



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

(11) PI 0415848-2 B1

(22) Data do Depósito: 12/10/2004

(45) Data de Concessão: 25/04/2017



(54) Título: ISOPENTILCARBOXANILIDAS, SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, SEU USO E SEUS INTERMEDIÁRIOS, COMPOSIÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, E MÉTODO PARA CONTROLAR MICROORGANISMOS INDESEJADOS

(51) Int.Cl.: C07D 231/14; C07D 333/38; C07D 277/56; C07D 307/68; C07C 233/66; C07C 211/46; A01N 43/56; A01N 43/40; A01N 43/78; A01N 43/32; A01N 43/08

(30) Prioridade Unionista: 07/11/2003 DE 103 52 067.8, 23/10/2003 DE 103 49 498.7

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

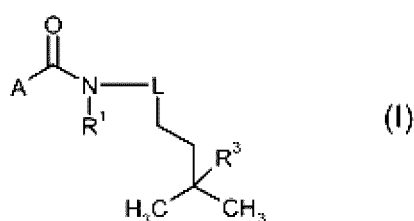
(72) Inventor(es): RALF DUNKEL; HANS-LUDWIG ELBE; JÖRG NICO GREUL; BENOIT HARTMANN; ULRIKE WACHENDORFF-NEUMANN; PETER DAHMEN; KARL-HEINZ KUCK

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"ISOPENTIL-CARBOXANILIDAS, SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, SEU USO E SEUS INTERMEDIÁRIOS, COMPOSIÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, E MÉTODO PARA CONTROLAR MICROORGANISMOS INDESEJADOS"**.

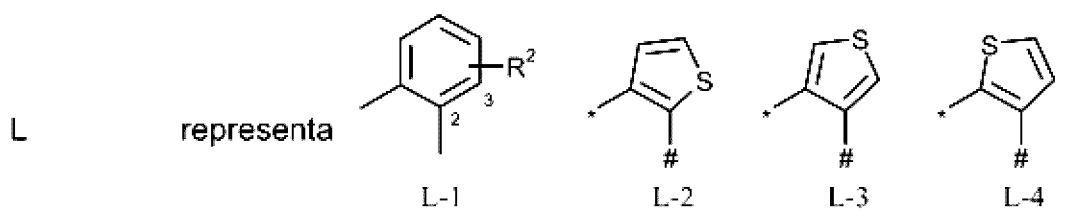
A presente invenção refere-se a novas isopentilcarboxanilidas, a uma pluralidade de processos para sua preparação e a seu uso para controlar microorganismos indesejados.

Já é conhecido que numerosas carboxanilidas têm propriedades fungicidas (conforme, por exemplo, WO 02/059086, WO 00/09482, EP-A 0 824 099, EP-A 0 755 927, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, JP 11-335364, JP 10-310577 e JP 10-251240). São conhecidos, por exemplo, 1-metil-N-[2-(3-metilbutil)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazola-4-carboxamida (de EP-A 0 824 099) e 2,5-dimetil-N-[3-(3-metilbutil)fenil]-3-furamida de (EP-A 0 755 927). A atividade destes compostos é boa; entretanto, é algumas vezes insatisfatória em baixas taxas de aplicação.

Esta invenção agora fornece novas isopentilcarboxanilidas da fórmula (I)



em que



em que a ligação rotulada com * é ligada à amida, ao passo que a ligação rotulada com # é ligada à cadeia lateral de alquila,

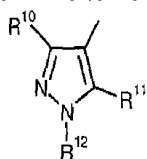
R¹ representa hidrogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₆-alquilsulfinila, C₁-C₆-alquilsulfonila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-cicloalquila; C₁-C₆-haloalquila, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila,

- halo-C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-halocicloalquila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formila, formila-C₁-C₃-alquila, (C₁-C₃-alquil)carbonil-C₁-C₃-alquila, (C₁-C₃-alcóxi)carbonil-C₁-C₃-alquila; halo-(C₁-C₃-alquil)carbonil-C₁-C₃-alquila, halo-(C₁-C₃-alcóxi)carbonil-C₁-C₃-alquila
- 5 tendo em cada caso de 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo;
- (C₁-C₈-alquil)carbonila, (C₁-C₈-alcóxi)carbonila, (C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquil)carbonila, (C₃-C₈-cicloalquil)carbonila; (C₁-C₆-haloalquil)carbonila, (C₁-C₆-haloalcóxi)carbonila, (halo-C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquil)carbonila, (C₃-C₈-halocicloalquil)carbonila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro
- 10 e/ou bromo; ou -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ ou -CH₂NR⁷R⁸,
- R² representa hidrogênio, flúor, cloro, metila ou trifluorometila,
- R³ representa hidrogênio, halogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-haloalquila,
- R⁴ representa hidrogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alcóxi, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-cicloalquila; C₁-C₆-haloalquila, C₁-C₆-haloalcóxi,
- 15 halo-C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-halocicloalquila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,
- R⁵ e R⁶ independentemente um do outro representam hidrogênio, C₁-C₈-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-cicloalquila; C₁-C₆-haloalquila, halo-C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₃-C₈-halocicloalquila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,
- 20 R⁵ e R⁶ além disso juntamente com o átomo de hidrogênio ao qual eles são ligados formam um heterocíclico saturado contendo 5 a 8 átomos de anel que é opcionalmente mono- ou polissubstituído por substituintes idênticos ou diferentes do grupo consistindo em halogênio e C₁-C₄-alquila, onde o heterocíclico pode conter 1 ou 2 outros heteroátomos não adjacentes do grupo consistindo em oxigênio, enxofre e NR⁹,
- 25 R⁷ e R⁸ independentemente um ou outro representam hidrogênio, C₁-C₈-alquila, C₃-C₈-cicloalquila; C₁-C₆-haloalquila, C₃-C₈-halocicloalquila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,
- 30 R⁷ e R⁸ além disso juntamente com o átomo de hidrogênio ao qual eles são ligados formam um heterocíclico saturado contendo 5 a 8

membros de anel que é opcionalmente mono- ou polissubstituído por substituintes idênticos ou diferentes do grupo consistindo em halogênio e C₁-C₄-alquila, onde o heterocíclico pode conter 1 ou 2 outros heteroátomos não adjacentes do grupo consistindo em oxigênio, enxofre e NR⁹,

5 R⁹ representa hidrogênio ou C₁-C₆-alquila,

A representa o radical da fórmula (A1)



(A1), em que

R¹⁰ representa hidrogênio, hidroxila, formila, ciano, halogênio, nitro, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi ou C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso de 1
10 a 5 átomos de halogênio, aminocarbonila ou aminocarbonila -C₁-C₄-alquila,

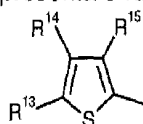
R¹¹ representa hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquila ou C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio, e

R¹² representa hidrogênio, C₁-C₄-alquila, hidróxi-C₁-C₄-alquila,
15 C₂-C₆-alquenila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalquiltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalcóxi-C₁-C₄-alquila tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio, ou representa fenila,

com a condição de que R¹⁰ não represente iodo se R¹¹ representar hidrogênio e
20

com a condição de que R¹⁰ não represente trifluorometila ou difluorometila se R⁹ e R¹¹ representarem hidrogênio e R¹² representar metila, ou

A representa o radical (A2)



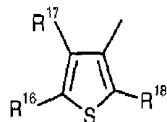
(A2), em que

25 R¹³ e R¹⁴ independentemente um ou outro representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio e

R^{15} representa halogênio, ciano ou C_1 - C_4 -alquila, ou C_1 - C_4 -haloalquila ou C_1 - C_4 -haloalcóxi tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

5 A representa o radical da fórmula (A3)

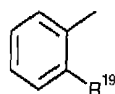


(A3), em que

R^{16} e R^{17} independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio e

10 R^{18} representa hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,
ou

A representa o radical da fórmula (A4)

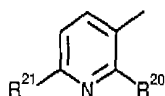


(A4), em que

R^{19} representa hidrogênio, halogênio, hidroxila, ciano, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalcóxi ou C_1 - C_4 -haloalquiltio tendo em
15 cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa o radical da fórmula (A5)



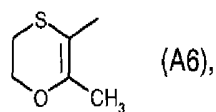
(A5), em que

R^{20} representa halogênio, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalquiltio ou C_1 - C_4 -haloalcóxi tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio e
20

R^{21} representa hidrogênio, halogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalcóxi tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio, C_1 - C_4 -alquilsulfonila ou C_1 - C_4 -alquil-sulfonila,

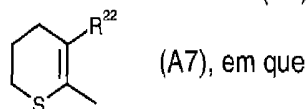
25 ou

A representa o radical da fórmula (A6)



ou

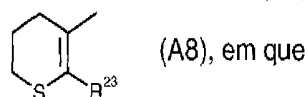
A representa o radical da fórmula (A7)



R^{22} representa C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

5 ou

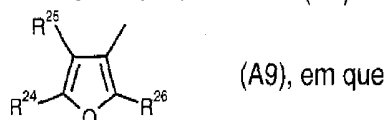
A representa o radical da fórmula (A8)



R^{23} representa C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

10 A representa o radical da fórmula (A9)



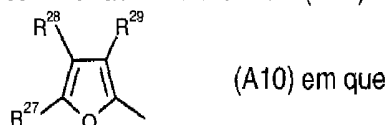
R^{24} e R^{25} independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, amino, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio e

15 R^{26} representa hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

com a condição de que R^{24} e R^{26} não podem simultaneamente representar metila se R^{25} representar hidrogênio,

ou

A representa o radical da fórmula (A10)



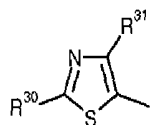
20 R^{27} e R^{28} independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, amino, nitro, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1

a 5 átomos de halogênio e

R^{29} representa halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

5 A representa o radical da fórmula (A11)



(A11) em que

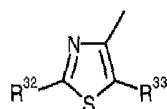
R^{30} representa hidrogênio, halogênio, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, ciano, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio e

R^{31} representa halogênio, hidroxila, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi,
10 C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_4 -haloalquila ou C_1 - C_4 -haloalcóxi tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio,

com a condição de que R^{31} não represente trifluorometila, difluorometila ou metila se R^3 representa hidrogênio e R^{30} representa metila,

ou

15 A representa o radical da fórmula (A12)



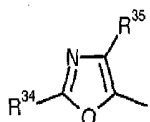
(A12) em que

R^{32} representa hidrogênio, halogênio, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, ciano, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio e

R^{33} representa halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila
20 tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa o radical da fórmula (A13)



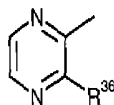
(A13) em que

R^{34} representa hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila e

R^{35} representa halogênio ou C_1 - C_4 -alquila,

25 ou

A representa o radical da fórmula (A14)

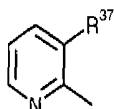


(A14) em que

R^{36} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

5 A representa o radical da fórmula (A15)

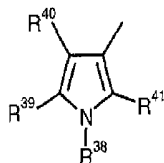


(A15) em que

R^{37} representa halogênio, hidroxila, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalquiltio ou C_1 - C_4 -haloalcóxi tendo em cada caso de 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

10 A representa o radical da fórmula (A16)



(A16) em que

R^{38} representa hidrogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, hidróxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, di(C_1 - C_4 -alquil)aminossulfonila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila ou em cada caso opcionalmente substituído por fenilsulfonila ou benzoíla,

15 R^{39} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

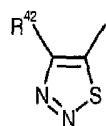
R^{40} representa hidrogênio, halogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

20 R^{41} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio,

com a condição de que R^{40} não represente trifluorometila,

ou

A representa o radical da fórmula (A17)



(A17) em que

 R^{42} representa C_1 - C_4 -alquila.

