriose da videira (*Diaporthe* sp.); o género *Monilinia*, como o agente patogénico do míldio da flor da macieira (*Monilinia mali*), ou o agente patogénico da podridão castanha do pessegueiro (*Monilinia fructicola*); e o género *Glomerella*, como o agente patogénico de podridão-da-uva-madura (*Glomerella cingulata*).

Os basidiomicetes podem ser por exemplo, o género *Rhizoctonia*, como o agente patogénico da rizoctonia da bainha do arroz (*Rhizoctonia solani*); o género *Ustilago*, como o agente patogénico da ferrugem do trigo (*Ustilago nuda*); o género *Puccinia*, como o agente patogénico da ferrugem da coroa da aveia (*Puccinia coronata*), o agente patogénico da ferrugem castanha do trigo (*Puccinia recondita*), ou o agente patogénico da ferrugem amarela do trigo (*Puccinia striiformis*); e o género *Typhula*, como o agente patogénico do míldio da neve de *Typhula* do trigo ou da cevada (*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*).

Os deuteromicetes podem ser, por exemplo, o género *Septoria*, como o agente patogénico da septoriose das glumas no trigo (*Septoria nodorum*), septoriose das folhas no trigo (*Septoria tritici*); o género *Botrytis*, como os vários agentes patogénicos da podridão cinzenta (*Botrytis cinerea*), como o agente patogénico da podridão cinzenta da videira, o agente patogénico da podridão cinzenta dos citrinos, o agente patogénico da podridão cinzenta do pepino, o agente patogénico da podridão cinzenta do tomateiro, o agente patogénico da podridão cinzenta do morangueiro, o agente patogénico da podridão cinzenta da beringela, o agente patogénico da podridão cinzenta do feijão comum, o agente patogénico da podridão cinzenta do feijão Adzuki, o agente patogénico da podridão cinzenta da ervilha de jardim, o agente patogénico da podridão cinzenta do amendoim, o agente patogénico da podridão cinzenta do pimento vermelho, o agente patogénico da podridão cinzenta do pimento doce, o agente patogénico da podridão cinzenta da erva, o agente patogénico da podridão cinzenta da cebola, o agente

patogénico da podridão cinzenta da statice, o agente patogénico da podridão cinzenta do cravo, o agente patogénico do míldio de *Botrytis* da roseira, o agente patogénico do mofo cinzento de amores-perfeitos, ou o agente patogénico do mofo cinzento do girassol, o agente patogénico da podridão cinzenta do bolbo da cebola (*Botrytis allii*), ou *hagare-syo* de *Botrytis* da cebola (*Botrytis squamosa*, *Botrytis byssoidea*, *Botrytis tulipae*); o género *Pyricularia*, como o agente patogénico de brusone em arroz (*Pyricularia oryzae*); o género *Cercospora*, como o agente patogénico da mancha foliar da Cercosporiose da beterraba sacarina (*Cercospora beticola*), ou o agente patogénico da mancha foliar da Cercosporiose em diospiros (*Cercospora kakivola*); o género *Colletotrichum*, como o agente patogénico da antracnose do pepino (*Colletotrichum orbiculare*); o género *Alternaria*, como o agente patogénico de mancha foliar de alternariose da macieira (patotipo da macieira de *Alternaria alternata*), o agente patogénico da mancha negra da pereira (patotipo da pereira japonesa da *Alternaria alternata*), o agente patogénico de alternariose na batata ou tomate (*Alternaria solani*), o agente patogénico da mancha foliar de alternariose em couve ou couve chinesa (*Alternaria brassicae*), o agente patogénico da mancha fuliginosa de alternariose da couve (*Alternaria brassicola*), o agente patogénico da mancha foliar de alternariose na cebola ou cebola galesa (*Alternaria porri*); o género *Pseudocercospora*, como o agente patogénico de acama do trigo (*Pseudocercospora herpotrichoides*); o género *Pseudocercospora*, como o agente patogénico de mancha foliar da videira (*Pseudocercospora vitis*); o género *Rhynchosporium*, como o agente patogénico de escaldão da cevada (*Rhynchosporium secalis*); o género *Cladosporium*, como o agente patogénico da sarna do pessegueiro (*Cladosporium carpophilum*); o género *Phomopsis*, como o agente patogénico de podridão de *Phomopsis* no pessegueiro (*Phomopsis sp.*); o género *Gloeosporium*, como o agente patogénico de antracnose dos diospiros (*Gloeosporium kaki*); o género *Fulvia*, como o agente patogénico de bolor foliar no tomateiro (*Fulvia fulva*); o género *Corynespora*, como o agente patogénico das manchas foliares de *Corynespora* do pepino (*Corynespora cassiicola*).

A composição do presente invento consegue controlar os vários fungos nocivos anteriores e, deste modo, consegue controlar preventivamente ou curativamente as várias doenças. Em particular, a composição do presente invento é eficaz no controlo de várias doenças que são problemáticas na agricultura e no campo da horticultura, como brusone, **mancha castanha**, rizoctonia ou murchidão de arroz (*Oryza sativa*, etc.); oídio, sarna, ferrugem castanha, ferrugem amarela, mancha reticular, helmintosporiose, mofo da neve, míldio da neve, ferrugem dos cereais, mancha reticular de ferrugem castanha, acama, escaldão, manchas foliares ou melanose dos cereais (*Hordeum vulgare*, *Tricum aestivum*, etc.); melanose ou sarna dos citrinos (*Citrus spp.*, etc.); míldio da flor, oídio, melanose, mancha foliar de alternariose ou sarna da macieira (*Malus pumila*); sarna ou mancha negra da pereira (*Pyrus serotina*, *Pyrus ussuriensis*, *Pyrus communis*); podridão castanha, sarna ou podridão de Phomopsis do pessegueiro (*Prunus persica*, etc.); antracnose, podridão-da-uva-madura, mancha foliar, escoriose, oídio ou míldio da videira (*Vitis vinifera spp.*, etc.); antracnose, mancha foliar circular ou mancha foliar de Cercospora do diospiro japonês (*Diospyros kaki*, etc.); antracnose, oídio, cancro gomoso do caule, mancha foliar de corynespora ou míldio das cucurbitáceas (*Cucumis melo*, etc.); alternariose, *haiiro-eki-byo*, bolor foliar ou míldio do tomateiro (*Lycopersicon esculentum*); sigatoka negra da bananeira (*Musa sapientum*, etc.); mancha foliar de Cercospora de beterraba sacarina (*Beta vulgaris* var. *saccharifera*, etc.); míldio de Mycosphaerella da ervilheira de jardim (*Pisum sativum*); vários agentes patogénicos de alternariose de vegetais crucíferos (*Brassica sp.*, *Raphanus sp.*, etc.); míldio ou alternariose de batata (*Solanum tuberosum*); oídio ou mancha foliar do morangueiro (*Fragaria*, etc.); e bolor cinzento ou doença causada por Esclerotínia de várias culturas como feijão, vegetais, frutos ou flores. Entre eles, é particularmente eficaz contra vários bolores cinzentos ou doença causada por esclerotínia de pepino (*Cucumis sativus*), feijão vulgar (*Phaseolus vulgaris*), feijão adzuki (*Vigna angularis*), soja (*Glycine max*), ervilha de jardim, amendoim (*Arachis hypogaea*), tomate, morango, beringela (*Solanum melongena*), pimento vermelho (*Capsicum annuum*), pimento doce (*Capsicum annuum*), alface (*Lactuca sativa*), cebola (*Allium*

cepa), uva, citrinos, estaticice (Limonium spp.), cravo (Dianthus spp.), rosa (Rosa spp.), amores-perfeitos (Viola, etc.) ou girassol (Helianthus annuus).

Para além disso, a composição do presente invento é eficaz também para o controlo preventivo ou curativo de doenças do solo causadas por agentes patogénicos das plantas como Fusarium, Pythium, Rhizoctonia, Verticillium e Plasmodiophora.

Mais ainda, a composição do presente invento é eficaz também a controlar vários agentes patogénicos resistentes a fungicidas como os benzimidazoles, estrobilurinas, dicarboximidas, fenilamidas e inibidores de biossíntese de ergosterol.

Além disso, a composição do presente invento possui uma excelente propriedade de migração penetrativa, e quando se aplica no solo um pesticida que contém a composição do presente invento, é possível controlar fungos nocivos nos caules e folhas, ao mesmo tempo que se controla fungos nocivos no solo.

A composição do presente invento é normalmente formulada misturando o derivado de amida de ácido representado pela fórmula (I) ou um seu sal com vários adjuvantes agrícolas e usada na forma de uma formulação como pó, grânulos, grânulos dispersáveis em água, um pó molhável, um concentrado de suspensão à base de água, um concentrado de suspensão à base de óleo, grânulos solúveis em água, um concentrado para emulsão, um concentrado solúvel, uma pasta, um aerossol ou uma formação de volume ultrabaixo. No entanto, desde que adequado aos fins do presente invento, pode ser formulada sob a forma de qualquer tipo de formulação vulgarmente usado neste campo. Esses adjuvantes agrícolas incluem transportadores sólidos como terra de diatomáceas, cal apagada, carbonato de cálcio, talco, carbono branco, caulino, bentonite, uma mistura de caulinite e sericite, argila, carbonato de sódio, bicarbonato de sódio, mirabilite, zeolite e amido; solventes como a água, o tolueno, o xileno, o solvente nafta, dioxano, acetona, isofrona, isobutilmetilcetona, clorobenzeno, ciclo-hexano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, dimetilacetamida, N-

metil-2-pirrolidona, e álcool; tensioativos aniônicos e dispersantes como um sal de ácido gordo, um benzoato, um alquilsulfossuccinato, um dialquilsulfossuccinato, um policarboxilato, um sal de éster de ácido alquilsulfúrico, um sulfato de alquilo, um sulfato de alquilarilo, um sulfato de éster alquildiglicólico, um sal de éster de ácido álcool-sulfúrico, um sulfonato de alquilo, um sulfonato de alquilarilo, um sulfonato de arilo, um sulfonato de lignina, um dissulfonato de éter alquildifenílico, um sulfonato de polistireno, um sal de éster de ácido alquilfosfórico, um fosfato de alquilarilo, um fosfato de estirilarilo, um sal de éster de ácido sulfúrico de éter polioxietilenoalquílico, um sulfato de éter polioxietilenoalquilarílico, um sal de éster do ácido sulfúrico de éter polioxietilenoalquilarílico, um fosfato do éter polioxietilenoalquílico, um sal do éster do ácido polioxietilenoalquilarilfosfórico, e um sal de um condensado de sulfonato de naftaleno com formalina; tensioativos não iônicos e dispersantes como um éster de ácido gordo e sorbitano, um éster de ácido gordo e glicerina, um poliglicerídeo de ácido gordo, um éter de ácido gordo e álcool poliglicólico, acetilenoglicol, álcool acetilénico, um polímero de bloco de oxialcilenos, um éter polioxietilenoalquílico, um éter polioxietilenoalquilarílico, um éter polioxietilenoestirilarílico, um éter polioxietilenoglicolalquílico, um polietilenoglicol, um éster de ácido gordo do polioxietileno, um éster de ácido gordo do polietilenosorbitano, um éster de ácido gordo de polioxietilenoglicerina, um óleo de rícino hidrogenado de polioxietileno, e um éster de ácido gordo do polioxipropileno; e óleos vegetais e minerais como o azeite, óleo de sumaúma, óleo de rícino, óleo de palma, óleo de camélia, óleo de coco, óleo de sésamo, óleo de milho, óleo de farelo de arroz, óleo de amendoim, óleo de sementes de algodão, óleo de soja, óleo de colza, óleo de linhaça, óleo de tungue, e parafinas líquidas. Cada um dos componentes como os adjuvantes podem ser, um ou mais, selecionados corretamente para utilização, desde que o objetivo do presente invento possa assim ser atingido. Além disso, podem também ser utilizados vários aditivos que são vulgarmente utilizados, como um agente de enchimento, um espessante, um agente anti sedimentação, um agente anticongelante, um estabilizante de dispersão, um

agente redutor de fitotoxicidade, e um agente antifúngico.

A razão entre o peso do derivado de amida de ácido representado pela fórmula (I) ou do seu sal e o peso dos vários adjuvantes agrícolas é normalmente de 0,001:99,999 a 95:5, de preferência de 0,005:99,995 a 90:10.

Na aplicação atual dessa formulação, esta pode ser utilizada tal como é, ou pode ser diluída numa concentração pré-determinada com um diluente como a água, e vários dispersantes, como por exemplo, conforme a necessidade do caso podem-se-lhe adicionar tensioativos, óleos vegetais ou óleos minerais.

A aplicação da composição do presente invento, de modo geral, não pode ser definida, pois varia de acordo com as condições do tempo, o tipo de formulação, as plantas de colheita a tratar, a época de aplicação, o local de aplicação, os tipos ou fases de germinação de fungos nocivos, e os tipos ou grau do surto das doenças. No entanto, é normalmente aplicada numa concentração do componente ativo de 0,1 a 10000 ppm, de preferência de 1 a 2000 ppm no caso de tratamento de folhagem, e a sua dose pode ser tal que o derivado da amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal é normalmente de 0,1 a 50000 g, de preferência de 1 a 30000g, por hectare. No caso de tratamento do solo, esta é normalmente aplicada numa dose em que o derivado da amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal seja de 10 a 100000 g, de preferência de 200 a 20000 g, por hectare.

A formulação contendo a composição do presente invento ou um seu produto diluído pode ser aplicada por um método de aplicação que é usado vulgarmente, como a propagação (difundindo, pulverizando, nebulizando, atomizando, difundido grãos ou aplicando sobre a superfície da água), aplicação no solo (como mistura ou irrigação) ou aplicação na superfície (como revestimento, revestimento ou cobertura de pó). Para além disto, pode ser aplicada também através do chamado volume ultra baixo. Neste método, a formulação pode conter 100% do componente ativo.

A composição do presente invento pode ser misturada ou

pode ser usada em combinação com outros químicos agrícolas, fertilizantes ou agentes redutores de fitotoxicidade, através dos quais, por vezes, se conseguem obter efeitos ou atividades sinérgicos. Outros químicos agrícolas podem ser, por exemplo, um herbicida, um inseticida, um acaricida, um nematocida, um pesticida de solo, um fungicida, um agente antivírus, um atrativo, um antibiótico, uma hormona vegetal e um agente regulador do crescimento de plantas. Especialmente, com uma composição de mistura de fungicidas contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal misturado ou usado em combinação com um ou mais de outros compostos componentes ativos fungicidas, pode melhorar-se o intervalo de aplicação, o tempo de aplicação, as atividades fúngicas, etc. num sentido preferencial. Aqui, o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, e o composto componente ativo de um outro fungicida podem ser formulados separadamente para que possam ser misturados para usar no momento da aplicação, ou podem ser formulados juntos para utilização. O presente invento inclui uma dessas composições de mistura de fungicidas.

A razão de mistura do derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal para um outro composto componente ativo fungicida, geralmente, não pode ser definido, uma vez que varia de acordo com as condições do tempo, o tipo de formulações, a cultura a tratar, o tempo de aplicação, o local de aplicação, os tipos ou estado de germinação de fungos nocivos, os tipos ou estado das doenças, etc., mas normalmente encontra-se num intervalo de 1:300 a 300:1, de preferência de 1:100 a 100:1 em peso. Também, a dose para a aplicação pode ser aquela em que a quantidade total dos compostos ativos seja de 0,1 a 70000 g, de preferência de 1 a 30000 g, por hectare. O presente invento inclui um método para o controlo de fungos nocivos através de uma aplicação de uma dessas composições de mistura de fungicidas.