Se apropriado, os compostos de acordo com a invenção podem ser apresentados como misturas de várias formas isoméricas possíveis, em particular de estereoisômeros, tais como, por exemplo, E e Z, treo e eritro, e também isômeros opcionais, e, se apropriado, também de tautômeros. Que é reivindicado ambos são os isômeros E e Z, e também o treo e eritro e os isômeros opcionais, quaisquer misturas destes isômeros e as possíveis formas tautoméricas.

Além disso, foi descoberto que as isopentilcarboxanilidas da fórmula (I) são obtidas quando

a) ácido carboxílico derivado da fórmula (II)



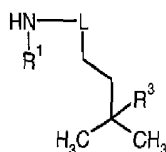
(II),

em que

A é como definido acima e

 X^1 representa halogênio ou hidroxila,

são reagidos com um derivado de anilina da fórmula (III)



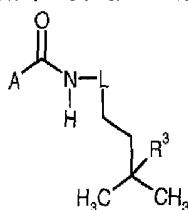
(III)

em que L, R^1 e R^3 são como definidos acima,

se apropriado na presença de um catalisador, se apropriado na presença de um agente condensador, se apropriado na presença de um aglutinante ácido e, se apropriado, na presença de um diluente,

ou

b) isopentilcarboxanilidas da fórmula (I-a)



(I-a)

em que

L, A e R^3 são como definidos acima

são reagidos com haletos da fórmula (IV)



5 em que

X^2 representa cloro, bromo ou iodo,

R^{1-A} representa C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_6 -alquilsulfonila, C_1 - C_6 -alquil-sulfonila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -cicloalquila; C_1 - C_6 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, halo- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -halocicloalquila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formila, formil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alquil)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila; halo-(C_1 - C_3 -alquil)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, halo-(C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila em cada caso tendo de 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo;

15 (C_1 - C_8 -alquil)carbonila, (C_1 - C_8 -alcóxi)carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquil)carbonila, (C_3 - C_8 -cicloalquil)carbonila; (C_1 - C_6 -haloalquil)carbonila, (C_1 - C_6 -haloalcóxi)carbonila, (halo- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquil)carbonila, (C_3 - C_8 -halocicloalquil)carbonila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; ou $-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ ou $-CH_2NR^7R^8$,

20 em que R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e R^8 são como definidos acima,
na presença de uma base e na presença de um diluente,

ou

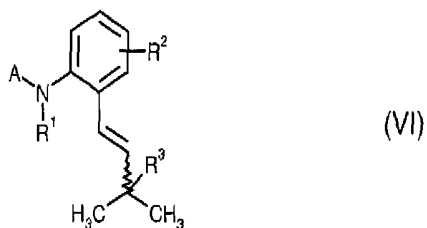
c) isopentona derivados da fórmula (V)
(V)

em que

25 R^1 , R^2 , R^3 e A são como definidos acima,
são reagidos com hidrazina (ou hidrato de hidrazina) na presença de uma base e, se apropriado, na presença de um diluente,

ou

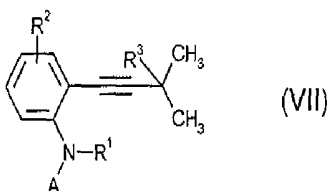
d) isopenteno derivada da fórmula (VI)



em que R^1 , R^2 , R^3 e A são como definidos acima,
são hidrogenados, se apropriado na presença de um diluente e
se apropriado na presença de um catalisador,

ou

5 e) derivados de isopentina da fórmula (VII)



em que R^1 , R^2 , R^3 e A são como definidos acima,
são hidrogenados, se apropriado na presença de um diluente e
se apropriado na presença de um catalisador.

Finalmente, descobriu-se que as novas isopentilcarboxanilidas
da fórmula (I) têm propriedades microbidas muito boas e podem ser em-
pregadas para controlar microorganismos indesejados tanto em proteção de
10 colheita quanto na proteção de materiais.

A fórmula (I) fornece uma definição geral das isopentilcarboxani-
lidas de acordo com a invenção. As definições de radical preferidas mostra-
das acima e abaixo são dadas abaixo. Estas definições aplicam-se tanto aos
15 produtos finais da fórmula (I) quanto igualmente a todos os intermediários.

L preferivelmente representa L-1 onde R^2 pode em cada caso
ter os significados geral, preferido, particularmente preferido, muito particu-
larmente preferido ou especialmente preferido.

20 L também preferivelmente representa L-2.

L também preferivelmente representa L-3.

L também preferivelmente representa L-4.

L particularmente preferível representa L-1, onde R^2 pode em

cada caso ter os significados geral, preferido, particularmente preferido, muito particularmente preferido ou especialmente preferido.

L também particularmente preferível representa L-2.

L muito particularmente preferível representa L-1 onde R² em
5 cada caso tem significado geral, preferido, particularmente preferido, muito particularmente preferido ou especialmente preferido

R¹ preferivelmente representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila, C₁-C₃-alcóxi-C₁-C₃-alquila, C₃-C₆-cicloalquil; C₁-C₄-haloalquil, C₁-C₄-haloalquiltio, C₁-C₄-haloalquilsulfinila, C₁-C₄-haloalquilsulfonila, halo-C₁-C₃-alcóxi-C₁-C₃-alquila, C₃-C₈-halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formila, formil-C₁-C₃-alquila, (C₁-C₃-alquil)carbonil-C₁-C₃-alquila, (C₁-C₃-alcóxi)carbonil-C₁-C₃-alquil; halo-(C₁-C₃-alquil)carbonil-C₁-C₃-alquila, halo-(C₁-C₃-alcóxi)carbonil-C₁-C₃-alquila tendo em cada caso 1 to 13 átomos de flúor, cloro e/ou
15 bromo;

(C₁-C₆-alquil)carbonila, (C₁-C₄-alcóxi)carbonila, (C₁-C₃-alcóxi-C₁-C₃-alquil) carbonila, (C₃-C₆-cicloalquil)carbonila; (C₁-C₄-haloalquil)carbonila, (C₁-C₄-haloalcóxi)carbonila, (halo-C₁-C₃-alcóxi-C₁-C₃-alquil)carbonila, (C₃-C₆-halocicloalquil)carbonila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo;
20 ou -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ ou -CH₂NR⁷R⁸.

R¹ particularmente preferível representa hidrogênio, metila, etila, n- ou isopropila, n-, iso-, sec- ou terc-butila, pentila ou hexila, metilsulfinila, etilsulfinila, n- ou isopropilsulfinila, n-, iso-, sec- ou terc-butilsulfinila, metilsulfonila, etilsulfonila, n- ou isopropilsulfonila, n-, iso-, sec- butilsulfonila, metoximetila, metoxietila, etoximetila, etoxietila, ciclopropila, ciclopentila, cicloexila, trifluorometila, triclorometila, trifluoroetila, difluorometiltio, difluoroclorometiltio, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinila, trifluorometilsulfonila, trifluorometoximetila; formila, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂, -CH₂-CO₂CH₃, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃,
30

$-(\text{CH}_2)_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$;

metilcarbonila, etilcarbonila, n-propilcarbonila, isopropilcarbonila, *terc*-butil-
 5 carbonila, metoxicarbonila, etoxicarbonila, *terc*-butoxicarbonila, ciclopropilcar-
 bonila; trifluorometilcarbonila, trifluorometoxicarbonila, ou $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$,
 $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ ou $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$.

R^1 muito particularmente preferível representa hidrogênio,
 metila, metoximetila, formila, $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$,
 10 $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$.

R^2 preferivelmente representa hidrogênio.

R^2 também preferivelmente representa flúor, onde flúor é parti-
cularmente preferível localizado na posição 4, 5 ou 6, muito particularmente
 15 preferível na posição 4 ou 6, especialmente na posição 4, do radical de ani-
 lida [conforme fórmula (I) acima].

R^2 também preferivelmente representa cloro, onde cloro é par-
ticularmente preferível localizado na posição 5 do radical de anilida [confor-
 me fórmula (I) acima]. Cloro é também particularmente preferível localizado
 20 na posição 4 do radical de anilida.

R^2 também preferivelmente representa metila, onde metila é
particularmente preferível localizado na posição 3 do radical de anilida [con-
 forme fórmula (I) acima].

R^2 também preferivelmente representa trifluorometila, onde tri-
 25 fluorometila é particularmente preferível localizado na posição 4 ou 5 do ra-
 dical de anilida [conforme fórmula (I) acima].

R^3 preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo,
 iodo, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -alquila, $\text{C}_1\text{-C}_6$ -haloalquila tendo 1 a 13 átomos de flúor, cloro
 e/ou bromo.

30 R^3 particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro,
 bromo, metila, etila, n-, isopropila, n-, iso-, sec-, *terc*-butila ou $\text{C}_1\text{-C}_4$ -
 haloalquila tendo 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^3 muito particularmente preferível representa hidrogênio flúor, cloro ou metila, etila ou trifluorometila.

R^4 preferivelmente representa hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquil; C_1 - C_4 -haloalquil, C_1 - C_4 -haloalcóxi, halo- C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila, C_3 - C_6 -halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^4 particularmente preferível representa hidrogênio, metila, etila, n- ou iso-propila, terc-butila, metóxi, etóxi, n- ou isopropóxi, terc-butóxi, ciclopropila; trifluorometila, trifluorometóxi.

10 R^5 e R^6 independentemente um do outro preferivelmente representam hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquil; C_1 - C_4 -haloalquil, halo- C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila, C_3 - C_6 -halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

15 R^5 e R^6 também juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados preferivelmente representam um heterociclo saturado que tem 5 a 8 átomos de anel que é opcionalmente mono- a tetrassubstituído por substituintes idênticos ou diferentes do grupo que consiste em halogênio e C_1 - C_4 -alquila, onde o heterociclo pode conter 1 ou 2 outros heteroátomos não adjacentes do grupo que consiste em oxigênio, enxofre e NR^9 .

20 R^5 e R^6 independentemente um do outro particularmente preferível representam hidrogênio, metila, etila, n- ou isopropila, n-, iso-, sec- ou terc-butila, metoximetila, metoxietila, etoximetila, etoxietila, ciclopropila, ciclopropila, cicloexila; trifluorometila, triclorometila, trifluoroetila, trifluorometoximetila.

25 R^5 e R^6 também juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados particularmente preferível representam um heterociclo saturado do grupo que consiste em morfolina, tiomorfolina e piperazina que é opcionalmente mono- a tetrassubstituído por substituintes idênticos ou diferentes do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e metila, onde a piperazina pode ser substituída no segundo átomo de nitrogênio por R^9 .

30 R^7 e R^8 independentemente um do outro preferivelmente representam hidrogênio, C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila; C_1 - C_4 -haloalquila, C_3 - C_6 -

halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^7 e R^8 também juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados preferivelmente representam um heterociclo saturado que tem 5 a 8 átomos de anel que é opcionalmente mono- a tetrassubstituído
5 por substituintes idênticos ou diferentes do grupo que consiste em halogênio e C_1 - C_4 -alquila, onde o heterociclo pode conter 1 ou 2 outros heteroátomos não adjacentes do grupo que consiste em oxigênio, enxofre e R^9 .

R^7 e R^8 independentemente um do outro particularmente preferível representam hidrogênio, metila, etila, n- ou isopropila, n-, iso-, sec- ou
10 terc-butila, metoximetila, metoxietila, etoximetila, etoxietila, ciclopropila, ciclopropentila, ciclohexila; trifluorometila, triclorometila, trifluoroetila, trifluorometoximetila.

R^7 e R^8 também juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual eles são ligados particularmente preferível representam um heterociclo saturado do grupo que consiste em morfolina, tiomorfolina e piperazina que é
15 opcionalmente mono- a tetrassubstituído por substituintes idênticos ou diferentes do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e metila, onde a piperazina pode ser substituída no segundo átomo de nitrogênio por R^9 .

R^9 preferivelmente representa hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila.

20 R^9 particularmente preferível representa hidrogênio, metila, etila, n- ou isopropila, n-, iso-, sec- ou terc-butila.

A particularmente representa um dos radicais
A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15 ou A16 mencionados acima.

25 A particularmente preferível representa um dos radicais A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A12, A13, A14, A15 ou A16 mencionados acima.

A muito particularmente preferível representa o radical A1.

A também muito particularmente preferível representa o radical A2.

30 A também muito particularmente preferível representa o radical A4.

A também muito particularmente preferível representa o radi-

cal A5.

A também muito particularmente preferível representa o radical A6.

cal A6.

A também muito particularmente preferível representa o radical A9.

5 cal A9.

A também muito particularmente preferível representa o radical A11.

cal A11.

A também muito particularmente preferível representa o radical A12.

cal A12.

10 A também muito particularmente preferível representa o radical A13.

cal A13.

A também muito particularmente preferível representa o radical A14.

cal A14.

A também muito particularmente preferível representa o radical A16.

15 cal A16.

R^{10} preferivelmente representa hidrogênio, hidroxila, formila, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, ciclopropila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, trifluorometiltio, difluorometiltio, aminocarbonila, aminocarbonilmetila ou aminocarboniletila,

20

com a condição de que R^{10} não representa iodo se R^{11} representar hidrogênio e com a condição de que R^{10} não represente trifluorometila ou difluorometila se R^3 e R^{11} representarem hidrogênio e R^{12} representar metila.

25

R^{10} particularmente preferível representa hidrogênio, hidroxila, formila, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, metóxi, etóxi, monofluorometila, monofluoroetila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, diclorometila, pentafluoroetila, ciclopropila, metóxi, etóxi, trifluorometóxi, difluorometóxi, triclorometóxi, metiltio, etiltio, trifluorometiltio ou difluorometiltio,

30

com a condição de que R^{10} não represente iodo se R^{11} representar hidrogênio e com a condição de que R^{10} não represente trifluorometi-

la ou difluorometila se R^3 e R^{11} representarem hidrogênio e R^{12} representar metila.

R^{10} muito particularmente preferível representa hidrogênio, hidroxila, formila, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, metóxi, ciclopropila, monofluorometila, monofluoroetila, difluorometila, diclorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, $-CHFCH_3$ ou difluorometóxi,

com a condição de que R^{10} não represente iodo se R^{11} representar hidrogênio e com a condição de que R^{10} não represente trifluorometila ou difluorometila se R^3 e R^{11} representarem hidrogênio e R^{12} representar metila.

R^{10} especialmente e preferivelmente representa hidrogênio, hidroxila, formila, cloro, metila, etila, metóxi, ciclopropila, monofluorometila, difluorometila, diclorometila, trifluorometila, $-CHFCH_3$ ou difluorometóxi,

com a condição de que R^{10} não represente trifluorometila ou difluorometila se R^3 e R^{11} representarem hidrogênio e R^{12} representar metila.

R^{11} preferivelmente representa hidrogênio, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

R^{11} particularmente preferível representa hidrogênio, cloro, bromo, iodo, metila ou $-CHFCH_3$.

R^{11} muito particularmente preferível representa hidrogênio, cloro, metila ou $-CHFCH_3$.

R^{12} preferivelmente representa hidrogênio, metila, etila, n-propila, isopropila, C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, hidroximetila, hidroxietila, ciclopropila, ciclopentila, cicloexila ou fenila.

R^{12} particularmente preferível representa hidrogênio, metila, etila, isopropila, trifluorometila, difluorometila, hidroximetila, hidroxietila ou fenila.

R^{12} muito particularmente preferível representa hidrogênio, metila, trifluorometila ou fenila.

R^{12} especialmente e preferivelmente representa metila.

R^{13} e R^{14} independentemente um do outro preferivelmente representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

5 R^{13} e R^{14} independentemente um do outro particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{13} e R^{14} independentemente um do outro muito particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila ou triclorometila.

10 R^{13} e R^{14} especialmente e preferivelmente cada qual representa hidrogênio.

R^{15} preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, metila, etila, C_1 - C_2 -haloalquila ou C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

15 R^{15} particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, metila, trifluorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi ou triclorometóxi.

R^{15} muito particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, iodo, metila, trifluorometila ou trifluorometóxi.

20 R^{15} especialmente e preferivelmente representa cloro ou metila.

R^{16} e R^{17} independentemente um do outro preferivelmente representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

25 R^{16} e R^{17} independentemente um do outro particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{16} e R^{17} independentemente um do outro muito particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou metila.

30 R^{16} e R^{17} especialmente e preferivelmente cada qual representa hidrogênio.

R^{18} preferivelmente representa hidrogênio, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{18} particularmente preferível representa hidrogênio, metila ou trifluorometila.

R^{18} muito particularmente preferível representa metila.

R^{19} preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi ou C_1 - C_2 -haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{19} particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi, triclorometóxi, trifluorometiltio, difluorometiltio, difluoroclorometiltio ou triclorometiltio.

R^{19} muito particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, difluorometila, trifluorometila ou triclorometila.

R^{19} especialmente e preferivelmente representa iodo, metila, difluorometila ou trifluorometila.

R^{20} preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, C_1 - C_2 -haloalquila ou C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{20} particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi ou triclorometóxi.

R^{20} muito particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, iodo, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R^{21} preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, C_1 - C_2 -haloalquila ou C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C_1 - C_2 -alquilsulfonila ou C_1 - C_2 -alquilsulfonila.

R^{21} particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro,

bromo, iodo, ciano, n-propila, isopropila, n-butila, iso-butila, sec-butila, terc-butila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi, triclorometóxi, metilsulfinila ou metilsulfonila.

- 5 R^{21} muito particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, n-propila, isopropila, n-butila, iso-butila, sec-butila, terc-butila, trifluorometila, difluorometila, triclorometila, metilsulfinila ou metilsulfonila.

R^{21} especialmente e preferivelmente representa hidrogênio.

- 10 R^{22} preferivelmente representa metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{22} particularmente preferível representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

- 15 R^{22} muito particularmente preferível representa metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R^{23} preferivelmente representa metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{23} particularmente preferível representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

- 20 R^{23} muito particularmente preferível representa metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R^{24} e R^{25} independentemente um do outro preferivelmente representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

- 25 R^{24} e R^{25} independentemente um do outro particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{24} e R^{25} independentemente um do outro muito particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou metila.

- 30 R^{24} e R^{25} especialmente e preferivelmente cada qual representa hidrogênio.

R^{26} preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo,

iodo, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R²⁶ particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclорometila.

R²⁶ muito particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou trifluorometila.

R²⁶ especialmente e preferivelmente representa metila ou trifluorometila.

R²⁷ e R²⁸ independentemente um do outro preferivelmente representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R²⁷ e R²⁸ independentemente um do outro particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, nitro, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclорometila.

R²⁷ e R²⁸ independentemente um do outro muito particularmente preferível representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclорometila.

R²⁷ e R²⁸ especialmente e preferivelmente cada qual representa hidrogênio.

R²⁹ preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R²⁹ particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclорometila.

R²⁹ muito particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclорometila.

R²⁹ especialmente e preferivelmente representa metila.

R³⁰ preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C₁-C₄-alquilamino, di(C₁-C₄-alquila)amino, ciano, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R³⁰ particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluorometila,

difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{30} muito particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

- 5 R^{30} especialmente e preferivelmente representa amino, metilamino, dimetilamino, metila ou trifluorometila.

R^{31} preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, hidroxila, metila, etila, metóxi, etóxi, ciclopropila, C_1 - C_2 -haloalquila ou C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

- 10 R^{31} particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, hidroxila, metila, etila, metóxi, etóxi, ciclopropila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

- R^{31} muito particularmente preferível representam flúor, cloro, bromo, hidroxila, metila, metóxi, ciclopropila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R^{32} preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di(C_1 - C_4 -alquila)amino, ciano, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

- 20 R^{32} particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{32} muito particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

- 25 R^{32} especialmente e preferivelmente representa amino, metilamino, dimetilamino, metila ou trifluorometila.

R^{33} preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

- 30 R^{33} particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{33} muito particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R³³ especialmente e preferivelmente representa metila, trifluorometila ou difluorometila.

R³⁴ preferivelmente representa hidrogênio, metila ou etila.

R³⁴ particularmente preferível representa metila.

5 R³⁵ preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

R³⁵ particularmente preferível representa flúor, cloro ou metila.

R³⁶ preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou
10 bromo.

R³⁶ particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou trifluorometila.

R³⁷ preferivelmente representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, C₁-C₄-alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio,
15 C₁-C₂-haloalquila ou C₁-C₂-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R³⁷ particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila.

20 R³⁷ muito particularmente preferível representa flúor, cloro, bromo, iodo, metila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R³⁸ preferivelmente representa hidrogênio, metila, etila, C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C₁-C₂-alcóxi-C₁-C₂-alquila, hidroximetila, hidroxietila, metilsulfonila ou dimetilaminosulfonila.