O composto componente ativo (nome comum; incluindo alguns que se encontram sob código de teste ou de pedido da associação de proteção de plantas do Japão) do fungicida num desses outros químicos agrícolas pode ser, por exemplo:

um composto anilinopirimidia como Mepanipyrim, Pirimetanil ou Ciprodinil;

um composto piridinamina como Fluazinam;

um composto de azole como Triadimefon, Bitertanol, Triflumizole, Etaconazole, Propiconazole, Penconazole, Flusilazole, Miclobutanil, Ciproconazole, Tebuconazole, Hexaconazole, Furconazole-cis, Procloraz , Metconazole, Epoxiconazole, Tetraconazole, Fumarato de Oxpoconazole, Sipconazole, Protioconazole, Triadimenol, Flutriafol, Difenconazole, Fluquinconazole, Fenbuconazole, Bromuconazole, Diniconazole, Triciclazole, Probenazole ou Simeconazole, Pefurazoato, Ipconazole ou Imibenconazole;

um composto quinoxalina como quinometionato;

um composto ditiocarbamato como Maneb, Zineb, Mancozeb, Policarbamato, Metiram ou Propineb;

um composto orgânico clorado como Ftalido, Clorotalonil or Quintozene;

um composto imidazole como Benomil, Tiofanato-metílico, Carbendazim ou Ciazofamida;

um composto cianoacetamida como Cimoxanil;

um composto fenilamida como Metalaxil, Metalaxil M, Oxadixil, Ofurace, Benalaxil, Benalaxil M, Furalaxil ou Ciprofuram;

um composto ácido sulfénico como Dichlofluanid;

um composto de cobre como Hidróxido cúprico ou Oxina de cobre;

um composto isoxazole como Himexazol;

um composto orgânico de fósforo como Fosetil-Al, Tolcofos-metil, O,O-di-isopropilfosforotioato de S-benzilo, S,S-difenilfosforoditioato de O-etilo ou hidrogenofosfonato de etilalumínio;

um composto N-halogenotioalquilo como Captana, Captafol ou Folpete;

um composto dicarboxi-imida como Procimidona, Iprodiona ou Vinclozolina;

um composto benzanilida como Flutolanilo, Mepronil, Zoxamida ou Tiadinil;

um composto anilida como Boscalid;

um composto de piperazina como Triforine;

um composto piridina como Pirifenox;

um composto carbinol como Fenarimol ou Flutriafol;

um composto piperidina como Fenpropidino;

um composto morfolino como Fenpropimorfe ou Tridemorfe;
um composto orgânico de estanho como Hidróxido de Fentina
ou Acetato de Fentina;
um composto ureia como Pencicuron;
um composto ácido cinâmico como Dimetomorfe ou Flumorph;
um composto fenilcarbamato como Diethofencarb;
um composto cianopirrole como Fludioxonil ou Fenpiclonil;
um composto estrobilurina como Azoxistrobina, Cresoxim-
Metil, Metominofen, Trifloxistrobina, Picoxistrobina,
Orizastrobina, Dimoxistrobina, Piraclostrobina,
Fluoxastrobina ou Fluacrypyrin;
um composto oxazolidinona como Famoxadona;
um composto de tiazolecarboxamida como Ethaboxam;
um composto sililamida como Siltiofame;
um composto carbamato de amida de aminoácido como
Iprovalicarbe ou Benthiavalicarbe-isopropílico;
um composto imidazolidina como Fenamidona;
um composto hidroxianilida como Fenhexamida;
um composto benzenossulfonamida como Flusulfamida;
um composto éter de oxima como Ciflufenamida;
um composto fenoxiamida como Fenoxanil;
um antibiótico como Polioxinas;
um composto guanidina como Iminoctadina;
outro composto como Isoprothiolano, Pyroquilon,
Diclomezine, Quinoxifen, Cloridrato de Propamocarbe,
Espiroxamina Cloropicrina, Dazomete, Metame de sódio,
Nicobifen, Metrafenona, MTF-753 (Penthiopirade), UBF-307,
Diclocymet, Proquinazida, NC-224 (Amibromdole, Amisulbrom),
KIF-7767 (KUF-1204, Pyribencarb metil, Mepyracarb) ou
Syngenta 446510 (Mandipropamida, Dipromandamid).

O composto componente ativo (nome comum; incluindo alguns
que se encontram sob pedido) do inseticida, acaricida,
nematicida ou pesticida de solo num desses outros químicos
agrícolas pode ser, por exemplo:

um composto orgânico de fosfato como Profenofos,
Diclorvos, Fenamifos, Fenitrothion, EPN, Diazinon,
Clorpirifos-metilo, Acefato, Prothiofos, Fostiazato,
Phosphocarb, Cadusafos, Dissulfoton, Clorpirifos, Demeton-S-
metilo, Dimetoato ou Metamidofos;

um composto carbamato como Carbaril, Propoxur, Aldicarbe,

Carbofurano, Tiodicarbe, Metomil, Oxamil, Etiofencarbe, Pirimicarbe, Fenobucarbe, Carbosulfano ou Benfuracarbe;

um derivado de nelicetoxina como Cartap, Tiociclame ou Bensultape;

um composto orgânico de cloro como Dicofol ou Tetradifon;

um composto orgânico de metal como Óxido de Fenbutatina;

um composto piretróide como Fenvalerato, Permetrina, Cipermetrina, Deltametrina, Cialotrina, Teflutrina, Etofenprox, Fenpropatrina ou Bifentrina;

um composto benzoilureia como Diflubenzuron, Clorfluazuron, Teflubenzuron, Flufenoxuron, Lufenuron ou Novaluron;

um composto do tipo hormona juvenil como Metopreno, Piriproxifena ou Fenoxicarbe;

um composto piridadinona como Piridabene;

um composto de pirazole como Fenpiroximato, Fipronil, Tebufenpirade, Etiprolo, Tolfenpyrad, Acetoprole, Pirafluprole ou Piriprol;

um neonicotinoide como Imidaclopride, Nitenpiram, Acetamipride, Tiaclopride, Tiametoxame, Clotianidina ou Dinotefurano;

um composto hidrazina como Tebufenozida, Metoxifenozida ou Cromafenozida;

um composto dinitro, um composto organoenxofre, um composto ureia, um composto triazina ou um composto hidrazona;

outro composto como Flonicamida, Buprofezine, Hexitiazox, Amitraz, Clordimeforme, Silafluofeno, Triazamato, Pimetrozina, Pyrimidifen, Clorfenapir, Indoxacarbe, Acequinocil, Etoxazole, Ciromazine, 1,3-dicloropropeno, Diafentiuron, Benclothiaz, Flufenerim, Piridalilo, Espirodiclofeno, Bifenazato, Espiromesifeno, Espirotetramato, Propargito, Clofentezina, Fluacrypyrim, Metaflumizona, Flubendiamida ou Cyflumetofen.

Ainda, um pesticida microbiano como um agente BT, um agente vírus patogénico de insetos, fungos entomopatogénicos ou fungos nematófagos;

um antibiótico como Avermectina, Emamectina-Benzoato, Milbemectina, Spinosad, Ivermectina ou Lepimectina;

um produto natural como Azadiractina.

Os compostos preferidos do presente invento são os seguintes. No entanto, deve entender-se que o presente invento não se restringe, de modo algum, a essas concretizações específicas.

(1) Utilização de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) anterior ou de um seu sal, conforme se define na reivindicação 13.

(2) Utilização em conformidade com a reivindicação 13 de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal, onde A é fenilo que pode ser substituído por X, naftilo que pode ser substituído por X, anel heterocíclico que pode ser substituído por X, ou um anel heterocíclico fundido que pode ser substituído por X; B é um anel heterocíclico de 5 membros que pode ser substituído por Y; X é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo; alcoxialquilo, dialquilaminoalquilo, alcinilo, trialquilsililalcinilo, hidroxí, alcoxi, halogeneto de alcoxi, alcoxialcoxi, cicloalquilo, nitro, fenilo, fenilalcinilo, piridiloxi que pode ser substituído por halogeneto de alquilo, alquilcarboniloxi, alquilsulfoniloxi, ou anel heterocíclico (o anel heterocíclico pode ser substituído por halogéneo, alquilo, ou alquilcarbonilo); Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo; alcoxi, halogeneto de alcoxi, cicloalquilo, ou formilo; cada R^1 e R^2 é, independentemente do outro, hidrogénio, ou alquilo; R^3 é hidrogénio, alquilo, alquilcarbonilo, ou alcoxicarbonilo; e cada W^1 e W^2 é, independentemente do outro, oxigénio ou enxofre.

(3) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o anterior (2), onde cada W^1 e W^2 é oxigénio.

(4) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o anterior (2), onde B é um anel heterocíclico de 5 membros que pode ser substituído por Y; X é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcinilo, hidroxí, alcoxi, halogeneto de alcoxi, alcoxialcoxi, cicloalquilo, nitro, fenilalcinilo, piridiloxi que pode ser substituído por halogeneto de alquilo, alquilcarboniloxi, ou anel heterocíclico (o anel heterocíclico pode ser

substituído por halogéneo, alquilo, ou alquilcarbonilo); Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo ou alcoxi; R³ é hidrogénio, alquilcarbonilo, ou alcoxicarbonilo; e cada W¹ e W² é oxigénio.

(5) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (2) ou (4), onde B é furilo que pode ser substituído por Y, tienilo que pode ser substituído por Y, pirrolilo que pode ser substituído por Y, oxazolilo que pode ser substituído por Y, isoxazolilo que pode ser substituído por Y, tiazolilo que pode ser substituído por Y, isotiazolilo que pode ser substituído por Y, pirazolilo que pode ser substituído por Y, ou tiadiazolilo que pode ser substituído por Y.

(6) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (5), onde B é furilo que pode ser substituído por Y, tienilo que pode ser substituído por Y, pirrolilo que pode ser substituído por Y, oxazolilo que pode ser substituído por Y, tiazolilo que pode ser substituído por Y, isotiazolilo que pode ser substituído por Y, pirazolilo que pode ser substituído por Y, ou tiadiazolilo que pode ser substituído por Y.

(7) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (6), onde B é um furilo substituído por Y.

(8) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (6), onde B é um tienilo substituído por Y.

(9) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (6), onde B é um pirazolilo substituído por Y.

(10) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (2), onde A é fenilo que pode ser substituído por X, naftilo que pode ser substituído por X, benzodioxolanilo que pode ser substituído por X, ou benzodioxanilo que pode ser

substituído por X; B é furilo que pode ser substituído por Y, tienilo que pode ser substituído por Y, ou pirazolilo que pode ser substituído por Y; X é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi; Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi; R^3 é hidrogénio; e cada W^1 e W^2 é oxigénio.

(11) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10), onde B é furilo substituído por Y, tienilo substituído por Y, ou pirazolilo substituído por Y.

(12) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10), onde B é furilo substituído por Y, tienilo substituído por Y, pirazolilo substituído por Y, e Y é halogéneo, alquilo, ou halogeneto de alquilo.

(13) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10), onde A é fenilo substituído por X, ou benzodioxanilo substituído por X; e B é furilo substituído por Y, tienilo substituído por Y, ou pirazolilo substituído por Y.

(14) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10), onde A é fenilo substituído por X, ou benzodioxanilo substituído por X; e B é furilo substituído por Y, tienilo substituído por Y, ou pirazolilo substituído por Y; X é halogéneo, alquilo, ou alcoxi; e Y é halogéneo, alquilo ou halogeneto de alquilo.

(15) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10), onde A é fenilo substituído por X, ou benzodioxanilo substituído por X; B é furilo substituído por Y, tienilo substituído por Y, ou pirazolilo substituído por Y; cada R^1 e R^2 é alquilo; X é halogéneo, alquilo, ou alcoxi; e Y é halogéneo, alquilo ou halogeneto de alquilo.

(16) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um

seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10) a (15), onde B é furilo substituído por Y.

(17) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10) a (15), onde B é tienilo substituído por Y.

(18) Utilização de um derivado de amida de ácido ou de um seu sal em conformidade com o disposto anteriormente em (10) a (15), onde B é pirazolilo substituído por Y.

(19) Composição fungicida contendo o derivado de amida de ácido ou um seu sal conforme se define na reivindicação 1 como componente ativo.

(20) Composição de mistura de fungicidas contendo o derivado de amida de ácido ou um seu sal conforme se define na reivindicação 1, e um outro composto fungicida componente ativo, como componentes ativos.

(21) Composição de mistura de fungicidas em conformidade com o disposto anteriormente em (20), onde o outro composto fungicida componente ativo referido é pelo menos um membro selecionado do grupo que consiste num composto anilinopirimidina, um composto piridinamina, um composto azole, um composto quinoxalina, um composto ditiocarbamato, um composto orgânico de cloro, um composto imidazole, um composto cianoacetamida, um composto fenilamida, um composto ácido sulfénico, um composto de cobre, um composto isoxazole, um composto orgânico de fósforo, um composto N-halogenotioalquilo, um composto dicarboxi-imida, um composto benzanilida, um composto anilida, um composto piperazina, um composto piridina, um composto carbinol, um composto piperidina, um composto morfolina, um composto orgânico de estanho, um composto ureia, um composto ácido cinâmico, um composto fenilcarbamato, um composto cianopirrole, um composto estrobilurina, um composto oxazolidinona, um composto tiazolecarboxamida, um composto sililamida, um composto carbamato de amida de aminoácido, um composto imidazolidina, um composto de hidroxianilida, um composto benzenossulfonamida, um composto éter de oxima, um composto fenoxiamida, um antibiótico, um composto guanidina,

isoprotiolano, piroquilon, diclomezina, quinoxifeno, cloridrato de propamocarbe, espiroxamina, cloropicrina, dazomet, metame de sódio, nicobifen, metrafenona, MTF-753, UBF-307, diclocimete, proquinazida, NC-224, KIF-7767 e Syngenta 446510.

(21) Composição de mistura de fungicidas em conformidade com o disposto anteriormente em (20), onde o outro composto fungicida componente ativo referido é pelo menos um membro selecionado do grupo que consiste num composto piridinamina, um composto azole, um composto ditiocarbamato, um composto orgânico de cloro, um composto imidazole, um composto de cobre, um composto dicarboxi-imida, um composto anilida, um composto piperazina, um composto piridina, um composto carbinol, um composto fenilcarbamato, um composto cianopirrole, um composto estrobilurina, um composto de hidroxianilida, MTF-753 e KIF-7767.

(22) Composição mista de fungicida em conformidade com o disposto anteriormente em (21), onde o outro composto fungicida componente ativo referido é pelo menos um membro selecionado do grupo que consiste em Fluazinam, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizole, Etaconazole, Propiconazole, Penconazole, Flusilazole, Miclobutanilo, Ciproconazole, Terbuconazole, Hexaconazole, Furconazole-cis, Procloraz, Metconazole, Epoxiconazole, Tetraconazole, Fumarato de oxpoconazole, Sipconazole, Protioconazole, Triadimenol, Flutriafol, Difenconazole, Fluquinconazole, Fenbuconazole, Bromuconazole, Diniconazole, triciclazole, probenazole, Simeconazole, Pefurazoato, Ipconazole, Imibenconazole, Maneb, Zineb, Mancozeb, Policarbarato, Metiram, Propineb, Ftalido, Clorotalonilo, Quintozeno, Benomil, Tiofanato-Metilo, Carbendazim, Cyazofamid, Hidróxido Cúprico, Oxina de Cobre, Procimidona, Iprodiona, Vinclozolina, Boscalid, Dietofencarbe, Fludioxonil, Fenpiclonil, Azoxistrobina, Cresoxima-Metilo, Metominofen, Trifloxistrobina, Picoxistrobina, Orizastrobina, Dimoxistrobina, Piraclostrobina, Fluoxastrobina, Fluacripirina, Fenexamida, Polioxinas, Iminoctadina, MTF-753, e KIF-7767.

(23) Método para controlar fungos nocivos selecionados de oomicetes, ascomicetes, basidiomicetes ou deuteromicetes que

compreende a aplicação de uma quantidade eficaz do derivado de amida de ácido ou de um seu sal conforme se define no estipulado anteriormente em (1) a (17).

Agora, o presente invento será descrito em maior detalhe com referência a exemplos. No entanto, deve entender-se que o presente invento não se restringe, de modo algum, aos mesmos. Em primeiro lugar, serão descritos Exemplos de Preparação do derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal.

Exemplo de Preparação 1

Preparação de N-[(3',4'-dicloro-1,1-dimetil)fenacil]-2-metil-3-furancarboxamida (composto N.º 1-57 seguidamente mencionado)

(1) Adicionou-se, gota a gota, a 3,12 g de zinco, numa atmosfera de azoto, uma mistura compreendendo 10,0 g de cloreto de 3,4-diclorobenzoilo, 9,31 g de 2-bromoisobutirato de etilo e 90 ml de éter dietílico anidro, seguindo-se uma reação durante 15 horas sob refluxo. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e lavou-se o filtrado com ácido sulfúrico a 20% e depois com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/19) para obter 8,7 g do óleo 2-(3',4'-diclorobenzoil)isobutirato de etilo. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,11 (t, 3H), 1,52 (s, 6H), 4,14 (q, 2H), 7,48 (d, 1H), 7,63 (dd, 1H), 7,96 (d, 1H).

(2) Fez-se reagir durante 15 horas, sob refluxo, uma mistura compreendendo 8,7 g de 2-(3',4'-diclorobenzoil)-isobutirato de etilo, 14,2 ml de ácido sulfúrico, 14,2 ml de água e 40 ml de ácido acético. Pôs-se a mistura reacional em água gelada e efetuou-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de

etilo/ n-hexano = 1/19) para obter 6,47 g do óleo 3,4-dicloroisobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,21 (d, 6H), 3,46 (m, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,79 (dd, 1H), 8,02 (d, 1H).

(3) Adicionaram-se 9,32 g de tribrometo de feniltrimetilamónio a uma mistura compreendendo 6,47 g de 3,4-dicloroisobutirofenona e 100 ml de tetrahidrofurano, seguindo-se uma reação durante 4 horas à temperatura ambiente. Filtrou-se a mistura reacional, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 6,39 g do óleo α -bromo-3,4-dicloroisobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 2,01 (s, 6H), 7,50 (d, 1H), 8,0 (dd, 1H), 8,20 (d, 1H).

(4) Adicionaram-se 2,8 g de azida de sódio a uma mistura compreendendo 6,39 g de α -bromo-3,4-dicloroisobutirofenona e 60 ml de sulfóxido de dimetilo, seguido de reação durante uma hora a 50°C. Colocou-se a mistura reacional em água e efetuou-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 6,34 g do óleo α -azida-3,4-dicloroisobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,60 (s, 6H), 7,53 (d, 1H), 7,97 (dd, 1H), 8,20 (d, 1H).