25 R³⁸ particularmente preferível representa hidrogênio, metila, etila, trifluorometila, metoximetila, etoximetila, hidroximetila ou hidroxietila.

R³⁸ muito particularmente preferível representa metila ou metoximetila.

R³⁹ preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou
30 bromo.

R³⁹ particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro,

bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila.

R^{39} muito particularmente preferível representa hidrogênio ou metila.

R^{40} preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, isopropila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{40} particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, isopropila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

R^{40} muito particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, metila ou trifluorometila.

R^{41} preferivelmente representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

R^{41} particularmente preferível representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila ou trifluorometila.

R^{41} muito particularmente preferível representa hidrogênio ou trifluorometila.

R^{42} preferivelmente representa metila, etila, n-propila ou isopropila.

R^{42} particularmente preferível representa metila ou etila.

Ênfase é dada a compostos da fórmula (I) na qual L representa L-1, onde R^2 tem os significados gerais dados acima.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que L representa L-1, onde R^2 tem os significados preferidos dados acima.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que L representa L-1, onde R^2 tem os significados particularmente preferidos dados acima.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que L representa L-1, onde R^2 tem os muito particularmente preferidos significados dados acima.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que L representa L-1, onde R^2 tem os especialmente preferidos significados dados acima.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que L representa L-2.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que R^1 representa hidrogênio.

5 Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que R^1 representa formila.

Ênfase é também dada aos compostos da fórmula (I) em que R^1 representa $-C(=O)C(=O)R^4$ onde R^4 é como acima definido.

10 Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que A representa A1.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que R^3 representa hidrogênio.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que R^3 representa halogênio, preferivelmente flúor, cloro, bromo ou iodo, particularmente
15 preferível flúor, cloro ou bromo, muito particularmente preferível flúor ou cloro.

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que R^3 representa C_1 - C_8 -alquila, preferivelmente C_1 - C_6 -alquila, particularmente preferível metila, etila, n-, isopropila, n-, iso-, sec- ou terc-butila, muito particularmente preferível metila ou etila.

20 Ênfase é dada aos compostos da fórmula (I) em que R^3 representa C_1 - C_8 -haloalquila, preferivelmente C_1 - C_6 -haloalquila tendo 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, particularmente preferível C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, muito particularmente preferível trifluorometila.

25 Os radicais de hidrocarboneto saturados ou insaturados, tais como alquila ou alquenila, podem em cada caso ser de cadeia reta ou ramificada, até onde for possível, incluindo em combinação com heteroátomos, tais como, por exemplo, em alcóxi.

Os radicais opcionalmente substituídos podem ser mono- ou
30 polissubstituídos, onde no caso de polissubstituição os substituintes podem ser idênticos ou diferentes.

Os radicais substituídos por halogênio, tais como, por exemplo,

haloalquila, são mono- ou polihalogenados. No caso de polihalogenação, os átomos de halogênio podem ser idênticos ou diferentes. Aqui, o halogênio representa flúor, cloro, bromo e iodo, em particular flúor, cloro e bromo.

Entretanto, a geral ou preferidas definições e ilustrações de radical dadas acima podem também ser combinadas entre si como desejado, isto é, entre as respectivas faixas e faixas preferidas. As definições aplicam-se tanto aos produtos finais quanto, correspondentemente, aos precursores e intermediários.

As definições mencionadas podem ser combinadas entre si como desejado. Além disso, as definições individuais não podem se aplicar.

Preferência, particular preferência ou preferência muito particular é dada aos compostos da fórmula (I) que transportam os substituintes mencionados como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente.

15 Descrição dos processos de acordo com a invenção para preparar as isopentilcarboxanilidas da fórmula (I) e os intermediários

Processo (a)

Empregando cloreto de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonila e [2-(3-metilbutil)fenil]amina como materiais de partida, o processo (a) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo seguinte esquema de fórmula:

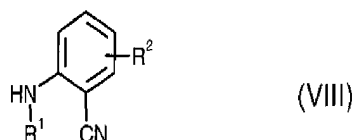
A fórmula (II) fornece uma definição geral dos derivados de ácido carboxílico requeridos como materiais de partida para realizar o processo (a) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (II), A preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível tem aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para A. X¹ preferivelmente representa cloro, bromo ou hidroxila.

Os derivados de ácido carboxílico da fórmula (II) são conhecidos e/ou podem ser preparados pelos processos conhecidos (conforme WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 e EP-A 0 589 313).

A fórmula (III) fornece uma definição geral dos derivados de anilina também requeridos como materiais de partida para realizar o processo (a) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (III), L, R¹ e R³ preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferido, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais.

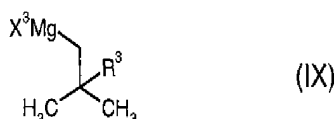
Alguns dos derivados de anilina da fórmula (III) em que L representa L-1 são novos. Os derivados de anilina da fórmula (III) em que L representa L-1 podem ser preparados

f) reagindo cianoanilinas da fórmula (VIII)



em que R¹ e R² são como acima definidos

em uma primeira etapa com um reagente Grignard da fórmula (IX)

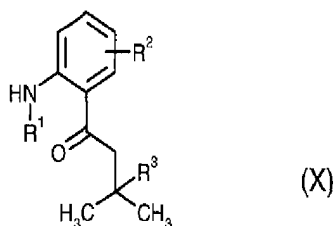


em que

R³ é como definido acima,

X³ representa cloro, bromo ou iodo,

se apropriado na presença de um diluente, e reagindo as alcanonaanilinas da fórmula (X)



em que R¹, R² e R³ são como acima definidos

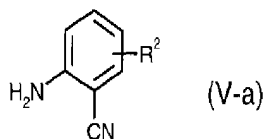
em uma segunda etapa com hidrazina (ou hidrato de hidrazina)

na presença de uma base (por exemplo hidróxidos de metal alcalino-terroso

e metal de álcali, tais como hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio) e, se apropriado, na presença de um diluente.

A fórmula (VIII) fornece uma definição geral das cianoanilinas requeridas como materiais de partida para realizar o processo (f) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (VIII), R^1 e R^2 preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais.

As cianoanilinas da fórmula (VIII) são conhecidas e/ou podem ser preparadas por processos conhecidos. Cianoanilinas da fórmula (VIII) em que R^1 não representa hidrogênio podem ser obtidas reagindo as cianoanilinas da fórmula (V-a)



em que R^2 é como definido acima com haletos da fórmula (IV)



em que R^{1-A} é como definido acima

na presença de uma base e na presença de um diluente. (As condições de reação do processo (b) aplicam-se correspondentemente).

A fórmula (IX) fornece uma definição geral dos reagentes Grignard também requeridos como materiais de partida para realizar o processo (f) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (IX), R^3 preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível tem aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferido, respectivamente, para este radical. X^3 preferivelmente representa bromo.

Os reagentes de Grignard da fórmula (IX) são conhecidos ou

podem ser obtidos pelos processos conhecidos.

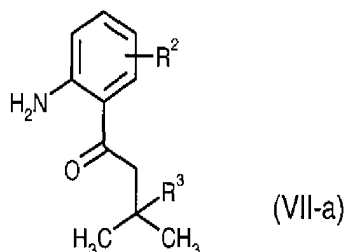
As alcanonaanilinas da fórmula (X), que são intermediários no processo (f) de acordo com a invenção, são novos e também fazem parte da matéria objeto deste pedido. Na fórmula (X), os radicais R^1 , R^2 e R^3 preferi-

5 velmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais.

10 Hidrazina (ou hidrato de hidrazina), que é também requerida como um reagente para o processo (f) de acordo com a invenção, é um produto químico conhecido para síntese.

O processo (f) de acordo com a invenção pode ser realizada em várias variantes. Desse modo, é possível inicialmente converter as cianoanilinas da fórmula (V-a) nas correspondentes alcanonaanilinas da fórmula (VII-

15 a)



em que R^2 e R^3 são como acima definidos,

que são então, se apropriado, reagidos com haletos da fórmula (IV)

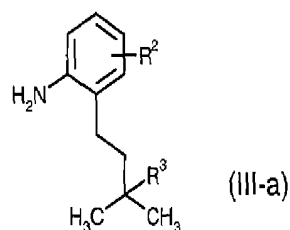


20 em que R^{1-A} é como definido acima

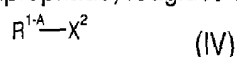
na presença de uma base e na presença de um diluente, para fornecer as alcanonaanilinas correspondentes da fórmula (X). [As condições de reação do processo (b) aplicam-se correspondentemente].

Entretanto, é também possível converter as alcanonaanilinas da fórmula (VII-a) de acordo com o processo (f) de acordo com a invenção nos

25 derivados de anilina correspondentes da fórmula (III-a)



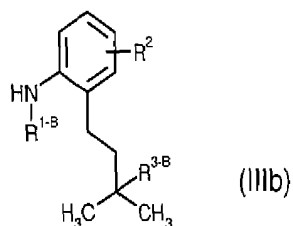
em que R^2 e R^3 são como acima definidos,
que são então, se apropriado, reagidos com haletos da fórmula (IV)



em que R^{1-A} é como definido acima

- 5 na presença de uma base e na presença de um diluente para fornecer os derivados de anilina correspondentes da fórmula (III). [As condições de reação de processo (b) aplicam-se correspondentemente.]

Os derivados de anilina da fórmula (III-b)



em que

- 10 a) R^{1-B} representa C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_6 -alquilsulfonila, C_1 - C_6 -alquilsulfonila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -cicloalquila; C_1 - C_6 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, halo- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formila, formil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alquila)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila; halo-(C_1 - C_3 -alquila)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, halo-(C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila tendo em cada caso 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; (C_1 - C_8 -alquila) carbonila, (C_1 - C_8 -alcóxi)carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila)carbonila, (C_3 - C_8 -cicloalquil)carbonila; (C_1 - C_6 -haloalquil)carbonila, (C_1 - C_6 -haloalcóxi) carbonila, (halo- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquil)carbonila, (C_3 - C_8 -halocicloalquil) carbonila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; ou $-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ ou $-CH_2NR^7R^8$, e

R^{3-B} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_8 -

haloalquila,

ou

b) R^{1-B} representa hidrogênio, C_1-C_8 -alquila, C_1-C_6 -alquilsulfinila, C_1-C_6 -alquilsulfonila, C_1-C_4 -alcóxi- C_1-C_4 -alquila, C_3-C_8 -cicloalquila; C_1-C_6 -haloalquila, C_1-C_4 -haloalquiltio, C_1-C_4 -haloalquilsulfinila, C_1-C_4 -haloalquilsulfonila, halo- C_1-C_4 -alcóxi- C_1-C_4 -alquila, C_3-C_8 -halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formil, formil- C_1-C_3 -alquila, (C_1-C_3 -alquila)carbonil- C_1-C_3 -alquila, (C_1-C_3 -alcóxi)carbonil- C_1-C_3 -alquila; halo-(C_1-C_3 -alquila)carbonil- C_1-C_3 -alquila, halo-(C_1-C_3 -alcóxi) carbonil- C_1-C_3 -alquila tendo em cada caso 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo;

(C_1-C_8 -alquil)carbonila, (C_1-C_8 -alcóxi)carbonila, (C_1-C_4 -alcóxi- C_1-C_4 -alquil)carbonila, (C_3-C_8 -cicloalquil)carbonil; (C_1-C_6 -haloalquil)carbonila, (C_1-C_6 -haloalcóxi)carbonila, (halo- C_1-C_4 -alcóxi- C_1-C_4 -alquil)carbonila, (C_3-C_8 -halocicloalquil)carbonila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; ou $-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ ou $-CH_2NR^7R^8$ e

R^{3-B} representa halogênio, C_1-C_8 -alquila, C_1-C_8 -haloalquila,

e

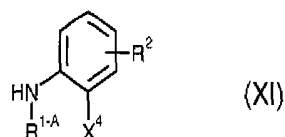
R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e R^8 são cada qual como definido acima, são novos e também fazem parte da matéria objeto deste pedido.

Os significados preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos de R^1 e R^3 aplicam-se correspondentemente a R^{1-B} e R^{3-B} , onde no caso a) R^{1-B} em cada caso não representa hidrogênio e no caso b) R^{3-B} não representa hidrogênio. Os significados preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos de R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e R^8 aplicam-se igualmente aos novos compostos da fórmula (III-b).

Ênfase é dada aos compostos da fórmula (III-b) em que R^1 e R^2 cada qual representa hidrogênio e R^3 representa flúor, cloro, metila, etila, trifluorometila e pentafluoroetila.

Os derivados de anilina da fórmula (III) em que L representa L-1 são também obtidos

g) reagindo haletos de anilina da fórmula (XI)

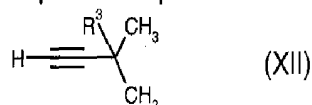


em que

R^{1-A} e R^2 são como acima definido e

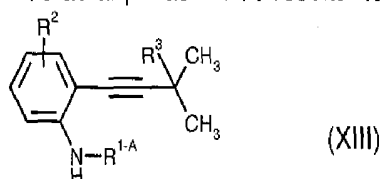
X^4 representa halogênio

em uma primeira etapa com alquinas da fórmula (XII)



5 em que R^3 é como definido acima

na presença de um catalisador, se apropriado na presença de uma base e se apropriado na presença de um diluente, e, em uma segunda etapa, hidrogenando as alquinaanilinas resultantes da fórmula (XIII)



em que R^{1-A} , R^2 e R^3 são como acima definidos,

10 se apropriado na presença de um diluente e se apropriado na presença de um catalisador.

A fórmula (XI) fornece uma definição geral dos haletos de anilina requeridos como materiais de partida para realizar o processo (g) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (XI), R^2 preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível tem aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos para este radical. R^{1-A} tem preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível aqueles significados que foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (IV) como sendo preferido, particularmente preferido e muito particularmente preferido, respectivamente, para este radical.

15

20

Os haletos de anilina da fórmula (XI) são conhecidos e/ou podem ser obtidos por processos conhecidos, por exemplo dos derivados cor-

respondentes que são não substituídos no nitrogênio por reação com os haletos da fórmula (IV).

A fórmula (XII) fornece uma definição geral das alquinas também requeridas como materiais de partida para realizar o processo (g) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (XII), R^3 preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível tem aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para este radical.

As alquinas da fórmula (XII) são conhecidas.

A fórmula (XIII) fornece uma definição geral das alquinaanilinas que são intermediários obtidos quando realizando o processo (g) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (XIII), R^2 e R^3 preferivelmente, particularmente preferível, e muito particularmente preferível, têm aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais. R^{1-A} tem preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível aqueles significados que foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (IV) como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para este radical.

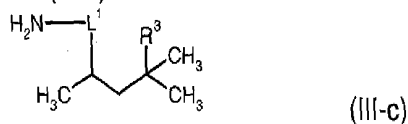
Algumas das alquinaanilinas da fórmula (XIII) são conhecidas.

Elas são obtidas pelo processo (g) de acordo com a invenção.

Se os derivados de anilina da fórmula (III) em que R^1 representa hidrogênio devem ser obtidos, R^{1-A} é escolhido de modo que ele atue como um grupo protetor que, após o processo (g) de acordo com a invenção, pode ser removido por métodos habituais.

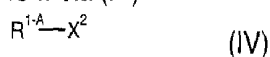
Os derivados de anilina da fórmula (III) em que L representa L-2, L-3 ou L-4 são conhecidos e/ou podem ser obtidos por processos conhecidos (conforme, por exemplo, EP-A 1.036.793 e EP-A 0 737 682).

Os derivados de anilina da fórmula (III) em que L representa L-2, L-3 ou L-4 e R¹ não representa hidrogênio podem ser obtidos reagindo-se as anilinas da fórmula (III-c)



em que

- 5 L¹ representa L-2, L-3 ou L-4 e
L-2, L-3, L-4 e R³ são como acima definidos
com haletos da fórmula (IV)

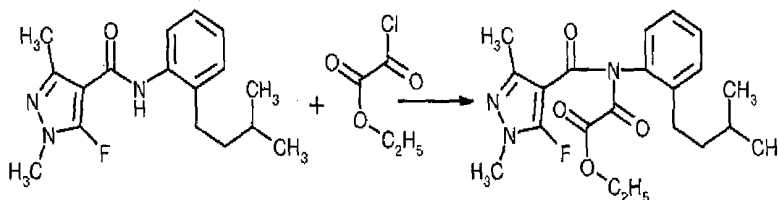


em que R^{1-A} e X² são como acima definidos

- na presença de uma base e na presença de um diluente. [As
10 condições de reação de processo (b) aplicam-se correspondentemente].

Processo (b)

- Empregando-se 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[2-(3-metilbutil)fenil]-1H-
pirazol-4-carboxamida e cloro(oxo)acetato de etila como materiais de parti-
da, o curso do processo (b) de acordo com a invenção pode ser ilustrado
15 pelo seguinte esquema de fórmula:



- A fórmula (I-a) fornece uma definição geral das isopentilcarboxanilidas requeridas como materiais de partida para realizar o processo (b) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (I-a), R², R³ e A preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles
20 significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferido, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais.

- As isopentilcarboxanilidas da fórmula (I-a) são também compos-
25 tos de acordo com a invenção e também fazem parte da matéria objeto des-

te pedido. Elas podem ser obtidas por um dos processos (a), (c), (d) ou (e) de acordo com a invenção (onde R^1 = hidrogênio).

A fórmula (IV) fornece uma definição geral dos haletos também requeridos como materiais de partida para realizar o processo (b) de acordo com a invenção.

R^{1-A} preferivelmente representa C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfinila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila; C_1 - C_4 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilsulfinila, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, halo- C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila, C_3 - C_6 -halocicloalquila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formila, formil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alquil)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila; halo-(C_1 - C_3 -alquil)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, halo-(C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila tendo em cada caso 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo;

(C_1 - C_6 -alquila)carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi)carbonila, (C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila)carbonila, (C_3 - C_6 -cicloalquila)carbonil; (C_1 - C_4 -haloalquil)carbonila, (C_1 - C_4 -haloalcóxi)carbonila, (halo- C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_3 -alquila)carbonila, (C_3 - C_6 -halocicloalquil)carbonila tendo em cada caso 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; ou $-C(=O)C(=O)R^4$, $-CONR^5R^6$ ou $-CH_2NR^7R^8$.

R^{1-A} particularmente preferível representa metila, etila, n- ou isopropila, n-, iso-, sec- ou terc-butila, pentila ou hexila, metilsulfinila, etilsulfinila, n- ou isopropilsulfinila, n-, iso-, sec- ou terc-butilsulfinila, metilsulfonila, etilsulfonila, n- ou isopropilsulfonila, n-, iso-, sec- ou terc-butilsulfonila, metoximetila, metoxietila, etoximetila, etoxietila, ciclopropila, ciclopentila, cicloexila, trifluorometila, triclorometila, trifluoroetila, difluorometiltio, difluoroclorometiltio, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinila, trifluorometilsulfonila, trifluorometoximetila; formila, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-$

$\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$;

metilcarbonila, etilcarbonila, n-propilcarbonila, isopropilcarbonila, terc-butilcarbonila, metoxicarbonila, etoxicarbonila, terc-butoxicarbonila, ciclopropilcarbonila; trifluorometilcarbonila, trifluorometoxicarbonila, ou

5 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ ou $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$.

R^{1-A} muito particularmente preferível representa metila, metoximetila, formila, $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-(\text{CH}_2)_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$.

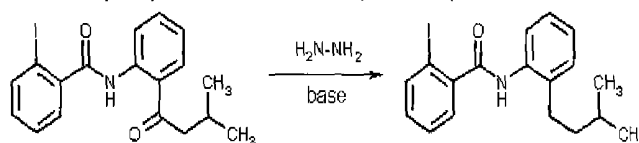
10 X^2 preferivelmente representa cloro ou bromo.

Os haletos da fórmula (IV) são conhecidos.

Processo (c)

Empregando-se 2-iodo-N-[2-(3-metilbutanoil)fenil]benzamida como material de partida, e hidrazina e uma base, o curso do processo (c) de

15 acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema de fórmula abaixo:



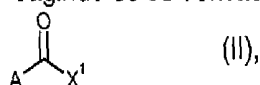
A fórmula (V) fornece uma definição geral dos derivados de isopentona requeridos como materiais de partida para realizar o processo (c) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (V), R^1 , R^2 , R^3 e A preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles

20 significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais.

Os derivados de isopentona da fórmula (V) são novos. Eles são

25 obtidos

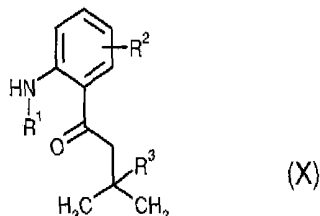
h) reagindo-se os derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)



em que

A é como definido acima

X^1 representa halogênio ou hidroxila
com alcanonaanilinas da fórmula (X)



em que R^1 , R^2 e R^3 são como acima definido,

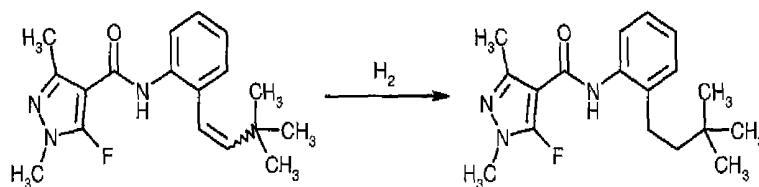
- se apropriado na presença de um catalisador, se apropriado na
5 presença de um agente de condensação, se apropriado na presença de um
aglutinante e se apropriado na presença de um diluente.