(5) Adicionaram-se 7,74 g de trifenilfosfina a uma mistura compreendendo 6,34 g de α -azida-3,4-dicloroisobutirofenona, 90 ml de tetrahidrofurano e 3,2 ml de água, seguindo-se uma reação durante 23 horas à temperatura ambiente. Concentrou-se a mistura reacional a pressão reduzida. Ao resíduo adicionou-se água e depois ácido clorídrico para o tornar ligeiramente ácido, seguindo-se lavagem com éter dietílico. Neutralizou-se a camada aquosa com uma solução aquosa de hidróxido de sódio e efetuou-se a extração com éter dietílico. Secou-se a camada orgânica

sobre sulfato de magnésio anidro e concentrou-se a pressão reduzida. Ao resíduo adicionou-se acetato de etilo, e introduziu-se o gás cloreto de hidrogénio sob arrefecimento em gelo. Colheu-se, por filtração, o sólido formado e secou-se para obter 5,92 g de cloridrato de α -amino-3,4-dicloroisobutirofenona.

(6) Adicionaram-se 0,31 g de trietilamina a uma mistura compreendendo 0,3 g de cloridrato de α -amino-3,4-dicloroisobutirofenona e 10 ml de tetrahidrofurano, seguindo-se agitação durante 5 horas à temperatura ambiente. Concentrou-se a mistura a pressão reduzida. Adicionou-se, gota a gota, sob arrefecimento em gelo, uma mistura compreendendo 0,29 g de N,N'-diciclo-hexilcarbodiimida e 10 ml de diclorometano, a uma mistura compreendendo o resíduo obtido, 0,195 g de ácido 2-metil-3-furancarboxílico e 20 ml de diclorometano, seguindo-se uma reação durante 15 horas à temperatura ambiente. Filtrou-se a mistura reacional, e diluiu-se o filtrado com diclorometano, e lavou-se com uma solução aquosa de carbonato de potássio e depois com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de sódio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 0,08 g do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 175 a 178°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,71 (s, 6H), 2,43 (s, 3H), 6,28 (s, 1H), 6,44 (d, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,84(dd, 1H), 8,11 (d, 1H).

Exemplo de Preparação 2

Preparação de N-[(3'-difluorometoxi-1,1-dimetil)fenacil]-5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazolecarboxamida (composto N.º 1-72 seguidamente mencionado)

(1) Adicionou-se, gota a gota, um reagente de Grignard preparado usando 0,75 g de magnésio, 4,46 g de 2-bromopropano e 24 ml de éter dietílico anidro, a uma mistura compreendendo 4,09 g de 3-difluorometoxibenzonitrilo e 20 ml de éter dietílico anidro. Após o término da adição gota a gota, fez-se reagir a mistura à temperatura ambiente durante

27 horas. Colocou-se a mistura reacional em água gelada, e adicionou-se ácido sulfúrico 6 N para tornar a mistura ligeiramente ácida, seguindo-se agitação durante 0,5 horas. Efetuou-se a extração da mistura com éter dietílico e lavou-se com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/19) para obter 2,04 g de 3-difluorometoxi-isobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,23 (d, 6H), 3,52 (m, 1H), 6,56 (t, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,80 (d, 1H).

(2) Adicionaram-se 3,58 g de tribrometo de feniltrimetilamónia a uma mistura compreendendo 2,04 g de 3-difluorometoxi-isobutirofenona e 30 ml de tetrahidrofurano, seguido de uma reação durante duas horas à temperatura ambiente. Filtrou-se a mistura reacional, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 2,79 g do óleo α -bromo-3-difluorometoxi-isobutirofenona.

(3) Adicionaram-se 1,24 g de azida de sódio a uma mistura compreendendo 2,79 g de α -bromo-3-difluorometoxi-isobutirofenona e 35 ml de sulfóxido de dimetilo, seguido de reação durante uma hora a 50°C. Colocou-se a mistura reacional em água e efetuou-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 2,21 g do óleo α -azida-3-difluorometoxi-isobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,61 (s, 6H), 6,56 (t, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,98 (d, 1H).

(4) Fez-se reagir durante 1,5 horas, à temperatura ambiente, numa atmosfera de hidrogénio, uma mistura compreendendo 2,18 g de α -azida-3-difluorometoxi-isobutirofenona, 35 ml de metanol e 0,109 g de paládio em carbono a

5%. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida. Ao resíduo adicionou-se acetato de etilo, e introduziu-se o gás cloreto de hidrogénio sob arrefecimento em gelo, seguido de concentração a pressão reduzida para obter 1,76 g de cloridrato de α -amino-3-difluorometoxi-isobutirofenona.

(5) Adicionaram-se 0,33 g de trietilamina a uma mistura compreendendo 0,3 g de cloridrato de α -amino-3-difluorometoxi-isobutirofenona e 10 ml de tetrahydrofurano, e adicionou-se-lhe gota a gota uma mistura compreendendo 0,25 g de cloreto de 5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazolecarbonilo e 5 ml de tetrahydrofurano, sob arrefecimento com gelo. Após o término da adição gota a gota, fez-se reagir a mistura à temperatura ambiente durante 3 horas. Efetuou-se a extração da mistura reacional com acetato de etilo, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/4) para obter 0,23 g do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 138 a 139°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,75 (s, 6H), 2,28 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 6,50 (t, 1H), 6,80 (s, 1H), 7,23 (dd, 1H), 7,38 (t, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,86 (d, 1H).

Exemplo de Preparação 3

Preparação de N-[2-(2'-naftilcarbonil)-2-propil]-5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazolecarboxamida (composto N.º 2-1)

(1) Adicionou-se, gota a gota, um reagente de Grignard preparado usando 0,61 g de magnésio, 3,6 g de 2-bromopropano e 18 ml de éter dietílico anidro, a uma mistura compreendendo 3,0 g de 2-naftonitrilo e 20 ml de éter dietílico anidro. Após o término da adição gota a gota, fez-se reagir a mistura durante 12 horas, sob refluxo. Colocou-se a mistura reacional em água gelada, e adicionou-se ácido sulfúrico 6 N para tornar a mistura ligeiramente ácida, seguindo-se agitação durante 0,5 horas. Efetuou-se a extração da mistura com acetato de etilo, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de

magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/50) para obter 1,14 g de 2-naftilisopropilcetona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,27 (d, 6H), 3,73 (m, 1H), 7,53 a 7,65 (m, 2H), 7,86 a 7,92 (m, 2H), 7,97 (d, 1H), 8,03 (dd, 1H), 8,48 (d, 1H).

(2) Adicionaram-se 2,16 g de tribrometo de feniltrimetilamónia a uma mistura compreendendo 1,14 g de 2-naftilisopropilcetona e 25 ml de tetrahidrofurano, e fez-se reagir a mistura, à temperatura ambiente, durante 3 horas. Filtrou-se a mistura reacional, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 1,59 g do óleo α -bromoisopropil-2-naftilcetona.

(3) Adicionaram-se 0,75 g de azida de sódio a uma mistura compreendendo 1,59 g de α -bromoisopropil-2-naftilcetona e 40 ml de sulfóxido de dimetilo, e fez-se reagir a mistura a 50°C, durante 1,5 horas. Colocou-se a mistura reacional em água e efetuou-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 1,19 g do óleo α -azidaisopropil-2-naftilcetona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,68 (s, 1H), 7,54 a 7,66 (m, 2H), 7,86 a 7,90 (m, 2H), 7,98 (d, 1H), 8,10 (dd, 1H), 8,74 (d, 1H).

(4) Fez-se reagir durante uma hora, à temperatura ambiente, numa atmosfera de hidrogénio, uma mistura compreendendo 0,3 g de α -azidaisopropil-2-naftilcetona, 10 ml de metanol e 15 mg de paládio em carbono a 5%. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 0,26 g de óleo α -aminoisopropil-2-naftilcetona.

(5) Adicionaram-se 0,19 g de trietilamina a uma mistura

compreendendo 0,26 g de α -aminoisopropil-2-naftilcetona e 10 ml de tetrahidrofurano, e adicionou-se-lhe gota a gota uma mistura compreendendo 0,24 g de cloreto de 5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazolecarbonilo e 5 ml de tetrahidrofurano, sob arrefecimento com gelo. Após a adição gota a gota, fez-se reagir a mistura, durante 15 horas, à temperatura ambiente. Efetuou-se a extração da mistura reacional com acetato de etilo, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 2/3) para obter 0,15 g do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 145 a 147°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,87 (s, 6H), 2,28 (s, 3H), 3,79 (s, 3H), 7,05 (s, 1H), 7,48 a 7,58 (m, 2H), 7,80 a 7,90 (m, 3H), 8,05 (dd, 1H), 8,56 (d, 1H).

Exemplo de Preparação 4

Preparação de N-[2-[(2',2',3',3'-tetrafluoro-1',4'-benzodioxan-6'-il)carbonil]isopropil]-3-metil-2-tiofenocarboxamida (composto N.º 4-10 seguidamente mencionado)

(1) Adicionaram-se, gota a gota, 7,3 ml de n-butil-lítio (solução 1,57 M de n-hexano) a -50°C numa atmosfera de azoto a uma mistura compreendendo 3,0 g de 6-bromo-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxano e 38 ml de éter dietílico, seguido de agitação durante 30 minutos à mesma temperatura. A seguir, adicionaram-se gota a gota 0,83 g de isobutilaldeído a uma temperatura de -70°C, no máximo, e aqueceu-se a mistura até a temperatura ambiente e fez-se reagir durante 15 horas. Colocou-se a mistura reacional em água e corrigiu-se com ácido clorídrico para a tornar ligeiramente ácida, e efetuou-se a extração com éter dietílico. Lavou-se a camada orgânica com água, secou-se sobre sulfato de magnésio e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de revelação: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 1,8 g do óleo 1-(2',2',3',3'-tetrafluoro-1',4'-benzodioxan-6'-il)-2-metilpropanol.

Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 0,83 (d, 3H), 0,96 (d, 3H), 1,92 (m, 1H), 4,40 (d, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,10 (s, 2H), 7,14 (s, 1H).

(2) Adicionou-se uma mistura compreendendo 1,8 g de 1-(2',2',3',3'-tetrafluoro-1',4'-benzodioxan-6'-il)-2-metilpropanol e 7 ml de diclorometano a uma mistura compreendendo 2,08 g de clorocromato de piridínio, 1,05 g de acetato de sódio e 20 ml de diclorometano, seguida de uma reação durante duas horas à temperatura ambiente. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de revelação: acetato de etilo/ n-hexano = 1/19) para obter 1,40 g do óleo 2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-isopropilcetona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,23 (d, 6H), 3,48 (m, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,81 (dd, 1H).

(3) Adicionaram-se 1,89 g de tribrometo de feniltrimetilamónia a uma mistura compreendendo 1,40 g de 2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-isopropilcetona e 19,7 ml de tetrahidrofurano, seguindo-se uma reação, durante duas horas, à temperatura ambiente. Filtrou-se a mistura reacional, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 1,78 g do óleo α -bromoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-ilcetona.

(4) Adicionaram-se 0,65 g de azida de sódio a uma mistura compreendendo 1,78 g de α -bromoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-ilcetona e 10 ml de sulfóxido de dimetilo, seguindo-se uma reação, durante duas horas, a 50°C. Colocou-se a mistura reacional em água e efetuou-se a extração com éter dietílico, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/19) para obter 1,5 g do óleo α -azidaisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-ilcetona. Os dados do espectro de RMN deste

produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,61 (s, 6H), 7,23 (d, 1H), 8,01 a 8,03 (m, 2H).

(5) Fez-se reagir durante uma hora, à temperatura ambiente, numa atmosfera de hidrogénio, uma mistura compreendendo 0,25 g de α -azidaisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-ilcetona, 15 ml de metanol e 13 mg de paládio em carbono a 5%. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 0,23 g do óleo α -aminoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-ilcetona.

(6) Adicionaram-se 0,16 g de trietilamina a uma mistura compreendendo 0,23 g de α -aminoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-ilcetona e 10 ml de tetrahidrofurano, e adicionou-se-lhe gota a gota uma mistura compreendendo 0,13 g de cloreto de 3-metil-2-tiofenoecarbonilo e 5 ml de tetrahidrofurano, sob arrefecimento com gelo, seguido de reação durante 3 horas, à temperatura ambiente. Efetuou-se a extração da mistura reacional com acetato de etilo, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/4) para obter 0,23 g do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 120 a 122°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,76 (s, 6H), 2,39 (s, 3H), 6,54 (s, 1H), 6,84 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,96 (s, 1H).

Exemplo de Preparação 5

Preparação de N-[(3',4'-dicloro-1,1-dimetil)fenacil]-3-metil-2-tiofenocarboxamida (composto N.º 1-20 seguidamente mencionado)

Adicionaram-se 303 mg de trietilamina a uma mistura compreendendo 268 mg de cloridrato de α -amino-3,4-dicloroisobutirofenona obtido em conformidade com o processo (1) a (5) descrito anteriormente no Exemplo de Preparação 1

e 5 ml de tetrahidrofurano, e adicionou-se-lhe gota a gota uma mistura compreendendo 265 mg de cloreto de 3-metil-2-tiofenocarbonilo e 2,5 ml de tetrahidrofurano, sob arrefecimento com gelo. Após o término da adição gota a gota, fez-se reagir a mistura, durante 3 horas, à temperatura ambiente. Efetuou-se a extração da mistura reacional com acetato de etilo, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/3) para obter 180 mg do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 141°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,72 (s, 6H), 2,37 (s, 3H), 6,53 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,86 (dd, 1H), 8,13 (s, 1H).

Exemplo de Preparação 6

Preparação de N-[(4'-metoxi-2'-metil-1,1-dimetil)-fenacil]-3-metil-2-tiofenocarboxamida (composto N.º 1-160 seguidamente mencionado)

(1) Adicionou-se gota a gota uma mistura compreendendo 5,7 g de cloreto de isobutililo e 5 ml de dissulfureto de carbono, a 10°C no máximo, a uma mistura compreendendo 7,15 g de cloreto de alumínio e 20 ml de dissulfureto de carbono, seguido de uma reação durante 0,5 h. A seguir, adicionou-se gota a gota uma mistura compreendendo 5,0 g de m-cresol e 5 ml de dissulfureto de carbono a 5°C no máximo, seguido de uma reação durante 4 horas à temperatura ambiente. Colocou-se a mistura reacional numa mistura de água gelada e ácido clorídrico e efetuou-se a extração com cloreto de metileno, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de sódio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Ao resíduo adicionaram-se 60 ml de tetrahidrofurano, 30 ml de água e 3,7 g de hidróxido de sódio, seguidos de uma reação durante 1,5 horas à temperatura ambiente. Concentrou-se a mistura reacional a pressão reduzida, depois colocou-se em água gelada e corrigiu-se com ácido sulfúrico diluído para a tornar ligeiramente ácida, e depois efetuou-se a extração com

acetato de etilo. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 2,45 g do sólido 4-hidroxi-2-metil-isobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,15 (d, 6H), 2,43 (s, 3H), 3,40 (m, 1H), 6,70 (m, 2H), 7,57 (d, 1H).

(2) A uma mistura compreendendo 0,8 g de 4-hidroxi-2-metil-isobutirofenona, 0,68 g de carbonato de potássio e 15 ml de dimetilformamida, adicionou-se uma mistura compreendendo 0,62 g de sulfato de dimetilo e 3 ml de dimetilformamida, seguido de uma reação durante 3 horas, à temperatura ambiente. Colocou-se a mistura reacional em água e efetuou-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 0,59 g do óleo 4-metoxi-2-metil-isobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,13 (d, 6H), 2,46 (s, 1H), 3,38 (m, 1H), 6,72 (m, 2H), 7,59 (d, 1H).

(3) A uma mistura compreendendo 0,59 g de 4-metoxi-2-metil-isobutirofenona e 15 ml de tetrahidrofurano adicionaram-se 1,16 g de tribrometo de feniltrimetilamónio, seguido de uma reação durante 2,5 horas, à temperatura ambiente. Adicionou-se éter dietílico à mistura de reação e filtrou-se a matéria insolúvel. Concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 0,7 g do óleo α -bromo-4-metoxi-2-metilisobutirofenona.

(4) Adicionaram-se 0,4 g de azida de sódio a uma mistura compreendendo 0,7 g de α -bromo-4-metoxi-2-metilisobutirofenona e 8 ml de sulfóxido de dimetilo, seguindo-se uma reação, durante 1,5 horas, a 50°C. Colocou-se a mistura reacional em água e efetuou-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada

orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/9) para obter 0,67 g do óleo α -azida-4-metoxi-2-metilisobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,54 (s, 6H), 2,33 (s, 1H), 3,81 (s, 3H), 6,72 (dd, 1H), 6,75 (d, 1H), 7,61 (d, 1H).