Os derivados de ácido carboxílico da fórmula (II) requeridos co-
mo materiais de partida para realizar o processo (h) de acordo com a inven-
ção já foram descritos em conexão com o processo (a) de acordo com a in-
venção.

As alcanonaanilinas da fórmula (X) também requeridas como
material de partida para realizar o processo (h) de acordo com a invenção já
foram descritos em conexão com o processo (f) de acordo com a invenção.

Processo (d)

- 15 Empregando-se N-{2-[3,3-dimetilbut-1-en-1-il]fenil}-5-fluoro-1,3-
dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida como material de partida e hidrogênio, o
curso do processo (d) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo es-
quema de fórmula abaixo:

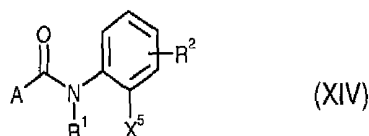


- A fórmula (VI) fornece uma definição geral dos derivados de iso-
20 penteno requeridos como materiais de partida para realizar o processo (d)
de acordo com a invenção. Nesta fórmula (VI), R^1 , R^2 , R^3 e A preferivelmen-
te, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles
significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos
compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos,

particularmente preferidos e muito particularmente preferidos para estes radicais.

Os derivados de isopenteno da fórmula (VI) são novos. Eles são obtidos

5 j) reagindo-se carboxamidas da fórmula (XIV)

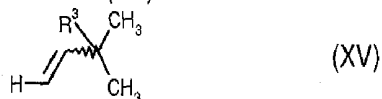


em que

R^1 , R^2 e A são como acima definido e

X^5 representa cloro, bromo, iodo ou $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$

com alcenos da fórmula (XV)



10 em que R^3 é como definido acima

na presença de um catalisador, se apropriado na presença de uma base e se apropriado na presença de um diluente.

A fórmula (XIV) fornece uma definição geral dos carboxamidas também requeridos como materiais de partida para realizar o processo (j) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (XIV), R^1 , R^2 e A preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para estes radicais. X^5 preferivelmente representa bromo ou $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$.

As carboxamidas da fórmula (XIV) são novas ou podem ser obtidas por métodos conhecidos (conforme WO 02/08195 e WO 02/08197).

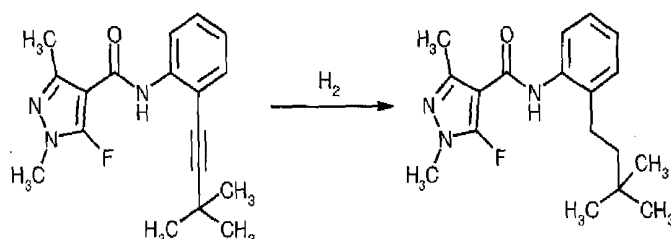
A fórmula (XV) fornece uma definição geral dos alcenos também requeridos como materiais de partida para realizar o processo (j) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (XV), R^3 preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível tem aqueles significados que já foram mencionados na descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo

com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos e muito particularmente preferidos, respectivamente, para este radical.

Os alcenos da fórmula (XV) são conhecidos.

Processo (e)

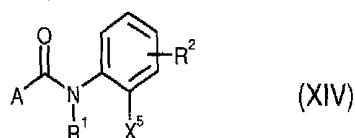
- 5 Empregando-se N-[2-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida como material de partida e hidrogênio, o curso do processo (e) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema de fórmula abaixo:



- A fórmula (VII) fornece uma definição geral dos derivados de isopentina requeridos como materiais de partida para realizar o processo (e) de acordo com a invenção. Nesta fórmula (VII), R^1 , R^2 , R^3 e A preferivelmente, particularmente preferível e muito particularmente preferível têm aqueles significados que já foram mencionados em conexão com a descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferido, particularmente preferido e muito particularmente preferido para estes radicais.

Os derivados de isopentina da fórmula (VII) em que A não representa A1 são novos. Os derivados de isopentina da fórmula (VII) são obtidos

- 20 k) reagindo-se carboxamidas da fórmula (XIV)

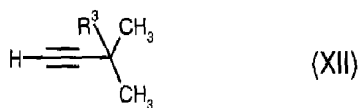


em que

R^1 , R^2 e A são como acima definido e

X^5 representa cloro, bromo, iodo ou $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$,

com as alquinas da fórmula (XII)



em que R^3 é como definido acima

na presença de um catalisador, se apropriado na presença de uma base e se apropriado na presença de um diluente.

As carboxamidas da fórmula (XIV) requeridas como materiais de partida para realizar o processo (k) de acordo com a invenção já foram escritos em conexão com o processo (j) de acordo com a invenção.

As alquinas da fórmula (XII) também requeridas como materiais de partida para realizar o processo (k) de acordo com a invenção já foram descritas em conexão com o processo (g) de acordo com a invenção.

10 Condições de Reação

Os diluentes adequados para realizar o processo (a) e (h) de acordo com a invenção são todos solventes orgânicos inertes. Estes preferivelmente incluem hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, cicloexano, metilcicloexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, di-clorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como éter de dietila, éter de diisopropila, éter de t-butila de metila, éter de t-amila de metila, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol, ou amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica.

Os processos (a) e (h) de acordo com a invenção são, se apropriado, realizados na presença de um aceptor de ácido adequado. Os aceptores de ácido adequados são todos bases orgânicas ou inorgânicas habituais. Estes preferivelmente incluem hidretos de metal de álcali ou metal alcalino terroso, hidróxidos, amidas, alcóxidos, acetatos, carbonatos ou bicarbonatos, tais como, por exemplo, hidreto de sódio, amida de sódio, metóxido de sódio, etóxido de sódio, terc-butóxido de potássio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de amônio, acetato de sódio, acetato de

potássio, acetato de cálcio, acetato de amônio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio ou carbonato e amônio, e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbenzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diazabicycloundeceno (DBU).

Os processos (a) e (h) de acordo com a invenção são, se apropriado, realizados na presença de um agente de condensação adequado. Os agentes de condensação são todos agentes de condensação habitualmente empregados para tais reações de amidação. Os formadores de haleto de ácido, tais como fosgeno, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, oxicleto de fósforo ou cloreto de tionila; formadores de anidrido, tais como cloroformiato de etila, metila, cloroformiato de isopropila, cloroformiato de isobutila ou cloreto metilsulfonila; carbodiimidas, tais como N,N'-dicicloexilcarbodiimida (DCC), ou outros agentes de condensação habituais, tais como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonil-1,2-diidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloreto de carbono ou hexafluorofosfato de bromotripirrolidino-fosfônio podem ser mencionados por meio de exemplo.

Os processos (a) e (h) de acordo com a invenção são, se apropriado, realizados na presença de um catalisador. Exemplos que podem ser mencionados são 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol ou dimetilformamida.

Quando realizando os processos (a) e (h) de acordo com a invenção, as temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma faixa relativamente ampla. Em geral, os processos são realizados em temperaturas de 0°C a 150°C, preferivelmente em temperaturas de 0°C a 80°C.

Para realizar o processo (a) de acordo com a invenção para preparar os compostos da fórmula (I), em geral de 0,2 a 5 mol, preferivelmente de 0,5 a 2 mol, de derivado de anilina da fórmula (III) são empregados por mol do derivado de ácido carboxílico da fórmula (II).

Para realizar o processo (h) de acordo com a invenção para preparar os compostos da fórmula (V), em geral de 0,2 a 5 mol, preferivelmente de 0,5 a 2 mol, de alcanonaanilina da A fórmula (X) são empregados por mol do derivado de ácido carboxílico da fórmula (II).

5 Diluentes adequados para realizar o processo (b) de acordo com a invenção são todos solventes orgânicos inertes. Estes preferivelmente incluem hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, cicloexano, metilcicloexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbonetos halogenados, tais
10 como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como éter de dietila, éter de diisopropila, éter de terc-butila de metila, éter de terc-amila de metila, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol, ou amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetila-
15 cetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica.

O processo (b) de acordo com a invenção é realizada na presença de uma base. As bases adequadas são todas bases inorgânicas ou orgânicas adequadas. Estes preferivelmente incluem hidretos de metal de
20 álcali e metal alcalino terroso, hidróxidos, amidas, alcóxidos, acetatos, carbonatos ou bicarbonatos, tais como, por exemplo, hidreto de sódio, amida de sódio, metóxido de sódio, etóxido de sódio, terc-butóxido de potássio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de amônio, acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio, acetato de amônio, carbonato
25 de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio ou carbonato de cério, e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbenzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diazabicycloundeceno
30 (DBU).

Quando realizando o processo (b) de acordo com a invenção, as temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma faixa relativa-

mente ampla. Em geral, O processo é realizado em temperaturas de 0°C a 150°C, preferivelmente em temperaturas de 20°C a 110°C.

Para realizar o processo (b) de acordo com a invenção para preparar os compostos da fórmula (I), em geral de 0,2 a 5 moles, preferivelmente de 0,5 a 2 moles, de haleto da fórmula (IV) são empregados por mol da isopentilcarboxanilida da fórmula (I-a).

Os diluentes adequados para realizar o processo (c) de acordo com a invenção e a segunda etapa do processo (f) são todos solventes orgânicos inertes. Estes preferivelmente incluem hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, cicloexano, metilcicloexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como éter de dietila, éter de diisopropila, éter de t-butila de metila, éter de t-amila de metila, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; cetonas, tais como acetona, butanona, cetona de isobutila de metila ou cicloexanona; nitrilos, tais como acetonitrila, propionitrila, n- ou i-butyronitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida de hexametilfosfórica; sulfóxidos, tais como sulfóxido de dimetila; sulfonas, tais como sulfolano; álcoois, tais como metanol, etanol, n- ou i-propanol, n-, i-, sec- ou terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, éter de monometila de dietileno glicol, éter de monoetila de dietileno glicol, trietileno glicol, misturas destes com água ou água pura.

O processo (c) de acordo com a invenção e a segunda etapa de processo (f) são realizados na presença de uma base. As bases preferidas são hidróxidos de metal de álcali ou metal alcalino terroso, tais como, por exemplo, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de amônio.

Quando realizando o processo (c) de acordo com a invenção e a segunda etapa de processo (f), as temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma faixa relativamente ampla. Em geral, as reações são realizadas em temperaturas de 100°C a 300°C, preferivelmente em temperatu-

ras de 150°C a 250°C.

Quando realizando o processo (c) de acordo com a invenção para preparar os compostos da fórmula (I), Em geral de 0,2 a 5 moles, preferivelmente de 0,5 a 3 mol, de hidrazina (ou hidrato de hidrazina) são empregados por mol do derivado de isopentona da fórmula (V).

Para realizar a segunda etapa de processo (f) para preparar os compostos dos derivados de anilina da fórmula (III), em geral de 0,2 a 5 mol, preferivelmente de 0,5 a 3 moles, de hidrazina (ou hidrato de hidrazina) são empregados por mol da alcanonaanilina da fórmula (X).

Os diluentes adequados para realizar os processos (d) e (e) de acordo com a invenção e a segunda etapa de processo (g) são todos solventes orgânicos inertes. Estes preferivelmente incluem hidrocarbonetos alifáticos ou alicíclicos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, cicloexano, metilcicloexano ou decalina; éteres, tais como éter de dietila, éter de diisopropila, éter de t-butila de metila, éter de t-amila de metila, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano ou 1,2-dietoxietano; álcoois, tais como metanol, etanol, n- ou isopropanol, n-, iso-, sec- ou terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, éter de monometila de dietileno glicol, éter de monoetila de dietileno glicol, misturas destes com água ou água pura.

Os processos (d) e (e) de acordo com a invenção e a segunda etapa de processo (g) são realizados na presença de um catalisador. Os catalisadores adequados são todos catalisadores que são usualmente empregados para hidrogenação. O seguinte pode ser mencionado por meio de exemplo: níquel Raney, paládio e platina, se apropriado sobre um suporte, tal como, por exemplo, carbono ativado.

Em vez disso, na presença de hidrogênio em combinação com um catalisador, a hidrogenação nos processos (d) e (e) de acordo com a invenção e na segunda etapa do processo (g) pode também ser realizada na presença de trietilsilano.

Quando realizando os processos (d) e (e) de acordo com a invenção e a segunda etapa de processo (g), as temperaturas de reação po-

dem ser variadas dentro de uma faixa relativamente ampla. Em geral, as reações são realizadas em temperaturas de 0°C a 150°C, preferivelmente em temperaturas de 20°C a 100°C.

Os processos (d) e (e) de acordo com a invenção e a segunda
5 etapa de processo (g) são realizados sob um pressão de hidrogênio entre 0,05 e 20 mPa (0,5 e 200 bar), preferivelmente entre 0,2 e 5 mPa (2 e 50 bar), particularmente preferível entre 0,3 e 1 mPa (3 e 10 bar).

Os diluentes adequados para realizar a primeira etapa do processo (f) são todos solventes orgânicos inertes. Estes preferivelmente inclu-
10 em hidrocarbonetos alifáticos ou alicíclicos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, cicloexano, metilcicloexano ou decalina; éteres, tais como éter de dietila, éter de diisopropila, éter de t-butila de metila, éter de t-amila de metila, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano ou 1,2-dietoxietano.

15 Quando realizando a primeira etapa de processo (f), as temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma faixa relativamente ampla. Em geral, a reação é realizada em temperaturas de 0°C a 200°C, preferivelmente em temperaturas de 20°C a 150°C.

Para realizar a primeira etapa de processo (f) para preparar os
20 compostos das alcanonaanilinas da fórmula (X), Em geral de 0,2 a 5 moles, preferivelmente de 0,5 a 3 moles, de reagente Grignard da fórmula (IX) são empregados por mol da cianoanilina da fórmula (VIII).

Os diluentes adequados para realizar a primeira etapa de processo (g) e os processos (j) e (k) de acordo com a invenção são todos sol-
25 ventes orgânicos. Estes preferivelmente incluem nitrilos, tais como acetoni-trila, propionitrila, n- ou i-butironitrila ou benzonitrila, ou amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; éteres, tais como éter de dietila, éter de diisopropila, éter de t-butila de metila, éter de t-amila de metila, dioxano,
30 tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano ou 1,2-dietoxietano.

A primeira etapa de processo (g) e os processos (j) e (k) de acordo com a invenção são, se apropriado, realizados na presença de um

aceptor de ácido adequado. Os aceptores de ácido adequados são todos bases inorgânicas ou orgânicas habituais. Estes preferivelmente incluem hidretos de metal de álcali ou metal alcalino-terroso, hidróxidos, amidas, alcóxidos, acetatos, carbonatos ou bicarbonatos, tais como, por exemplo, hidreto de sódio, amida de sódio, metóxido de sódio, etóxido de sódio, terc-butóxido de potássio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, hidróxido de amônio, acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio, acetato de amônio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio ou carbonato de amônio, e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbenzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diazabicycloundeceno (DBU).

A primeira etapa de processo (g) e os processos (j) e (k) de acordo com a invenção são realizados na presença de um ou mais catalisadores.

Os catalisadores adequados são em particular complexos ou sais de paládio. Adequados para este propósito são, preferivelmente, cloreto de paládio, acetato de paládio, tetrakis(trifenilfosfina)paládio ou dicloreto de bis(trifenilfosfina)paládio. É também possível gerar um complexo de paládio em uma mistura de reação adicionando-se um sal de paládio e um ligando complexo separadamente à reação.

Os ligandos adequados são, preferivelmente, compostos de organofósforo. Os seguintes podem ser mencionados por meio de exemplo: trifenilfosfina, tri-*o*-tolilfosfina, 2,2'-bis(difenilfosfina)-1,1'-binaftila, dicicloexilfosfinabifenila, 1,4-bis(difenilfosfina)butano, bisdifenilfosfinoferroceno, di(terc-butilfosfina)bifenila, di(cicloexilfosfina)bifenila, 2-dicicloexilfosfina-2'-N,N-dimetilaminobifenila, tricicloexilfosfina, tri-terc.-butilfosfina. Entretanto, os ligandos podem também ser dispensados com.

A primeira etapa de processo (g) e os processos (j) e (k) de acordo com a invenção são também, se apropriado, realizados na presença de um outro sal de metal, tal como sais de cobre, por exemplo iodeto de co-

bre(l).

Quando realizando a primeira etapa de processo (g) e os processos (j) e (k) de acordo com a invenção, as temperaturas de reação podem ser variadas dentro de uma faixa relativamente ampla. Em geral, as reações são realizadas em temperaturas de 20°C a 180°C, preferivelmente em temperaturas de 50°C a 150°C.

Para realizar a primeira etapa de processo (g) para preparar os derivados de anilina da fórmula (III), em geral de 1 a 5 moles, preferivelmente de 1 a 3 moles, de alquina da fórmula (XII) são empregados por mol do haleto de anilina da fórmula (XI).

Para realizar o processo (j) de acordo com a invenção para preparar os derivados de isopenteno da fórmula (VI), em geral de 1 a 5 moles, preferivelmente de 1 a 3 moles, de alceno da fórmula (XV) são empregados por mol da carboxamida da fórmula (XIV).

Para realizar o processo (k) de acordo com a invenção para preparar os derivados de isopentina da fórmula (VII), em geral de 1 a 5 moles, preferivelmente de 1 a 3 moles, de alquina da fórmula (XII) são empregados por mol da carboxamida da fórmula (XIV).

A menos que de outro modo estabelecido, todos os processos de acordo com a invenção são geralmente realizados sob pressão atmosférica. Entretanto, é também possível operar sob pressão elevada ou reduzida - Em geral entre 0,01 e 1 mPa (0,1 bar e 10 bar).

As substâncias de acordo com a invenção têm potente atividade microbiana e podem ser empregadas para controlar microorganismos indesejados, tais como fungos e bactérias, em proteção de colheita e na proteção de materiais.

Fungicidas podem ser empregados em proteção de colheita para controlar Plasmodioforomicetos, Oomicetos, Quitridiomicetos, Zigomicetos, Ascomicetos, Basidiomicetos e Deuteromicetos.

Bactericidas podem ser empregados em proteção de colheita para controlar *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* e *Streptomycetaceae*.

Alguns patógenos que causam doenças fúngicas e bacterianas que vêm sob os nomes genéricos listados acima podem ser mencionados como exemplos, porém não por meio de limitação:

- Espécie *Xanthomonas*, tal como, por exemplo, *Xanthomonas campestris* pv.
- 5 *oryzae*;
- Espécie *Pseudomonas*, tal como, por exemplo, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- Espécie *Erwinia*, tal como, por exemplo, *Erwinia amylovora*;
- Espécie *Pythium*, tal como, por exemplo, *Pythium ultimum*;
- 10 Espécie *Phytophthora*, tal como, por exemplo, *Phytophthora infestans*;
- Espécies *Pseudoperonospora*, tais como, por exemplo, *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*;
- Espécie *Plasmopara*, tal como, por exemplo, *Plasmopara viticola*;
- Espécie *Bremia*, tal como, por exemplo, *Bremia lactucae*;
- 15 Espécies *Peronospora*, tais como, por exemplo, *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*;
- Espécie *Erysiphe*, tal como, por exemplo, *Erysiphe graminis*;
- Espécie *Sphaerotheca*, tal como, por exemplo, *Sphaerotheca fuliginea*;
- Espécies *Podosphaera*, tais como, por exemplo, *Podosphaera leucotricha*;
- 20 Espécie *Venturia* species, tal como, por exemplo, *Venturia inaequalis*;
- Espécies *Pyrenophora*, tais como, por exemplo, *Pyrenophora teres* ou *P. graminea*
- (forma conídia: *Drechslera*, sin: *Helminthosporium*);
- Espécie *Cochliobolus*, tais como, por exemplo, *Cochliobolus sativus*.
- 25 (forma conídia: *Drechslera*, sin: *Helminthosporium*);
- Espécie *Uromyces*, tal como, por exemplo, *Uromyces appendiculatus*;
- Espécie *Puccinia*, tal como, por exemplo, *Puccinia recondita*;
- Espécie *Sclerotinia*, tal como, por exemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*;
- Espécie *Tilletia*, tal como, por exemplo, *Tilletia caries*;
- 30 Espécies *Ustilago*, tais como, por exemplo, *Ustilago nuda* ou *Ustilago avenae*;
- Espécie *Pellicularia*, tal como, por exemplo, *Pellicularia sasakii*;

Espécie *Pyricularia*, tal como, por exemplo, *Pyricularia oryzae*;

Espécie *Fusarium*, tal como, por exemplo, *Fusarium culmorum*;

Espécie *Botrytis*, tal como, por exemplo, *Botrytis cinerea*;

Espécie *Septoria*, tal como, por exemplo, *Septoria nodorum*;

- 5 Espécie *Leptosphaeria*, tal como, por exemplo, *Leptosphaeria nodorum*;

Cercospora species, tal como, por exemplo, *Cercospora canescens*;

Alternaria species, tal como, por exemplo, *Alternaria brassicae*; e

Espécie *Pseudocercospora*, tal como, por exemplo, *Pseudocercospora herpotrichoides*,

- 10 Espécie *Rhizoctonia*, tal como, por exemplo, *Rhizoctonia solani*.

Os compostos ativos de acordo com a invenção também mostram uma forte ação fortalecedora em plantas. Conseqüentemente, eles são adequados para mobilizar as defesas internas da planta contra o ataque por microorganismos indesejados.