(5) Fez-se reagir durante 3 horas, à temperatura ambiente, numa atmosfera de hidrogénio, uma mistura compreendendo 0,25 g de α -azida-4-metoxi-2-metilisobutirofenona, 10 ml de metanol e 13 mg de paládio em carbono a 5%. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 0,23 g de óleo α -amino-4-metoxi-2-metilisobutirofenona.

(6) Adicionaram-se 0,13 g de trietilamina a uma mistura compreendendo 0,22 g de α -amino-4-metoxi-2-metilisobutirofenona e 12 ml de tetrahydrofurano, e adicionou-se-lhe gota a gota uma mistura compreendendo 0,17 g de cloreto de 3-metil-2-tiofenoecarbonilo e 3 ml de tetrahydrofurano, sob arrefecimento com gelo. Após o término da adição gota a gota, fez-se reagir a mistura, à temperatura ambiente, durante duas horas. Efetuou-se a extração da mistura reacional com acetato de etilo, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/3) para obter 0,35 g do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 99 a 101°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,77 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 6,81 (dd, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,85 (m, 2H), 7,26 (d, 1H), 7,49 (d, 1H).

Exemplo de Preparação 7

Preparação de N-[(3',4'-dimetoxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-metil-2-tiofenocarboxamida (composto N.º 1-535 seguidamente mencionado)

(1) A uma mistura contendo 5,0 g de 3,4-dimetoxi-benzaldeído e 50 ml de éter dietílico, adicionou-se gota a gota uma solução de brometo de isopropilmagnésio em éter, preparada usando 5,6 g de 2-bromopropano, 0,94 g de magnésio e 30 ml de éter dietílico, seguida de uma reação durante 15 horas, sob refluxo. Colocou-se a mistura reacional em água gelada, e adicionou-se ácido sulfúrico diluído seguido de agitação. A seguir, efetuou-se a extração da mistura com cloreto de metileno, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de sódio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida para obter 6,3 g do óleo 1-(3',4'-dimetoxifenil)-2-metilpropanol.

(2) A uma mistura contendo 6,5 g de clorocromato de piridínio, 4,9 g de acetato de sódio e 100 ml de diclorometano adicionou-se uma mistura contendo 6,28 g de 1-(3',4'-dimetoxifenil)-2-metilpropanol e 30 ml de diclorometano, seguido de uma reação durante 15 horas, à temperatura ambiente. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 3/7) para obter 3,9 g do óleo 3,4-dimetoxi-isobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,70 (d, 6H), 3,50 (m, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,90 (s, 3H), 6,85 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,56 (dd, 1H).

(3) A uma mistura compreendendo 1,0 g de 3,4-dimetoxi-isobutirofenona e 20 ml de tetrahydrofurano adicionaram-se 1,81 g de tribrometo de feniltrimetilamônio, seguido de uma reação durante duas horas, à temperatura ambiente. Adicionou-se éter dietílico à mistura reacional e filtrou-se a matéria insolúvel. Concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter o óleo α -bromo-3,4-dimetoxi-isobutirofenona.

(4) Adicionaram-se 0,62 g de azida de sódio a uma mistura compreendendo α -bromo-3,4-dimetoxi-isobutirofenona e 20 ml de sulfóxido de dimetilo, seguindo-se uma reação, durante 1,5 horas, a 50°C. Colocou-se a mistura reacional em água e

efetuiu-se a extração com acetato de etilo, seguido de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de magnésio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 1/4) para obter 1,1 g do óleo α -azida-3,4-dimetoxi-isobutirofenona. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /400 MHz) 1,56 (s, 6H), 3,91 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 6,86 (d, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,94 (dd, 1H).

(5) Fez-se reagir durante 3 horas, à temperatura ambiente, numa atmosfera de hidrogénio, uma mistura compreendendo 0,25 g de α -azida-3,4-dimetoxi-isobutirofenona, 15 ml de metanol e 13 mg de paládio em carbono a 5%. Filtrou-se a mistura reacional através de celite, e concentrou-se o filtrado a pressão reduzida para obter 0,2 g de óleo α -amino-3,4-dimetoxi-isobutirofenona.

(6) Adicionaram-se 0,11 g de trietilamina a uma mistura compreendendo 0,2 g de α -amino-3,4-dimetoxi-isobutirofenona e 12 ml de 1,2-dicloroetano, e adicionou-se-lhe gota a gota uma mistura compreendendo 0,14 g de cloreto de 3-metil-2-tiofenoecarbonilo e 2 ml de 1,2-dicloroetano, sob arrefecimento com gelo. Após o término da adição gota a gota, fez-se reagir a mistura, durante 1,5 horas, à temperatura ambiente. Efetuiu-se a extração da mistura reacional com cloreto de metileno, seguida de lavagem com água. Secou-se a camada orgânica sobre sulfato de sódio anidro e depois concentrou-se a pressão reduzida. Purificou-se o resíduo por cromatografia de coluna em sílica gel (solvente de resolução: acetato de etilo/ n-hexano = 3/2) para obter 0,1 g do produto desejado possuindo um ponto de fusão de 138 a 140°C. Os dados do espectro de RMN deste produto são os seguintes:

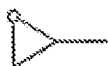
^1H -RMN δ ppm (Solvente: CDCl_3 /300 MHz) 1,82 (s, 6H), 2,44 (s, 3H), 3,89 (s, 6H), 6,80 (d, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H).

Agora, serão apresentados nos Quadros 1 a 9 exemplos típicos dos derivados de amida de ácido de fórmula (I) ou de

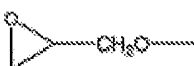
seus sais. Esses compostos podem ser preparados em conformidade com os Exemplos de Preparação anteriores ou pelos vários processos descritos anteriormente.

Nos Quadros, N.º representa o N.º do composto, Me representa metilo; Et, etilo; Pr(i), isopropilo; P(n), n-propilo; Bu(t), t-butilo; Bu(n), n-butilo; Bu(sec), s-butilo; CO, carbonilo; CO₂, carboxilo; e Ph, fenilo. Além disso, nos Quadros, Ph (4-Cl) representa fenilo com um átomo de cloro substituído na posição 4, e Ph (3,4-Cl₂) representa um fenilo com átomos de cloro substituídos nas posições 3 e 4. O mesmo se aplica a outras expressões. Também, as abreviaturas D1 a D7 e B1 a B17 usadas nos Quadros representam, respetivamente, os seguintes substituintes:

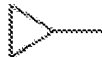
D1:



D2:



D3:



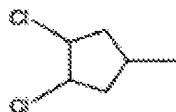
D4:



D5:



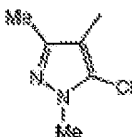
D6:



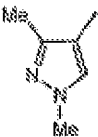
D7:



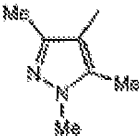
B1:



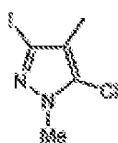
B2:



B3:

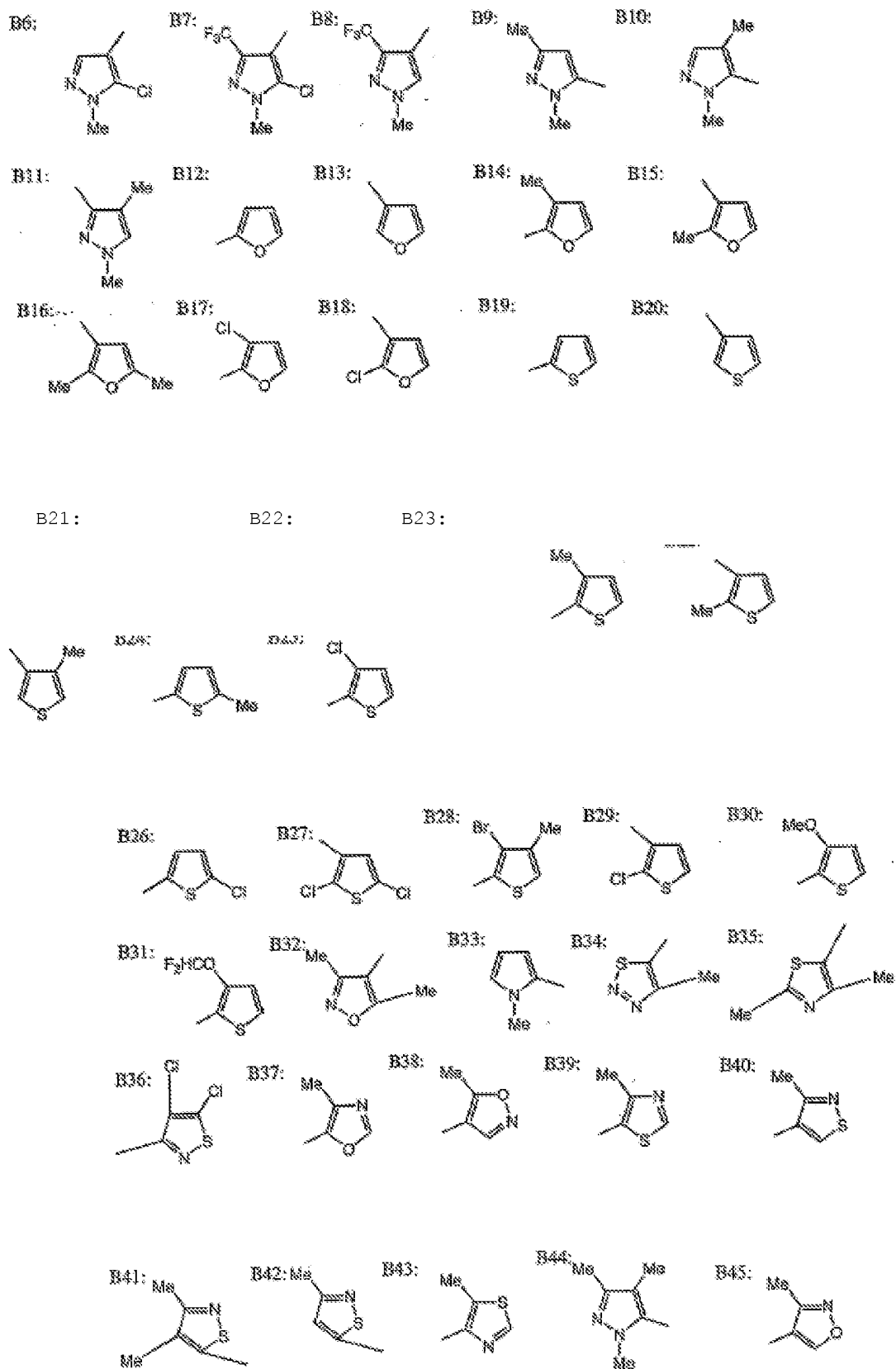


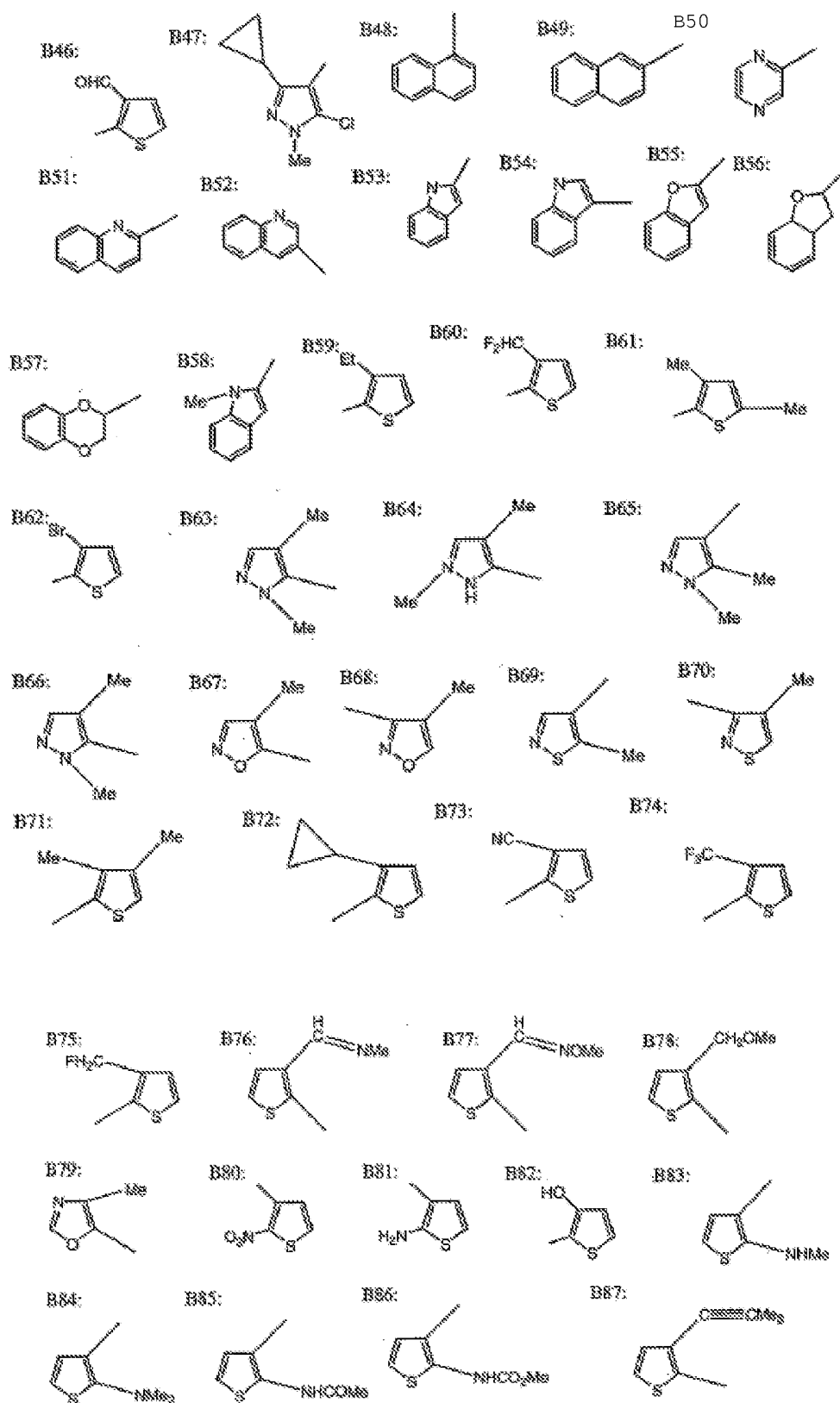
B4:

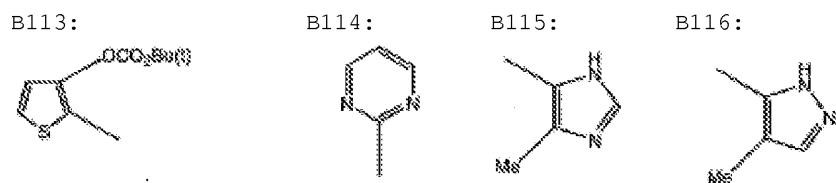
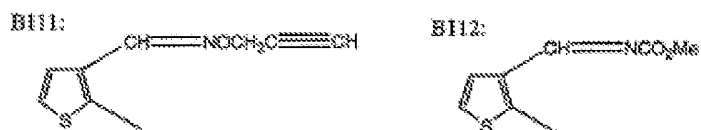
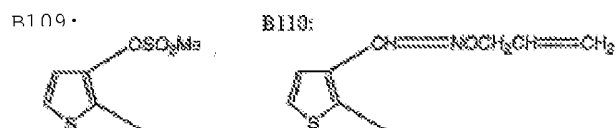
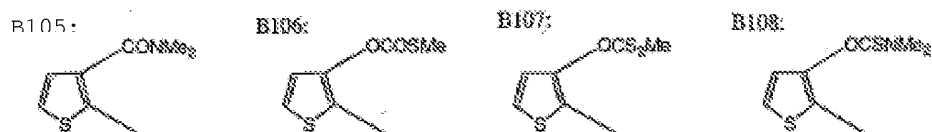
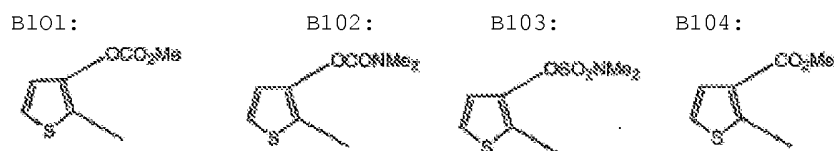
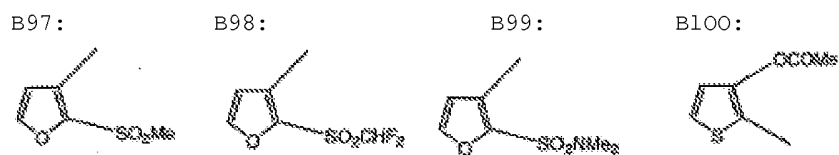
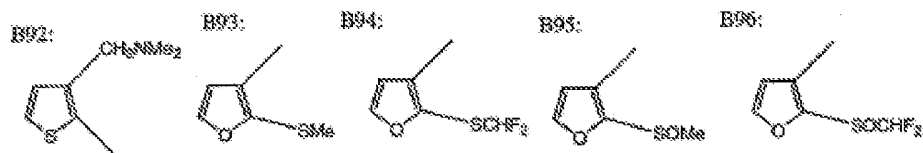
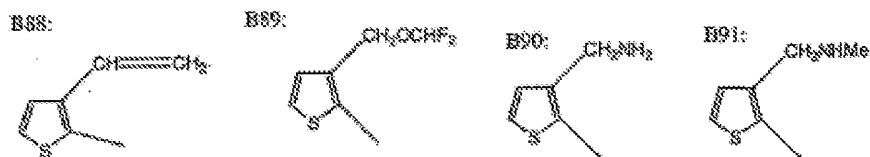


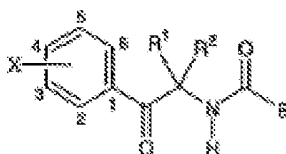
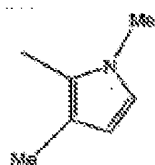
B5:











QUADRO 1

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-1	Me	Me	2-Me-4-F	B1	132-134
1-2	Me	Me	2-Me-4-F	B5	
1-3	Me	Me	2-Me-4-F	B8	
1-4	Me	Me	2-Me-4-Cl	B1	141-143
1-5	Me	Me	2-Me-4-Cl	B5	
1-6	Me	Me	2-Me-4-Cl	B21	96-100
1-7	Me	Me	2-Me-4-Br	B16	138-140
1-8	Me	Me	2-Me-4-Br	B8	
1-9	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	108-110
1-10	Me	Me	4-Cl	B1	186-188
1-11	Me	Me	4-Cl	B16	184-186
1-12	Me	Me	H	B7	168-170
1-13	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	188-189
1-14	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B16	170-173
1-15	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B7	182-183
1-16	Me	Me	3-Cl	B1	112-113
1-17	Me	Me	3-Cl	B16	150-151
1-18	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B2	200-201
1-19	Me	Me	4-Br	B21	174
1-20	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B21	141
1-21	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B25	Amorfo
1-22	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B14	137
1-23	Sal de Sódio do N.º 1-22				
1-24	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B24	Sólido
1-25	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B26	229
1-26	Me	Me	3-Br	B25	149
1-27	Me	Me	3-Br	B21	119
1-28	Me	Me	3-Me	B21	Oil
1-29	Me	Me	3-CF ₃	B21	Amorfo
1-30	Me	Me	3-OMe	B21	128

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-31	Me	Me	3-OCHF ₂	B21	110
1-32	Me	Me	4-Cl	B21	175
1-33	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B9	126-130
1-34	Me	Me	H	B1	103-105
1-35	Me	Me	4-Br	B19	235-240
1-36	Me	Me	4-Br	B16	183-185
1-37	Me	Me	4-Br	B20	245-247
1-38	Me	Me	3-Cl	B2	141-142
1-39	Me	Me	4-Cl	B2	140-141
1-40	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B12	225-227
1-41	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B5	171-172
1-42	Me	Me	3-F-4-F	B1	134-136
1-43	Me	Me	3-F-4-F	B16	150-152
1-44	Me	Me	2-Cl	B1	144-145
1-45	Me	Me	2-Cl	B16	130-132
1-46	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B6	Sólido
1-47	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B4	150-152
1-48	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B27	140-141
1-49	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B3	141-146
1-50	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B10	
1-51	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B11	
1-52	Me	Me	4-Br	B1	183-185
1-53	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B16	168-170
1-54	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B1	152-153
1-55	Me	Me	3-Br	B16	143-145
1-56	Me	Me	3-Br	B1	151-152
1-57	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B15	175-178
1-58	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B17	
1-59	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B18	
1-60	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B16	165-167
1-61	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B1	170-171

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-62	Me	Me	3-Me	B16	133-135
1-63	Me	Me	3-Me	B1	145-146
1-64	Me	Me	3-CF ₃	B16	125-127
1-65	Me	Me	3-CF ₃	B1	120-121
1-66	Me	Me	3-Cl	B21	128-130
1-67	Me	Me	3-Cl	B25	161-162
1-68	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B29	
1-69	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B30	93-96
1-70	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-71	Me	Me	3-OCHF ₂	B16	121-123
1-72	Me	Me	3-OCHF ₂	B1	138-139
1-73	Me	Me	3-OMe	B16	116-118
1-74	Me	Me	3-OMe	B1	118-120
1-75	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B22	155-158
1-76	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B31	Oil
1-77	Me	Me	3-Me-4-Me	B21	101-102
1-78	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B23	220-222
1-79	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B28	109-110
1-80	Me	Me	3-Cl-4-F	B21	124-126
1-81	Me	Me	3-Cl-4-F	B16	
1-82	Me	Me	3-Cl-4-F	B1	
1-83	-(CH ₂) ₅ -		4-Br	B7	
1-84	-(CH ₂) ₅ -		4-Br	B11	
1-85	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B1	
1-86	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B21	147-150
1-87	Me	Me	4-OCF ₃	B1	
1-88	Me	Me	3-OCF ₃	B21	
1-89	Me	Me	4-CF ₃	B1	
1-90	Me	Me	4-CF ₃	B21	113-115
1-91	Me	Me	4-CF ₃	B15	
1-92	Me	Me	4-CF ₃	B11	
1-93	Me	Me	3-Me-4-Me	B16	133-135
1-94	Me	Me	4-NO ₂	B16	179-180
1-95	Me	Me	4-NO ₂	B1	168-170

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-96	Me	Me	4-NO ₂	B21	135-137
1-97	Me	Me	3-Me-4-Me	B1	130-132
1-98	Me	Me	2-Me-4-OCHF ₂	B21	112-114
1-99	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B21	137-140
1-100	Me	Me	3-Cl-4-Br	B21	120-121
1-101	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108-112
1-102	Me	Me	3-Br-4-Cl	B21	117-120
1-103	Me	Me	3-Cl-4-Me	B21	115-118
1-104	Me	Me	2-Me-4-F	B21	107-109
1-105	Me	Me	4-Me	B21	152-154
1-106	Me	Me	4-OCF ₃	B21	116-120
1-107	Me	Me	3-Br-4-OCF ₃	B21	107-111
1-108	Me	Me	3-CF ₃ -4-Cl	B21	133-135
1-109	Me	Me	3-Cl-4-Br	B1	105-109
1-110	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B19	192-195
1-111	Me	Me	4-OCH ₂ CF ₃	B21	134-138
1-112	Me	Me	4-OCHF ₂	B21	118-120
1-113	Me	Me	3-OMe-4-Cl	B21	154-159
1-114	Me	Me	3-Me-4-OCF ₃	B21	116-118
1-115	Me	Me	3-Cl-4-Me-5-Me	B21	107-114
1-116	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B1	133-137
1-117	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B1	94-98
1-118	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B21	112-115
1-119	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B21	90-95
1-120	Me	Me	2-Me-3-Me-4-Cl	B21	Óleo
1-121	Me	Me	2-Cl-3-Me-4-Me	B21	Óleo
1-122	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B8	200-202
1-123	Me	H	4-Cl	B16	Óleo
1-124	Me	Me	4-Br	B39	126-129
1-125	Me	Me	4-Bu (t)	B21	130-134
1-126	Me	Me	4-Bu (t)	B1	161-165
1-127	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108-112
1-128	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B37	157-159
1-129	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B43	120-125
1-130	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B44	165-170

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-131	Me	Me	4-(2-tienil)	B21	119,2
1-132	Me	Me	4-(5-Me-2-tienil)	B21	176,8
1-133	Me	Me	4-(2-furil)	B21	>300
1-134	Me	Me	4-(3-tienil)	B21	>300
1-135	Me	Me	4-(5-Cl-2-tienil)	B21	153,5
1-136	Me	Me	4-(2-Me-3-tienil)	B21	Viscoso
1-137	Me	Me	4-(5-COMe-2-tienil)	B21	199,2
1-138	Me	Me	3-(2-tienil)	B21	134,2
1-139	Me	Me	3-(3-tienil)	B21	>300
1-140	Me	Me	3-(5-COMe-2-tienil)	B21	Óleo
1-141	Me	Me	3-(5-Cl-2-tienil)	B21	141,7
1-142	Me	Me	3-(5-Me-3-tienil)	B21	137,8
1-143	Me	Me	3-(4-Me-3-tienil)	B21	Amorfo
1-144	Me	Me	3-(2-furil)	B21	Sólido
1-145	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B32	135-137
1-146	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B33	164
1-147	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B34	153-154
1-148	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B35	Sólido
1-149	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B36	Sólido
1-150	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B39	142-145
1-151	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B40	145-146
1-152	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B79	140-142
1-153	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B38	165-166
1-154	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B41	136-140
1-155	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B42	175-178
1-156	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B45	175-177
1-157	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B46	Óleo
1-158	Me	Me	4-(5-CF ₃ -piridin-2-iloxi)	B1	127-128
1-159	Me	Me	4-(5-CF ₃ -piridin-2-iloxi)	B21	138-140
1-160	Me	Me	2-Me-4-OMe	B21	99-101
1-161	Me	Me	2-Me-4-OEt	B21	85-88
1-162	Me	Me	2-Me-4-CF ₃	B21	110-113
1-163	Me	Me	2-Me-4-Me	B21	102-105
1-164	Me	Me	2-Me	B21	79-82
1-165	Me	Me	2-Me-3-Cl	B21	109-111

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-166	Me	Me	2-Br-4-CF ₃	B21	90-92
1-167	Me	Me	3-Br-4-Br	B21	127-130
1-168	Me	Me	3-Me-4-OCHF ₂	B21	100-106
1-169	Me	Me	4-[D3]	B21	107-109
1-170	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B59	139-145
1-171	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B60	139-141
1-172	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B61	140-142
1-173	H	H	4-Cl	B21	119-121
1-174	Me	Me	2-Me-4-OPr	B21	97-100
1-175	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B62	89-92
1-176	Me	Me	3-Me-4-OMe	B21	123-125
1-177	Me	Me	3-Cl-4-OMe	B21	161-164
1-178	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OMe	B21	88-90
1-179	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OCHF ₂	B21	Óleo
1-180	Me	Me	4-OMe	B21	139-141
1-181	Me	Me	2-Me-4-OCOPr (i)	B21	Amorfo
1-182	Me	Me	2-Me-4-OH	B21	204-208
1-183	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B21	81-84
1-184	Me	Me	2-OMe	B21	Óleo
1-185	Me	Me	2-Me-3-OMe	B21	128-129
1-186	Me	Me	2-Me-4-OBu (n)	B21	69-71
1-187	Me	Me	2-Me-3-OCH ₂ CF ₃	B21	Óleo
1-188	Me	Me	2-Me-3-OCH ₂ CH ₂ OMe	B21	73-75
1-189	Me	H	4-Cl	B21	Óleo
1-190	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B21	96-98
1-191*	Me	Me	4-Br	B48	
1-192*	Me	Me	4-Br	B49	
1-193*	Me	Me	4-Br	B50	122-125
1-194*	Me	Me	4-Br	B51	
1-195*	Me	Me	4-Br	B52	192-195
1-196*	Me	Me	4-Br	B53	
1-197*	Me	Me	4-Br	B54	
1-198	Me	Me	4-Br	B13	
1-199	Me	Me	4-Br	B12	
1-200	Me	Me	4-Br	B63	132-134

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-201*	Me	Me	4-Br	B55	164-166
1-202*	Me	Me	4-Br	B56	145-147
1-203*	Me	Me	4-Br	B57	45-47
1-204*	Me	Me	4-Br	B57	50-58
1-205	Me	Me	3-F-4-Cl	B21	119-122
1-206	Me	Me	2-Me-4-Et	B21	77-81
1-207	Et	H	4-Cl	B21	114-117
1-208	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B21	103-104
1-209	Me	Me	3-OCHF ₂ -4-Cl	B21	106-110
1-210	Me	Me	3-Cl-4-OCHF ₂	B21	137-139
1-211	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B63	
1-212	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B64	
1-213	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B65	
1-214	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B66	
1-215	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B67	
1-216	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B68	
1-217	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B69	
1-218	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B70	
1-219	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B71	122-124
1-220	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B72	
1-221*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B73	
1-222	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B74	
1-223	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B75	
1-224*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B76	
1-225*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B77	
1-226*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B78	
1-227*	Me	Me	2-Me-4-O-[D3]	B21	
1-228	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-229	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OMe	B21	
1-230*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SMe	B21	
1-231	Me	Me	2-Me-5-OMe	B21	óleo
1-232	Me	Me	2-Me-5-Cl	B21	
1-233	Me	Me	2-Me-6-OMe	B21	
1-234	Me	Me	2-Me-6-Me	B21	
1-235	Me	Me	2-Me-4-OMe-6-Me	B21	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-236	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	
1-237	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	B21	
1-238	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₂ CF ₃	B21	
1-239	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	B21	
1-240	Me	Me	2-Et-4-OMe	B21	
1-241	Me	Me	2-CF ₃ -4-OMe	B21	
1-242	Me	Me	2-CF ₃ -4-Cl	B21	
1-243	Me	Me	3-Me-4-Br	B21	
1-244	Me	Me	3-Br-4-Me	B21	118-120
1-245*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-246*	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-247*	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-248*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ - [D3]	B21	
1-249*	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ - [D3]	B21	
1-250*	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ - [D3]	B21	
1-251*	Me	Me	2-Me-4-SMe	B21	
1-252*	Me	Me	2-Me-4-SOMe	B21	
1-253*	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ Me	B21	
1-254*	Me	Me	2-Me-4-CHO	B21	
1-255	Me	Me	2-Me-4-OCF ₃	B21	
1-256	Me	Me	2-Me-4-CHF ₂	B21	
1-257*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ - [D3]	B21	
1-258	Me	Me	2-Me-4- [D3]	B21	
1-259	Me	Me	2-OCHF ₂ -4-Cl	B21	
1-260	Me	Me	2-F-4-Cl	B21	
1-261	Me	Me	2-OMe-4-Cl	B21	
1-262*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCOMe	B21	
1-263*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OH	B21	
1-264	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ Br	B21	
1-265	Me	Me	2-Me-4-I	B21	
1-266	Me	Me	2-Me-3-OEt	B21	
1-267*	Me	Me	2-Me-4-ciclopentiloxi	B21	
1-268	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	97-102
1-269*	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-270	Me	Me	2-Me-4-OCOMe	B21	Óleo

* Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-271	Me	Me	2-Me-4-C≡CCMe ₃	B21	Amorfo
1-272*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ C≡CH	B21	
1-273	Me	Me	2-Me-4-OBu (s)	B21	Viscoso
1-274*	Me	Me	2-Me-4-OCH ([D3]) Me	B21	
1-275*	Me	Me	2-Me-4-NH ([D3]) Me	B21	
1-276	Me	Me	2-Me-4-C≡CPh	B21	Amorfo
1-277*	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	B21	
1-278*	Me	Me	2-Me-4-CN	B21	
1-279	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CCMe ₃	B21	
1-280	Me	Me	2-Me-4-C≡CMe	B21	
1-281	Me	Me	2-Me-4-C≡CH	B21	
1-282	Me	Me	2-Me-4-C≡CSiMe ₃	B21	Viscoso
1-283	Me	Me	2-Me-4- [D1]	B21	
1-284*	Me	Me	2-Me-4- [D2]	B21	
1-285*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CI	B21	
1-286	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CH	B21	
1-287*	Me	Me	2-Me-4-CH=CF ₂	B21	
1-288*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-289*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH=CCl ₂	B21	
1-290*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-291	Me	Me	2-Me-4- (CH ₂) ₅ CBrF ₂	B21	
1-292*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CI	B1	
1-293	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B1	
1-294	Me	Et	3-Me-4-Cl	B1	
1-295	Me	Et	2-Me-4-OMe	B1	
1-296	Me	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-297	Me	Et	2-Me-4-OPr (i)	B1	
1-298	Me	Et	3-Cl-4-Br	B1	
1-299	Me	Et	3-Br-4-Cl	B1	
1-300	Me	Et	3-F-4-Cl	B1	
1-301	Me	Et	3-Me-4-Br	B1	
1-302	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B1	
1-303	Et	Et	3-Me-4-Cl	B1	
1-304	Et	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-305	Et	Et	2-Me-4-OPr (i)	B1	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-306	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-307	Me	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-308	Me	Et	2-Me-4-OMe	B16	
1-309	Me	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-310	Me	Et	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-311	Me	Et	3-Cl-4-Br	B16	
1-312	Me	Et	3-Br-4-Cl	B16	
1-313	Me	Et	3-F-4-Cl	B16	
1-314	Me	Et	3-Me-4-Br	B16	
1-315	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-316	Et	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-317	Et	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-318	Et	Et	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-319	Me	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-320	Me	Et	2-Me-4-OMe	B21	
1-321	Me	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-322	Me	Et	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-323	Me	Et	3-Cl-4-Br	B21	
1-324	Me	Et	3-Br-4-Cl	B21	
1-325	Me	Et	3-F-4-Cl	B21	
1-326	Me	Et	3-Me-4-Br	B21	
1-327	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-328	Et	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-329	Et	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-330	Et	Et	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-331	Me	Me	3-Me-4-Cl	B71	
1-332	Me	Me	2-Me-4-OMe	B71	
1-333	Me	Me	2-Me-4-OEt	B71	
1-334	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B71	
1-335	Me	Me	3-Cl-4-Br	B71	
1-336	Me	Me	3-Br-4-Cl	B71	
1-337	Me	Me	3-F-4-Cl	B71	
1-338	Me	Me	3-Me-4-Br	B71	
1-339*	Me	Me	2-Me-4- [D4]	B21	
1-340*	Me	Me	2-Me-4- [D5]	B21	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-341*	Me	D3	3-Cl-4-Cl	B16	
1-342*	Me	D3	3-Me-4-Cl	B16	
1-343*	Me	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-344*	Me	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-345*	Me	D3	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-346*	Me	D3	3-Cl-4-Br	B16	
1-347*	Me	D3	3-Br-4-Cl	B16	
1-348*	Me	D3	3-F-4-Cl	B16	
1-349*	Me	D3	3-Me-4-Br	B16	
1-350*	H	D3	3-Cl-4-Cl	B16	
1-351*	H	D3	3-Me-4-Cl	B16	
1-352*	H	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-353*	H	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-354*	H	D3	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-355*	Me	D3	3-Cl-4-Cl	B21	
1-356*	Me	D3	3-Me-4-Cl	B21	
1-357*	Me	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-358*	Me	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-359*	Me	D3	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-360*	Me	D3	3-Cl-4-Br	B21	
1-361*	Me	D3	3-Br-4-Cl	B21	
1-362*	Me	D3	3-F-4-Cl	B21	
1-363*	Me	D3	3-Me-4-Br	B21	
1-364*	H	D3	3-Cl-4-Cl	B21	
1-365*	H	D3	3-Me-4-Cl	B21	
1-366*	H	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-367*	H	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-368*	H	D3	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-369*	Me	CH ₂ F	3-Cl-4-Cl	B21	
1-370*	Me	CH ₂ F	3-Me-4-Cl	B21	
1-371*	Me	CH ₂ Cl	2-Me-4-OMe	B21	
1-372*	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-373*	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OPr (i)	B21	
1-374*	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-375*	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OPr (i)	B21	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-376*	Me	Me	4-SMe	B16	
1-377*	Me	Me	4-SOMe	B16	
1-378*	Me	Me	4-SO ₂ Me	B16	
1-379*	Me	Me	4-SO ₂ CF ₃	B16	
1-380*	Me	Me	4-SO ₂ NMe ₂	B16	
1-381*	Me	Me	4-CH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-382*	Me	Me	4-CH ₂ NHMe	B16	
1-383*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NHMe	B21	
1-384*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-385*	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-386*	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-387*	Me	Me	4-OCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-388*	Me	Me	4-SCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-389*	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CH	B16	
1-390*	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CH	B16	
1-391*	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CI	B16	
1-392*	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CI	B16	
1-393*	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOMe	B21	
1-394*	Me	Me	4-S-CH ₂ CH=CF ₂	B16	
1-395*	Me	Me	4-SOCHF ₂	B16	
1-396*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCHF ₂	B21	
1-397*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NH ₂	B21	
1-398*	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-399*	Me	Me	2-Me-4-SOCHF ₂	B21	
1-400*	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CHF ₂	B21	
1-401*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ SMe	B21	
1-402*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NHMe	B21	
1-403*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	B21	
1-404*	Me	Me	2-Me-4-NH- [D3]	B21	
1-405*	Me	Me	2-Me-4-S- [D3]	B21	
1-406*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OCHF ₂	B71	
1-407*	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	B1	
1-408*	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ C≡CH	B1	
1-409*	Me	Me	4-CH=NCO ₂ Me	B1	
1-410*	Me	Me	2-Me-4-CH=NMe	B21	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-411*	Me	Me	2-Me-4-CH=N-OMe	B21	
1-412*	Me	Me	4-[D6]	B71	
1-413*	Me	Me	2-Me-4-OCOCF ₃	B21	
1-414*	Me	Me	2-Me-4-OCO ₂ Me	B16	
1-415*	Me	Me	2-Me-4-CONMe ₂	B16	
1-416*	Me	Me	2-Me-4-OCOSPh	B16	
1-417*	Me	Me	2-Me-4-OCSOMe	B14	
1-418*	Me	Me	2-Me-4-OCS ₂ Me	B14	
1-419*	Me	Me	2-Me-4-OCSNMe ₂	B14	
1-420*	Me	Me	2-Me-4-OSCCl ₃	B14	
1-421	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B14	
1-422*	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ CF ₃	B14	
1-423*	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Ph	B14	
1-424*	Me	Me	2-Me-4-OSNMe ₂	B14	
1-425*	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ NMe ₂	B14	
1-426*	Me	Me	2-Me-4-NH ₂	B14	
1-427*	Me	Me	2-Me-4-NH ₂ .HCl	B14	
1-428*	Me	Me	2-Me-4-NHMe	B14	
1-429*	Me	Me	2-Me-4-NMe ₂	B14	
1-430*	Me	Me	2-Me-4-NHCOMe	B14	
1-431*	Me	Me	2-Me-4-NHCOBu (t)	B14	
1-432*	Me	Me	2-Me-4-NHCOCF ₃	B14	
1-433*	Me	Me	2-Me-4-NHCO ₂ Me	B14	
1-434*	Me	Me	2-Me-4-N (Me) CO ₂ Me	B14	
1-435*	Me	Me	2-Me-4-NHCONMe ₂	B14	
1-436*	Me	Me	2-Me-4-NHCOSMe	B14	
1-437*	Me	Me	2-Me-4-NHCSOMe	B14	
1-438*	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Me	B14	
1-439*	Me	Me	2-Me-4-NHCSNMe ₂	B14	
1-440*	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Ph	B14	
1-441*	Me	Me	2-Me-4-NHSCCl ₃	B14	
1-442*	Me	Me	2-Me-4-NHSOMe	B14	
1-443*	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Me	B14	
1-444*	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Ph	B14	
1-445*	Me	Me	2-Me-4-NHCOPh	B14	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-446*	Me	Me	4-CO ₂ Me	B14	
1-447*	Me	Me	4-CO ₂ Et	B14	
1-448*	Me	Me	4-CO ₂ H	B14	
1-449*	Me	Me	4-CONH ₂	B14	
1-450*	Me	Me	4-CONMe ₂	B14	
1-451*	Me	Me	4-CONHMe	B14	
1-452*	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CF ₃	B21	
1-453*	Me	Me	2-Me-4-NCH ₂ CF ₃	B21	
1-454*	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-455*	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CH ₂ CF ₃	B21	
1-456*	Me	Me	2-Me-4-OCN	B21	
1-457*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CO ₂ Me	B21	
1-458*	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-459	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	
1-460*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ Me	B21	
1-461*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ H	B21	
1-462*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ OH	B21	
1-463*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ Br	B21	
1-464*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ NH ₂ .HCl	B21	
1-465*	Me	Me	2-Me-4-[D7]	B21	
1-466*	Me	Me	2-Me-4-C≡COEt	B21	
1-467*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCH ₂ OMe	B21	
1-468*	Me	Me	2-Me-4-C≡C[D4]	B21	
1-469*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ [D4]	B21	
1-470*	Me	Me	2-Me-4-[D5]	B14	
1-471*	Me	Me	2-Me-4-[D4]	B14	
1-472*	Me	Me	2-Me-4-CH=CH[D4]	B21	
1-473*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ [D4]	B21	
1-474*	Me	Me	2-Me-4-OC≡C[D4]	B21	
1-475*	Me	Me	2-Me-4-OCH=CH[D4]	B21	
1-476	Me	Me	4-Me	B62	
1-477	Me	Me	4-Me	B25	
1-478*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B80	
1-479*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B81	
1-480*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B82	

★ Referência

QUADRO 1 (Continuação)

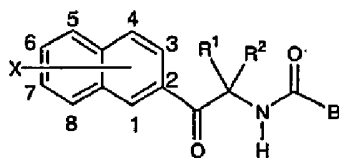
N. °	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-481*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B83	
1-482*	Me	Me	3-Me-4-Cl	B84	
1-483*	Me	Me	2-Me-4-OMe	B85	
1-484*	Me	Me	2-Me-4-OEt	B86	
1-485*	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B87	
1-486*	Me	Me	3-Cl-4-Br	B88	
1-487*	Me	Me	3-Br-4-Cl	B89	
1-488*	Me	Me	3-F-4-Cl	B90	
1-489*	Me	Me	3-Me-4-Br	B91	
1-490*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B92	
1-491*	Me	Me	3-Me-4-Cl	B93	
1-492*	Me	Me	2-Me-4-OMe	B94	
1-493*	Me	Me	2-Me-4-OEt	B95	
1-494*	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B96	
1-495*	Me	Me	3-Cl-4-Br	B97	
1-496*	Me	Me	3-Br-4-Cl	B98	
1-497*	Me	Me	3-F-4-Cl	B99	
1-498*	Me	Me	3-Me-4-Br	B100	
1-499*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B101	
1-500*	Me	Me	3-Me-4-Cl	B102	
1-501*	Me	Me	2-Me-4-OMe	B103	
1-502*	Me	Me	2-Me-4-OEt	B104	
1-503*	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B105	
1-504*	Me	Me	3-Cl-4-Br	B106	
1-505*	Me	Me	3-Br-4-Cl	B107	
1-506*	Me	Me	3-F-4-Cl	B108	
1-507*	Me	Me	3-Me-4-Br	B109	
1-508*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B110	
1-509*	Me	Me	3-Me-4-Cl	B111	
1-510*	Me	Me	2-Me-4-OMe	B112	
1-511*	Me	Me	2-Me-4-OEt	B113	
1-512*	Me	Me	2-Me-4-OPr (i)	B114	
1-513	Me	Me	3-Cl-4-Br	B115	
1-514	Me	Me	3-Br-4-Cl	B116	
1-515	Me	Me	3-F-4-Cl	B117	
1-516	Me	Me	2-Br-5-OMe	B21	Óleo
1-517	Me	Me	2-Me-4-OCH (Me) OMe	B16	

* Referência

QUADRO 1 (Continuação)

N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
1-518	Me	Me	4-CH ₂ Br	B25	Viscoso
1-519	Me	Me	4-CH ₂ Br	B62	108-111
1-520	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B25	97-102
1-521	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B25	Viscoso
1-522*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ Ph	B14	
1-523*	Me	CH ₂ Cl	3-F-4-Cl	B1	
1-524*	Me	CH ₂ Cl	3-Me-4-Br	B14	
1-525*	Me	CH ₂ Cl	3-Cl-4-Cl	B16	
1-526*	Me	CH=CH ₂	3-Me-4-Cl	B21	
1-527*	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OMe	B1	
1-528*	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OEt	B14	
1-529*	Me	CH=CH	2-Me-4-OPr (i)	B16	
1-530*	Me	CH=CH	3-Cl-4-Br	B21	
1-531*	Me	CH=CH	3-Br-4-Cl	B1	
1-532*	Me	CH ₂ OMe	3-F-4-Cl	B14	
1-533*	Me	CH ₂ OMe	3-Me-4-Br	B16	
1-534*	Me	CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B21	
1-535	Me	Me	3-OMe-4-OMe	B21	138-140
1-536	Me	Me	2-Br	B21	Viscoso
1-537*	Me	Me	4-SPh	B1	
1-538	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B62	74-76
1-539	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B62	Viscoso
1-540	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B21	117-119
1-541*	Me	Me	4-CH ₂ SMe	B21	
1-542	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-543*	Me	Me	2-Me-4-Ph (4-Cl)	B21	
1-544*	Me	Me	2-Me-4-Ph (4-OMe)	B21	
1-545*	Me	Me	2-Me-4-CH=CHCMe ₃	B16	
1-546*	Me	Me	2-Me-4-Ph (4-CF ₃)	B21	
1-547*	Me	Me	2-Me-4-CH=CHPh	B14	
1-548*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	B21	
1-549	Me	Me	4-Me	B25	96-98
1-550	Me	Me	4-Me	B62	98-102
1-551*	Me	Me	4-SCO ₂ Me	B1	
1-552*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CN	B16	
1-553*	Me	Me	4-NHPh	B1	
1-554	Me	Me	2-Me-4-OBu (t)	B21	

★ Referência



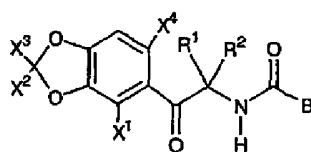
QUADRO 2

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
2-1	Me	Me	H	B1	145-147
2-2	Me	Me	H	B16	159-161
2-3	Me	Me	H	B7	152-154
2-4	Me	Me	H	B2	Sólido
2-5	Me	Et	H	B1	
2-6	Me	Et	H	B16	
2-7	Me	Et	H	B21	
2-8	-(CH ₂) ₅ -		H	B16	
2-9	Me	Me	H	B12	225-226
2-10	Me	Me	H	B5	159-160
2-11	Me	Me	H	B8	196-198
2-12	Me	Me	H	B13	195-197
2-13	Me	Me	H	B15	158-160
2-14	Me	Me	H	B21	163-164
2-15	-(CH ₂) ₅ -		H	B21	
2-16	Me	Et	H	B1	
2-17	Me	Et	H	B5	
2-18	Me	Et	H	B8	
2-19	Me	Et	H	B11	
2-20	Me	Et	H	B14	
2-21	Me	Et	H	B15	
2-22	Me	Et	H	B16	
2-23	Me	Et	H	B21	
2-24	Me	Me	1-Me	B1	
2-25	Me	Me	3-Me	B5	
2-26	Me	Me	4-Me	B8	
2-27	Me	Me	5-Me	B14	
2-28	Me	Me	6-Me	B15	
2-29	Me	Me	7-Me	B16	
2-30	Me	Me	8-Me	B21	

QUADRO 2 (Continuação)

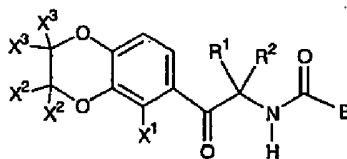
N.º	R¹	R²	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
2-31*	Me	Me	H	B48	
2-32*	Me	Me	H	B49	
2-33	Me	Me	H	B19	
2-34	Me	Me	H	B20	
2-35*	Me	Me	H	B50	
2-36	Me	Me	1-Me	B21	
2-37	Me	Me	1-Me	B16	

* Referência



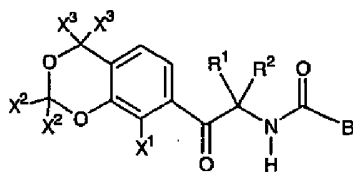
QUADRO 3

N. °	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
3-1	Me	Me	H	H	H	H	B1	127-128
3-2	Me	Me	H	H	H	H	B16	130-132
3-3	Me	Me	H	H	H	H	B21	155-158
3-4	Me	Me	H	F	F	H	B1	124-126
3-5	Me	Me	H	F	F	H	B16	
3-6	Me	Me	H	F	F	H	B21	116-118
3-7	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
3-8	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
3-9	Me	Me	Me	H	H	H	B21	98-102
3-10	Me	Me	Me	F	F	H	B1	99-107
3-11	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
3-12	Me	Me	Me	F	F	H	B21	145-148
3-13	Me	Me	Cl	H	H	H	B1	
3-14	Me	Me	Cl	H	H	H	B16	
3-15	Me	Me	Cl	H	H	H	B21	
3-16	Me	Me	Cl	F	F	H	B1	
3-17	Me	Me	Cl	F	F	H	B16	
3-18	Me	Me	Cl	F	F	H	B21	
3-19	Me	Me	Me	F	F	H	B8	142-145
3-20	Me	Me	Me	F	F	H	B5	104-108
3-21	- (CH ₂) ₅ -		H	F	F	H	B21	
3-22	- (CH ₂) ₅ -		Me	F	F	H	B1	
3-23	Me	Me	H	F	F	H	B5	158-160
3-24	Me	Me	Me	F	F	H	B47	97-99
3-25	Me	Me	H	F	F	Me	B21	85-90
3-26	Me	Me	H	H	H	Me	B21	111-114
3-27	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
3-28	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
3-29	Me	Me	Me	Et	H	H	B21	
3-30	Me	Me	Me	D3	H	H	B21	



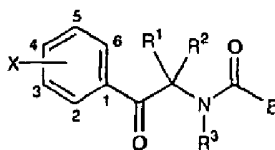
QUADRO 4

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
4-1	Me	Me	H	H	H	B1	
4-2	Me	Me	H	H	H	B5	
4-3	Me	Me	H	H	H	B8	
4-4	Me	Me	H	H	H	B16	
4-5	Me	Me	H	H	H	B21	
4-6	Me	Me	H	F	F	B1	
4-7	Me	Me	H	F	F	B5	
4-8	Me	Me	H	F	F	B8	
4-9	Me	Me	H	F	F	B11	
4-10	Me	Me	H	F	F	B21	120-122
4-11	Me	Me	Me	H	H	B1	
4-12	Me	Me	Me	H	H	B4	
4-13	Me	Me	Me	H	H	B8	
4-14	Me	Me	Me	H	H	B16	
4-15	Me	Me	Me	H	H	B21	
4-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
4-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
4-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
4-19	Me	Me	Me	F	F	B21	74-78
4-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
4-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
4-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
4-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
4-24	Me	Me	Me	Me	H	B1	
4-25	Me	Me	Me	Me	H	B5	
4-26	Me	Me	Me	Me	H	B8	
4-27	Me	Me	Me	H	Me	B1	
4-28	Me	Me	Me	H	Me	B5	
4-29	Me	Me	Me	H	Me	B8	
4-30	Me	Me	Me	H	Me	B71	



QUADRO 5

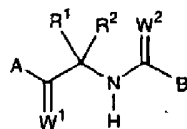
N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
5-1	Me	Me	H	H	H	B1	
5-2	Me	Me	H	H	H	B5	
5-3	Me	Me	H	H	H	B7	
5-4	Me	Me	H	H	H	B14	
5-5	Me	Me	H	H	H	B15	
5-6	Me	Me	Me	H	H	B1	
5-7	Me	Me	Me	H	H	B5	
5-8	Me	Me	Me	H	H	B8	
5-9	Me	Me	Me	H	H	B11	
5-10	Me	Me	Me	H	H	B21	
5-11	Me	Me	H	F	F	B1	
5-12	Me	Me	H	F	F	B4	
5-13	Me	Me	H	F	F	B8	
5-14	Me	Me	H	F	F	B16	
5-15	Me	Me	H	F	F	B21	
5-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
5-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
5-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
5-19	Me	Me	Me	F	F	B21	
5-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
5-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
5-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
5-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
5-24	Me	Me	Me	F	H	B1	
5-25	Me	Me	Me	F	H	B5	
5-26	Me	Me	Me	F	H	B8	
5-27	Me	Me	Me	Me	H	B14	
5-28	Me	Me	Me	Me	H	B16	
5-29	Me	Me	Me	Me	H	B21	
5-30	Me	Me	Me	Me	Me	B21	



QUADRO 6

N.º	R ¹	R ²	R ³	X	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
6-1	Me	Me	CO ₂ Bu (t)	4-Br	B21	Óleo
6-2	Me	Me	COMe	4-Br	B21	Óleo
6-3	Me	Me	COMe	3-Cl-4-Cl	B21	Óleo
6-4	Me	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	147-150
6-5	Me	Me	CO ₂ Bu (t)	3-Cl-4-Cl	B21	66-68
6-6*	Me	Me	SCCl ₃	3-Br-4-Cl	B1	
6-7*	Me	Me	SPh	3-Cl-4-Br	B5	
6-8*	Me	Me	SOPh	3-Me-4-Br	B8	
6-9*	Me	Me	SO ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B14	
6-10*	Me	Me	SO ₂ Me	3-Cl-4-Cl	B16	
6-11*	Me	Me	SO ₂ CF ₃	3-F-4-Cl	B21	
6-12*	Me	Me	SO ₂ NMe ₂	2-Me-4-OMe	B71	
6-13*	Me	Me	CH ₂ OMe	2-Me-4-OEt	B1	
6-14*	Me	Me	CH ₂ SMe	2-Me-4-OPr (i)	B5	
6-15*	Me	Me	CN	3-Br-4-Br	B8	
6-16*	Me	Me	CHO	2-Me-4-Cl	B14	
6-17*	Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-Me-4-Br	B16	
6-18*	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Br-4-Cl	B21	
6-19*	Me	Me	D3	3-Cl-4-Br	B71	
6-20*	Me	Me	OH	3-Me-4-Br	B1	
6-21*	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B5	
6-22*	Me	Me	CO ₂ CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B8	
6-23*	Me	Me	COPh	3-Cl-4-Cl	B14	
6-24*	Me	Me	COCF ₃	3-Cl-4-Cl	B16	
6-25*	Me	Me	CH ₂ C≡CH	3-Cl-4-Cl	B21	
6-26*	Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	3-F-4-Cl	B71	
6-27*	Me	Me	CH ₂ CN	2-Me-4-OMe	B1	
6-28*	Me	Me	Ciclopentiloxi	2-Me-4-OEt	B5	
6-29*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ OCHF ₂	2-Me-4-OPr (t)	B8	
6-30*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3-Br-4-Br	B14	
6-31*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NHMe	2-Me-4-Cl	B16	
6-32*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	2-Me-4-Br	B21	

* Referência



QUADRO 7

N. °	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
7-1	2-tienil	O	Me	Me	O	B1	101-105
7-2	2-tienil	O	Me	Me	O	B21	118-121
7-3	3-tienil	O	Me	Me	O	B1	121-125
7-4	5-Cl-3-tienil	O	Me	Me	O	B21	138-142
7-5	2-Cl-5-Cl-3-tienil	O	Me	Me	O	B21	119-121
7-6	5-Cl-2-tienil	O	Me	Me	O	B21	127-132
7-7	5-Cl-2-tienil	O	Me	Me	O	B1	115-120
7-8	4-Cl-2-tienil	O	Me	Me	O	B21	119-121
7-9	4-Cl-2-tienil	O	Me	Me	O	B1	Óleo
7-10*	1-naftil	O	Me	Me	O	B48	
7-11*	1-naftil	O	Me	Me	O	B49	
7-12	1-naftil	O	Me	Me	O	B19	
7-13	1-naftil	O	Me	Me	O	B20	
7-14*	1-naftil	O	Me	Me	O	B50	
7-15	1-naftil	O	Me	Me	O	B12	
7-16	1-naftil	O	Me	Me	O	B13	
7-17*	2-tienil	O	Me	Me	O	B48	
7-18*	2-tienil	O	Me	Me	O	B49	
7-19	2-tienil	O	Me	Me	O	B19	
7-20	2-tienil	O	Me	Me	O	B20	
7-21*	2-tienil	O	Me	Me	O	B50	
7-22	2-tienil	O	Me	Me	O	B12	
7-23	2-tienil	O	Me	Me	O	B13	
7-24*	3-tienil	O	Me	Me	O	B48	
7-25*	3-tienil	O	Me	Me	O	B49	
7-26	3-tienil	O	Me	Me	O	B19	
7-27	3-tienil	O	Me	Me	O	B20	
7-28*	3-tienil	O	Me	Me	O	B50	
7-29	3-tienil	O	Me	Me	O	B12	
7-30	3-tienil	O	Me	Me	O	B13	

* Referência

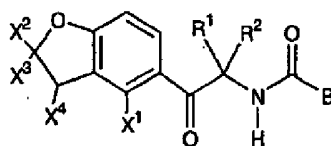
QUADRO 7 (Continuação)

N.º	A	W¹	R¹	R²	W²	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
7-31*	2-piridil	O	Me	Me	O	B48	
7-32*	2-piridil	O	Me	Me	O	B49	
7-33	2-piridil	O	Me	Me	O	B19	
7-34	2-piridil	O	Me	Me	O	B20	
7-35*	2-piridil	O	Me	Me	O	B50	
7-36	2-piridil	O	Me	Me	O	B12	
7-37	2-piridil	O	Me	Me	O	B13	
7-38*	3-piridil	O	Me	Me	O	B48	
7-39*	3-piridil	O	Me	Me	O	B49	
7-40	3-piridil	O	Me	Me	O	B19	
7-41	3-piridil	O	Me	Me	O	B20	
7-42*	3-piridil	O	Me	Me	O	B50	
7-43	3-piridil	O	Me	Me	O	B12	
7-44	4-piridil	O	Me	Me	O	B13	
7-45*	4-piridil	O	Me	Me	O	B48	
7-46*	4-piridil	O	Me	Me	O	B49	
7-47	4-piridil	O	Me	Me	O	B19	
7-48	4-piridil	O	Me	Me	O	B20	
7-49*	4-piridil	O	Me	Me	O	B50	
7-50	4-piridil	O	Me	Me	O	B12	
7-51	4-piridil	O	Me	Me	O	B13	
7-52*	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B48	
7-53*	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B49	
7-54	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B19	
7-55	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B20	
7-56*	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B50	
7-57	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B12	
7-58	Indol-3-il	O	Me	Me	O	B13	
7-59*	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B48	
7-60*	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B49	

* Referência

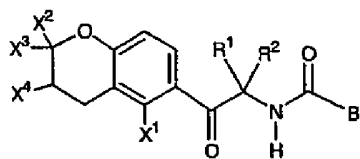
QUADRO 7 (Continuação)

N.º	A	W¹	R¹	R²	W²	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
7-61	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B19	
7-62	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B20	
7-63	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B50	
7-64	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B12	
7-65	N-Me-indol-3-il	O	Me	Me	O	B13	
7-66	3-tienil	O	Me	Me	O	B21	131-133
7-67	Ph(3,4-Cl ₂)	O	Me	Me	O	B21	
7-68	Ph(3,4-Cl ₂)	O	Me	Me	O	B21	
7-69	2-Cl-5-piridil	O	Me	Me	O	B21	
7-70	3-piridil	O	Me	Me	O	B21	
7-71	2-OMe-5-piridil	O	Me	Me	O	B21	
7-72	2-Cl-5-piridil	O	Me	Me	O	B16	
7-73	2-OMe-5-piridil	O	Me	Me	O	B16	
7-74	5-OMe-2-piridil	O	Me	Me	O	B21	
7-75	5-OMe-2-piridil	O	Me	Me	O	B16	
7-76	5-Cl-2-piridil	O	Me	Me	O	B21	
7-77	5-Cl-2-piridil	O	Me	Me	O	B16	



QUADRO 8

N. °	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
8-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
8-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
8-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
8-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
8-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
8-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
8-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
8-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
8-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
8-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
8-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
8-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
8-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
8-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
8-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
8-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
8-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
8-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
8-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
8-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
8-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
8-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
8-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
8-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
8-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
8-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
8-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
8-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
8-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
8-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	



QUADRO 9

N. °	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propriedades físicas (P.f. °C)
9-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
9-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
9-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
9-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
9-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
9-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
9-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
9-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
9-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
9-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
9-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
9-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
9-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
9-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
9-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
9-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
9-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
9-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
9-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
9-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
9-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
9-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
9-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
9-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
9-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
9-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
9-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
9-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
9-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
9-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	

QUADRO 10

N.º	¹ H-RMN δ ppm (Solvente: CDCl ₃ /400 MHz)
1-21	1,73 (s, 6H), 6,97 (d, 1H), 7,42 (m, 2H), 7,59 (s, 1H), 7,84 (dd, 1H), 8,10 (d, 1H)
1-24	1,56 (s, 6H), 1,71 (s, 3H), 6,44 (s, 1H), 6,71 (dd, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,82 (dd, 1H), 8,08 (d, 1H)
1-28	1,76 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,40 (s, 3H), 6,83 (m, 2H), 7,23 (m, 3H), 7,74 (m, 3H)
1-29	1,74 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 6,51 (s, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,22 (d, 1H); 7,50 (t, 1H), 7,70 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,26 (s, 1H)
1-46	1,73 (s, 6H), 3,88 (s, 3H), 6,75 (s, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,83 (m, 2H), 8,10 (d, 1H)
1-76	1,71 (s, 6H), 6,70 (t, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,42 (m, 3H), 7,81 (dd, 1H), 8,06 (d, 1H)
1-120	1,72 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,47 (s, 3H), 6,80 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 7,20 (d, 2H), 7,25 (d, 1H)
1-121	1,76 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,53 (s, 3H), 6,88 (d, 1H), 6,94 (s, 1H), 7,09 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,28 (d, 1H)
1-123	1,50 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 5,66 (m, 1H), 6,70 (bd, 1H), 7,48 (bd, 1H), 7,96 (d, 2H)
1-136	1,81 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 6,78 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,22 (m, 2H), 7,40 (d, 2H), 8,03 (d, 2H)
1-140	1,73 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,47 (s, 3H), 6,58 (s, 1H), 6,75 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,63 (dd, 1H), 7,91 (dd, 1H), 8,21 (d, 1H)
1-143	1,76 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 6,71 (s, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,93 (dd, 1H), 7,96 (d, 1H)
1-144	1,77 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 6,45 (d, 1H), 6,67 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,83 (dd, 1H), 8,26 (d, 1H)
1-148	1,72 (s, 6H), 2,53 (s, 3H), 2,65 (s, 3H), 6,38 (s, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,89 (dd, 1H), 8,05 (d, 1H)
1-149	1,74 (s, 6H), 7,45 (d, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,82 (dd, 1H), 8,07 (d, 1H)
1-157	1,76 (s, 6H), 7,38 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,83 (dd, 1H), 8,09 (d, 1H), 9,98 (s, 1H)
1-179	1,72 (s, 6H), 2,21 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 6,50 (t, 1H), 6,78 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 7,25 (m, 2H)
1-181	1,32 (d, 6H), 1,72 (s, 6H), 2,36 (s, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,80 (m, 1H), 6,74 (s, 1H), 6,84-6,92 (m, 2H), 6,98 (s, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,52 (d, 1H)

QUADRO 10 (Continuação)

N.º	¹ H-RMN δ ppm (Solvente: CDCl ₃ /400 MHz)
1-184	1,73 (s, 6H), 2,46 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 6,84 (d, 1H), 6,85-6,91 (m, 3H), 7,00 (t, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,27-7,39 (m, 2H)
1-187	1,75 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 2,43 (s, 3H), 4,35 (q, 2H), 6,69 (s, 1H), 6,71 (dd, 1H), 6,82 (d, 1H), 6,86 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,52 (d, 1H)
1-189	1,52 (d, 3H), 2,57 (s, 3H), 6,67 (m, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,0 (bd, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,50 (d, 2H), 7,97 (d, 2H)
1-231	1,77 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,48 (s, 3H), 3,77 (s, 3H), 6,85 (dd, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,89 (d, 1H), 6,97 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,26 (d, 1H)
1-270	1,75 (s, 6H), 2,29 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 6,73 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 6,91 (dd, 1H), 6,99 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,51 (d, 1H)
1-271	1,31 (d, 9H), 1,73 (s, 6H), 2,31 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 6,75 (s, 1H), 6,85 (d, 2H), 7,17 (dd, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,28 (bs, 1H), 7,39 (d, 1H)
1-273	0,96 (t, 3H), 1,26-1,31 (m, 3H), 1,61-1,75 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 4,32 (m, 1H), 6,64 (dd, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,47 (d, 1H)
1-276	1,75 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 2,43 (s, 3H), 6,71 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,34-7,36 (m, 3H), 7,43 (bs, 1H), 7,51-7,54 (m, 2H)
1-282	0,24 (s, 9H), 1,73 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 6,68 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,36 (bs, 1H), 7,42 (d, 1H)
1-516	1,78 (s, 6H), 2,53 (s, 3H), 3,79 (s, 3H), 6,76 (s, 1H), 6,83 (dd, 1H), 6,89 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,47 (d, 1H)
1-518	1,78 (s, 6H), 4,43 (s, 2H), 6,96 (d, 1H), 7,38 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,96 (d, 2H)
1-521	1,74 (s, 6H), 2,13 (s, 6H), 3,34 (s, 2H), 6,87 (d, 1H), 7,25 (d, 2H), 7,32 (d, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,88 (d, 2H)
1-536	1,73 (s, 6H), 2,48 (s, 3H), 6,75 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 7,22-7,26 (m, 2H), 7,32 (dt, 1H), 7,55-7,58 (m, 2H)
1-539	1,80 (s, 6H), 2,30 (s, 6H), 3,56 (s, 2H), 7,01 (d, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,93 (s, 1H), 7,98 (d, 2H)
2-4	1,87 (s, 6H), 2,45 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 7,54 (m, 2H), 7,69 (s, 1H), 7,90 (m, 3H), 8,00 (d, 1H), 8,50 (s, 1H)
6-1	0,75 (s, 3H), 1,34 (s, 9H), 1,59 (s, 3H), 2,57 (s, 3H), 6,93 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,39 (d, 2H), 7,54 (d, 2H)
6-2	0,74 (s, 3H), 1,62 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 6,92 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,37 (d, 2H), 7,53 (d, 2H)
6-3	1,60 (s, 6H), 2,04 (s, 3H), 2,54 (s, 3H), 6,91 (d, 1H), 7,29 (m, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,54 (s, 1H)
7-9	1,60 (s, 6H), 2,30 (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 6,67 (s, 1H), 6,91 (d, 1H), 7,25 (d, 1H)

Agora serão descritos Exemplos de Teste para as composições do presente invento. Determinou-se, em cada teste, o índice de controlo com base nos seguintes padrões:

[Índice de controlo]: [Grau do surto da doença: Observação visual]

- 5: Nenhuma lesão ou esporulação reconhecível;
- 4: Área de lesões, extensão de lesões, número de lesões ou área de esporulação é inferior a 10% do terreno não tratado.
- 3: Área de lesões, extensão de lesões, número de lesões ou área de esporulação é inferior a 40% do terreno não tratado.
- 2: Área de lesões, extensão de lesões, número de lesões ou área de esporulação é inferior a 70% do terreno não tratado.
- 1: Área de lesões, extensão de lesões, número de lesões ou área de esporulação é pelo menos 70% do terreno não tratado.

Exemplo de Teste 1:

Teste sobre o efeito preventivo contra o Oídio do Trigo

Cultivou-se trigo (cultivar: Norin-61-go) num vaso de plástico com um diâmetro de 7,5 cm, e quando este atingiu o estágio de 1,5 folhas, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (o mesmo dia da aplicação), limpam-se e inocularam-se conídias de Erysiphe graminis e mantiveram-se numa câmara de temperatura constante a 20°C. De 6 a 7 dias após a inoculação, investigou-se a área de esporulação, e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos anteriores N.º 1-13, 1-29, 1-39, 1-54, 1-90, 1-96, 1-100, 1-101, 1-106, 1-107, 1-109, 1-124, 1-125, 1-127, 1-148, 1-152, 1-156, 1-174, 1-175, 1-190, 1-205, 1-516, 3-4, 3-9, 3-10, 3-12, 3-19, 3-20, 4-19, 6-1 e 7-2, e todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm.

Exemplo de Teste 2:**Teste sobre o efeito preventivo contra o Oídio do Pepino**

Cultivou-se pepino (cultivar: Sagamihanpaku) num vaso de plástico com um diâmetro de 7,5 cm, e quando este atingiu o estágio de 1,5 folhas, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), pulverizou-se e inoculou-se uma suspensão de conídias de *Sphaerotheca fuliginea* e manteve-se numa câmara de temperatura constante a 20°C. De 6 a 7 dias após a inoculação, investigou-se a área de esporulação, e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos anteriores N.º 1-6, 1-9, 1-11, 1-14, 1-15, 1-17 a 1-22, 1-27 a 1-29, 1-32, 1-33, 1-36, 1-39, 1-41 a 1-43, 1-47, 1-53 a 1-56, 1-62 a 1-64, 1-66, 1-73, 1-77, 1-79, 1-90, 1-93, 1-97 a 1-104, 1-106 a 1-108, 1-111, 1-115, 1-119, 1-120, 1-124, 1-127, 1-129, 1-131, 1-148, 1-150, 1-152, 1-156, 1-160, 1-161, 1-164, 1-165, 1-167, 1-170, 1-172, 1-174, 1-175, 1-190, 1-205, 1-516, 2-1, 2-14, 3-2, 3-4, 3-6, 3-9, 3-10, 3-12, 3-19, 3-20, 3-23, 4-10 e 6-1 a 6-3, e todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm. Efetuou-se o teste relativamente ao composto anterior N.º 1-34, este apresentou um efeito com um índice de controlo de 4 a uma concentração de 200 ppm.

Exemplo de Teste 3:**Teste sobre o efeito preventivo contra a brusone do arroz**

Cultivou-se arroz (cultivar: Nihonbare) num vaso de plástico com um diâmetro de 7,5 cm, e quando este atingiu o estágio de 1,5 folhas, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), pulverizou-se e inoculou-se uma suspensão de conídias de *Pyricularia oryzae* e manteve-se numa caixa de

inoculação a 20°C durante 24 horas e, posteriormente, manteve-se numa câmara de temperatura constante a 20°C. De 5 a 7 dias após a inoculação, investigou-se o número de lesões, e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos anteriores N.º 1-6, 1-9, 1-13, 1-14, 1-28, 1-45, 1-47, 1-52, 1-53, 1-55, 1-56, 1-62, 1-63, 1-66, 1-75, 1-77, 1-79, 1-109, 1-119, 1-164, 2-1, 2-2, 3-25 e 4-19, e todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm.

Exemplo de Teste 4:

Teste sobre o efeito preventivo contra o mofo cinzento do Feijão comum

Cultivou-se feijão comum (cultivar: *Taisyoun Kintoki*) num vaso de plástico com um diâmetro de 15 cm, e quando a folha principal se desenvolveu suficientemente, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (o mesmo dia da aplicação ou o dia seguinte), inoculou-se uma suspensão de esporos de *Botrytis cinerea* (extrato de glucose de batata diluído até 50% com água) e manteve-se numa câmara de temperatura constante a 20°C. Três dias após a inoculação, investigou-se a extensão de lesões (mm), e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos anteriores N.º 1-11, 1-15, 1-17, 1-20, 1-22, 1-27, 1-41, 1-43, 1-52, 1-80, 1-99, 1-102, 1-112 a 1-115, 1-117, 1-118, 1-120, 1-125, 1-131, 1-136, 1-160, 1-162, 1-169, 1-172, 1-176, 1-180, 1-182, 1-186 a 1-189, 1-273, 2-2, 2-9, 2-13, 2-14 e 7-6, e todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm.

Exemplo de Teste 5:

Teste sobre o efeito preventivo contra a podridão do caule no Feijão comum

Cultivou-se feijão comum (cultivar: *Taisyoun Kintoki*) num vaso de plástico com um diâmetro de 15 cm, e quando a folha

principal se desenvolveu suficientemente, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), inoculou-se disco miceliar de Sclerotinia sclerotiorum e manteve-se numa câmara de temperatura constante a 20°C. Três dias após a inoculação, investigou-se a extensão de lesões (mm), e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos anteriores N.º 1-1, 1-4, 1-7, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-21, 1-26, 1-30 a 1-33, 1-36, 1-38, 1-42, 1-44, 1-46, 1-57, 1-60, 1-64, 1-69, 1-71, 1-73, 1-75, 1-80, 1-86, 1-93, 1-96 a 1-98, 1-103 a 1-105, 1-108, 1-111 a 1-114, 1-117, 1-118, 1-123, 1-126, 1-128, 1-129, 1-133 a 1-136, 1-141 a 1-144, 1-146, 1-149, 1-150, 1-159, 1-161 a 1-163, 1-165 a 1-171, 1-176, 1-180, 1-181, 1-186, 1-188, 1-208, 1-209, 1-271, 1-273, 1-276, 1-535, 2-1, 2-3, 2-4, 2-10, 2-11, 2-13, 3-2, 3-3, 3-6, 3-23, 3-26, 4-10, 6-2, 6-3, 7-2, 7-4, 7-6 a 7-8, e 7-66, e todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm.

Exemplo de Teste 6:

Teste sobre o efeito preventivo contra a mancha no glume do Trigo

Cultivou-se trigo (cultivar: Norin-61-go) num vaso de plástico com um diâmetro de 7,5 cm, e quando este atingiu o estágio de 1,5 folhas, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (no mesmo dia da aplicação), pulverizou-se e inoculou-se uma suspensão de conídias de Septoria nodorum e manteve-se numa caixa de inoculação a 20°C durante 72 horas e, posteriormente, manteve-se numa câmara de temperatura constante a 20°C. De 5 a 10 dias após a inoculação, investigou-se o número de lesões, e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos anteriores N.º 1-179 e 1-189, e

todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm.

Exemplo de Teste 7:

Teste sobre o efeito preventivo contra a rizoctomia do arroz

Cultivou-se arroz (cultivar: Nihonbare) num vaso de plástico com um diâmetro de 7,5 cm, e quando este atingiu o estágio de 5 folhas, aplicou-se através de um pulverizador, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal corrigida para uma concentração prescrita. Depois de a solução química secar (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), inseriu-se disco micelial de Rhizoctonia solani cultivado preliminarmente na bainha de uma folha e fixou-se com uma linha, e manteve-se numa caixa de inoculação a 25°C. De 5 a 7 dias após a inoculação, investigou-se a extensão das lesões, e determinou-se o índice de controlo em conformidade com os padrões de avaliação anteriores. Efetuou-se o teste relativamente aos compostos N.º 1-130, 1-137 e 3-3, e todos os compostos apresentaram efeitos com um índice de controlo de 4 ou 5 a uma concentração de 500 ppm.

Serão, agora, seguidamente descritos Exemplos de Formulação para as composições do presente invento. No entanto, a razão de peso, tipo de formulação ou outros do género não se restringem, de modo algum, aos Exemplos que se seguem.

Exemplo de Formulação 1:

(1) Composto de fórmula (I):	20 partes em peso
(2) Argila	72 partes em peso
(3) Ligninossulfonato de sódio	8 partes em peso

Misturam-se uniformemente os componentes anteriores para obter um pó molhável.

Exemplo de Formulação 2:

- | | |
|------------------------------|-------------------|
| (1) Composto de fórmula (I): | 5 partes em peso |
| (2) Talco | 95 partes em peso |

Misturam-se uniformemente os componentes anteriores para obter um pó.

Exemplo de Formulação 3:

- | | |
|---------------------------------------|-------------------|
| (1) Composto de fórmula (I): | 20 partes em peso |
| (2) N,N'-dimetilacetamida | 20 partes em peso |
| (3) Éter polioxietilenoalquilfenílico | 10 partes em peso |
| (4) Xileno | 50 partes em peso |

Misturam-se e dissolvem-se uniformemente os componentes anteriores para obter um concentrado destinado a emulsão.

Exemplo de Formulação 4:

- | | |
|--|-------------------|
| (1) Argila | 68 partes em peso |
| (2) Ligninossulfonato de sódio | 2 partes em peso |
| (3) Sulfato de polioxietilenoalquilarilo | 5 partes em peso |
| (4) Sílica fina | 25 partes em peso |

Mistura-se uma mistura dos componentes anteriores com o composto de fórmula (I) numa razão 4:1 em peso para obter um pó molhável.

Exemplo de Formulação 5:

- | | |
|--|---------------------|
| (1) Composto de fórmula (I): | 50 partes em peso |
| (2) Polialquilfenilfosfato-trietanolamina
oxilado | 2 partes em peso |
| (3) Silicone | 0,2 partes em peso |
| (4) Água | 47,8 partes em peso |

Misturam-se uniformemente os componentes anteriores e pulverizam-se para obter uma solução de reserva, e adicionam-se-lhes ainda:

- | | |
|------------------------------|---------------------|
| (5) Policarboxilato de sódio | 5 partes em peso |
| (6) Sulfato de sódio anidro | 42,8 partes em peso |

Seguidos de mistura uniforme, granulação e secagem para obter um granulado dispersável em água.

Exemplo de Formulação 6:

(1) Composto de fórmula (I):	5 partes em peso
(2) Éter polioxietilenooctilfenílico	1 parte em peso
(3) Fosfato de polioxietileno	0,1 partes em peso
(4) Partículas de carbonato de cálcio	93,9 partes em peso

Preliminarmente misturam-se uniformemente os componentes (1) a (3) anteriores e diluem-se com uma quantidade adequada de acetona, pulveriza-se a mistura diluída sobre o componente (4), e remove-se a acetona para obter um granulado.

Exemplo de Formulação 7:

(1) Composto de fórmula (I):	2,5 partes em peso
(2) N-metil-2-pirrolidona	2,5 partes em peso
(3) Óleo de soja	95,0 partes em peso

Misturam-se uniformemente os componentes anteriores e dissolvem-se para obter uma formulação de volume ultra baixo.

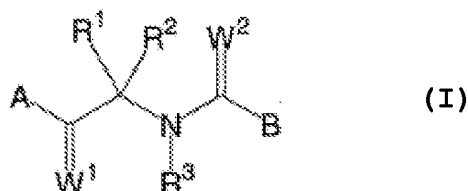
Exemplo de Formulação 8:

(1) Composto de fórmula (I):	20 partes em peso
(2) Polialquilfenolfosfato-trietanolamina oxilado	2 partes em peso
(3) Silicone	0,2 partes em peso
(4) Goma de xantano	0,1 partes em peso
(5) Etilenoglicol	5 partes em peso
(6) Água	72,7 partes em peso

Misturam-se uniformemente os componentes anteriores e pulverizam-se para obter um concentrado de suspensão à base de água.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição fungicida contendo um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal como componente ativo:



onde:

- A é fenilo que pode ser substituído por X,
Benzodioxolanilo que pode ser substituído por X, ou
Benzodioxanilo que pode ser substituído por X;
- B é furilo que pode ser substituído por Y, ou
Tienilo que pode ser substituído por Y;
- Cada R^1 e R^2
é alquilo, ou
 R^1 e R^2 juntos podem formar um anel carbocíclico saturado de 3 a 6 membros;
- X é flúor, cloro, iodo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi;
- Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi;
- R^3 é hidrogénio; e
Cada W^1 e W^2 é oxigénio.

2. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, onde B é furilo substituído com Y.

3. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, onde B é tienilo substituído com Y.

4. Composição de mistura de fungicidas compreendendo um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, de acordo com a reivindicação 1, e um outro composto componente ativo fungicida, como componentes ativos.

5. Composição de mistura de fungicidas de acordo com a reivindicação 4, onde o outro composto componente ativo fungicida referido é pelo menos um membro selecionado do

grupo que consiste num composto anilinopirimidina, um composto piridinamina, um composto azole, um composto quinoxalina, um composto ditiocarbamato, um composto orgânico de cloro, um composto imidazole, um composto cianoacetamida, um composto fenilamida, um composto ácido sulfénico, um composto de cobre, um composto isoxazole, um composto orgânico de fósforo, um composto N-halogenotioalquilo, um composto dicarboxi-imida, um composto benzanilida, um composto anilido, um composto piperazina, um composto piridina, um composto carbinol, um composto piperidina, um composto morfolina, um composto orgânico de estanho, um composto ureia, um composto ácido cinâmico, um composto fenilcarbamato, um composto cianopirrole, um composto estrobiluina, um composto oxazolidinona, um composto tiazolecarboxamida, um composto sililamida, um composto carbamato de amida de aminoácido, um composto imidazolidina, um composto hidroxianilida, um composto benzenossulfonamida, um composto éter oxima, um composto fenoxiamida, um antibiótico, um composto guanidina, isoprotiolano, piroquilona, diclomezina, quinoxifeno, cloridrato de propamocarbe, espiroxamina, cloropicrina, dazomet, metaína-sódio, nicobifeno, metrafenona MTF-753, UBF-307, diclocimet, proquinazida, NC-224, KIF-7767 e Singenta 446510.

6. Método para controlar fungos nocivos, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, de acordo com a reivindicação 1.

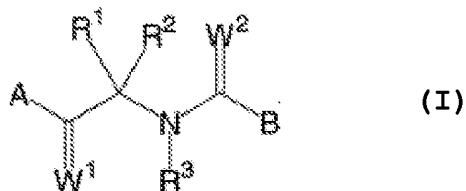
7. Método para controlar doenças de plantas, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, de acordo com a reivindicação 1.

8. Método para proteger plantas de cultura, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, de acordo com a reivindicação 1.

9. Método para melhorar o rendimento de colheitas, que compreende a aplicação de uma quantidade eficaz de um

derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal, de acordo com a reivindicação 1.

10. Derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou um seu sal:



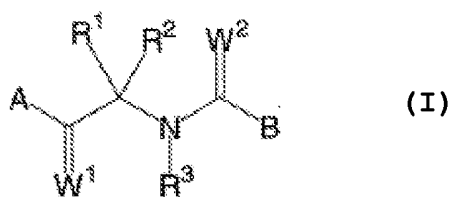
onde:

- A é fenilo que pode ser substituído por X,
Benzodioxolanilo que pode ser substituído por X, ou
Benzodioxanilo que pode ser substituído por X;
- B é furilo que pode ser substituído por Y, ou
Tienilo que pode ser substituído por Y;
- Cada R¹ e R²
é alquilo, ou
R¹ e R² juntos podem formar um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros;
- X é flúor, cloro, iodo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi;
- Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi, ou halogeneto de alcoxi;
- R³ é hidrogénio; e
Cada W¹ e W² é oxigénio.

11. Derivado de amida de ácido de acordo com a reivindicação 10, onde B é furilo substituído com Y.

12. Derivado de amida de ácido de acordo com a reivindicação 10, onde B é tienilo substituído com Y.

13. Utilização de um derivado de amida de ácido de fórmula (I) ou de um seu sal como fungicida agrícola ou hortícola para controlar fungos nocivos selecionados de oomicetes, ascomicetes, basidiomicetes ou deuteromicetes:



onde:

A é fenilo que pode ser substituído por X,
naftilo que pode ser substituído por X,
anel heterocíclico que pode ser substituído por X, ou
anel heterocíclico fundido que pode ser substituído por X;

B é um anel heterocíclico de 5 membros que pode ser substituído por Y,

X halogéneo,
alquilo,
halogeneto de alquilo,
alcoxialquilo,
dialquilaminoalquilo,
alcinilo,
trialquilsililalcinilo,
hidroxi,
alcoxi,
halogeneto de alcoxi,
alcoxialcoxi,
cicloalquilo,
nitro,
fenilo,
fenilalcinilo,
piridiloxi que pode ser substituído com halogeneto de alquilo
alquilcarboniloxi,
alquilsulfoniloxi, ou
anel heterocíclico (o anel heterocíclico pode ser substituído por halogéneo, alquilo, ou alquilcarbonilo);

Y é halogéneo, alquilo, halogeneto de alquilo, alcoxi,
halogeneto de alcoxi, cicloalquilo, ou formilo;

Cada R¹ e R², independente um do outro,
é hidrogénio, ou alquilo;

R³ é hidrogénio, alquilo, alquilcarbonilo, ou
alcoxicarbonilo; e

Cada W¹ e W², independente um do outro,

é oxigénio ou enxofre.

14. Utilização de um derivado de amida de ácido de acordo com a reivindicação 13, onde os fungos nocivos são ascomicetes ou deuteromicetes.

Lisboa, 2012-05-15