- 15 No presente contexto, os compostos fortalecedores de planta (indutores de resistência) devem ser entendidos como significando substâncias que são capazes de estimular o sistema de defesa de plantas tal que, quando as plantas tratadas sejam subseqüentemente inoculadas com microorganismos indesejados, eles exibem substancial resistência a estes microorganismos.
- 20

No presente caso, microorganismos indesejados devem ser entendidos como significando fungos, bactérias e viroses fitopatogênicos. Os compostos de acordo com a invenção podem desse modo ser empregados para proteger plantas dentro de um certo período de tempo após o tratamento contra o ataque pelos patógenos mencionados. O período de tempo para o qual esta proteção é obtida geralmente estende-se durante 1 a 10 dias, preferivelmente 1 a 7 dias, a partir do tratamento das plantas com os compostos ativos.

25

- O fato de que os compostos ativos são bem tolerados pelas plantas nas concentrações requeridas para controlar doenças de planta, permite o tratamento de partes de plantas acima do chão, de cepa em propagação e sementes, e do solo.
- 30

Aqui, os compostos ativos de acordo com a invenção podem ser empregados com particularmente bons resultados para controlar doenças de cereal, tais como, por exemplo, contra espécies *Puccinia*, e de doenças em viticultura e no cultivo de frutos e vegetais, tais como, por exemplo, contra espécies *botrytis*, *Venturia* ou *Alternaria*.

Os compostos ativos de acordo com a invenção são também adequados para aumentar a produção de colheitas. Além disso, eles mostram toxicidade reduzida e são bem tolerados pelas plantas.

Se apropriado, os compostos ativos de acordo com a invenção podem, em certas concentrações e taxas de aplicação, ser também empregados como herbicidas, para regular o crescimento de planta e para controlar pestes animais. Se apropriado, eles podem também ser empregados como intermediários ou precursores na síntese de outros compostos ativos.

De acordo com a invenção, é possível tratar todas as plantas e partes de plantas. Plantas devem ser entendidas aqui como significando todas as plantas e populações de planta, tal como plantas silvestres ou plantas de colheitas desejadas e indesejadas (incluindo plantas de colheita de ocorrência natural). As plantas de colheita podem ser plantas que podem ser obtidas por reprodução convencional e métodos de otimização ou por métodos biotecnológicos e engenharia genética ou combinações destes métodos, incluindo as plantas transgênicas e incluindo espécies que podem ou não ser protegidas por certificados de cultivadores de planta. Partes de plantas deve-se entender como significando todas as partes acima do chão e abaixo do chão e órgãos de plantas, tal como broto, folha, flor e raiz, exemplos que podem ser mencionados sendo folhas, espinhos, caules, troncos, flores, corpos de fruto, frutos e sementes e também raízes, tubérculos e Rizomas. Partes de plantas também incluem material colhido e material de propagação vegetativa e geradora, por exemplo plantinhas, tubérculos, rizomas, mudas e sementes.

O tratamento das plantas e partes de plantas de acordo com a invenção com os compostos ativos é realizado diretamente ou pela ação sobre seu ambiente, *habitat* ou área de armazenagem de acordo com os

métodos de tratamento habituais, por exemplo por mergulho, vaporização, evaporação, atomização, disseminação, escovação-sobre e, no caso de material de propagação, em particular no caso de sementes, também por revestimento de uma ou múltiplas camadas.

- 5 Na proteção de materiais, os compostos de acordo com a invenção podem ser empregados para proteger materiais industriais de contra infecção com, e destruição por, microorganismos indesejados.

Os materiais industriais no presente contexto são entendidos como significando materiais não vivos que foram preparados para uso em indústria. Por exemplo, materiais industriais que são destinados a serem protegidos pelos compostos ativos de acordo com a invenção de mudança e destruição microbiana podem ser espessantes, colas, papel e papelão, têxteis, couro, madeira, tinturas e artigos plásticos, lubrificantes de resfriamento e outros materiais que podem ser infectados com, ou destruídos por, micro-
 10 organismos. Partes de plantas de produção, por exemplo, circuitos de água-resfriamento, que podem ser prejudicados pela proliferação de microorganismos podem também ser mencionadas dentro do escopo dos materiais a serem protegidos. Materiais industriais que podem ser mencionados dentro do escopo da presente invenção são preferivelmente espessantes, colas,
 15 papel e papelão, couro, madeira, tinturas, lubrificantes de resfriamento e líquidos de transferência de calor, particularmente preferível madeira.

Os microorganismos capazes de degradarem ou alterarem os materiais industriais que podem ser mencionados são, por exemplo, bactérias, fungos, leveduras, algas e organismos de lodo. Os compostos ativos de
 25 acordo com a invenção preferivelmente agem contra fungos, em particular mofo, fungos descolorantes de madeira e destruidores de madeira (Basidiomicetos) e contra organismos de lodo e algas.

Microorganismos dos seguintes gêneros podem ser mencionados como exemplos:

- 30 *Alternaria*, tal como *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, tal como *Aspergillus niger*,
Chaetomium, tal como *Chaetomium globosum*,

- Coniophora*, tal como *Coniophora puetana*,
Lentinus, tal como *Lentinus tigrinus*,
Penicillium, tal como *Penicillium glaucum*,
Polyporus, tal como *Polyporus versicolor*,
5 *Aureobasidium*, tal como *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, tal como *Sclerophoma pityophila*,
Trichoderma, tal como *Trichoderma viride*,
Escherichia, tal como *Escherichia coli*,
Pseudomonas, tal como *Pseudomonas aeruginosa*, e
10 *Staphylococcus*, tal como *Staphylococcus aureus*.

Dependendo de suas propriedades físicas e químicas particulares, os compostos ativos podem ser convertidos nas formulações habituais, tais como soluções, emulsões, suspensões, pós, espumas, pastas, grânulos, aerossóis e microencapsulações em substâncias poliméricas e em
15 composições de revestimento para sementes, e formulações de velação por resfriamento e aquecimento ULV.

Estas formulações são produzidas de uma maneira conhecida, por exemplo, misturando-se os compostos ativos com extensores, isto é, solventes líquidos, gases liquefeitos sob pressão, e/ou veículos sólidos, op-
20 cionalmente com o uso de tensoativos, isto é, emulsificantes e/ou dispersantes, e/ou formadores de espuma. Se o extensor empregado for água, é também possível empregar, por exemplo, solventes orgânicos como solventes auxiliares. Essencialmente, solventes líquidos adequados são: aromáticos tal como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, hidrocarbonetos aromáticos clo-
25 rinados ou alifáticos clorinados tal como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno, hidrocarbonetos alifáticos tal como cicloexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, álcoois tal como butanol ou glicol e seus éteres e ésteres, cetonas tal como acetona, cetona metil etila, cetona de metil isobutila ou ciclohexanona, solventes fortemente polares tal como
30 dimetilformamida ou sulfóxido de dimetila, ou senão água. Os extensores gasosos liquefeitos ou veículos devem ser entendidos como significando líquidos que são gasosos em temperatura padrão e sob pressão atmosféri-

ca, por exemplo propelentes aerossóis tal como hidrocarbonetos halogenados, ou ainda butano, propano, nitrogênio e dióxido de carbono. Os veículos sólidos adequados são: por exemplo minerais naturais moídos tal como caulins, argilas, talco, giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terra diatomácea, e minerais sintéticos moídos tais como sílica finamente dividida, alumina e silicatos. Veículos sólidos adequados para grânulos são: por exemplo rochas naturais esmagadas e fracionadas tal como calcita, mármore, pedrapomes, sepiolita e dolomita, ou também grânulos sintéticos de farinha inorgânica e orgânica, e grânulos de material orgânico tal como serragem, cascas de coco, sabugo de milho e pedúnculos de tabaco. Emulsificantes e/ou formadores de espuma adequados são: por exemplo, emulsificantes não-iônicos e aniônicos, tal como ésteres de ácido graxo de polioxietileno, éteres de álcool graxo de polioxietileno, por exemplo, éteres de poliglicol de alquila-
10 rila, alquilsulfonatos, sulfatos de alquila, arilsulfonatos, ou então hidrolisados de proteína. Os dispersantes adequados são: por exemplo, líquidos de ex-
15 creção de lignossulfito e metilcelulose.

Os espessantes tais como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos na forma de pós, grânulos ou treliças, tal como goma arábica, álcool de polivinila e acetato de polivinila, ou ainda fosfolipídeos naturais
20 tais como cefalinas e lecitinas e fosfolipídeos sintéticos podem ser empregados nas formulações. Outros aditivos possíveis são óleos minerais e vegetais.

É possível empregar colorantes tais como pigmentos inorgânicos, por exemplo óxido de ferro, óxido de titânio e Azul Prussiano, e matérias corantes orgânicas tal como matérias corantes de alizarina, matérias corantes azo e matérias corantes de ftalocianina de metal, e nutrientes de traço tal como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdeno e zinco.
25

As formulações geralmente compreendem entre 0,1 e 95 por cento em peso de composto ativo, preferivelmente entre 0,5 e 90%.
30

Os compostos ativos de acordo com a invenção podem, como tal ou em suas formulações, também serem empregadas em uma mistura

- com conhecidos fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematicidas ou insecticidas, para ampliar, por exemplo, o espectro de atividade ou para prevenir o desenvolvimento de resistência. Em muitos casos, efeitos sinérgicos são obtidos, isto é, a atividade da mistura é maior do que a atividade dos componentes individuais.

Componentes de mistura adequados são, por exemplo, os seguintes compostos:

Fungicidas:

- 2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; acibenzolar-S-metila;
 10 aldimorf; amidoflomet; ampropilfos; ampropilfos-potássio; andoprim; anilazina; azaconazol; azoxistrobina; benalaxil; benodanil; benomil; bentiavalicarb-isopropila; benzamacril; benzamacril-isobutyla; bilanafos; binapacril; bifenil; bitertanol; blasticidin-S; bromuconazol; bupirimate; butiobato; butilamina; polisulfeto de cálcio; capsimicina; captafol; captana; carbendazim; carboxina;
 15 na; carpropamid; carvona; quinometionat; clobentiazona; clorfenazol; cloroneb; clorotalonil; clozolinato; clozilacon; ciazofamid; ciflufenamid; cimoxanila; ciproconazol; ciprodinila; ciprofuram; Dagger G; debacarb; diclofluanid; diclona; diclorofen; diclocimet; diclomezina; dicloran; dietofencarb; difenconazol; diflumetorim; dimetirimol; dimetomorf; dimoxistrobina; diniconazol;
 20 diniconazol-M; dinocap; difenilamina; dipiritiona; ditalimfos; ditianon; dodina; drazoxolon; edifenfos; epoxiconazol; etaboxam; etirimol; etridiazol; famoxadona; fenamidona; fenapanil; fenarimol; fenbuconazol; fenfuram; fenhexamid; fenitropan; fenoxanil; fenciclonil; fenpropidin; fenpropimorf; ferbam; fluzinam; flubenzimina; fludioxonil; flumetover; flumorph; fluoromida; fluoxastrobin;
 25 fluquinconazol; flurprimidol; flusilazol; flusulfamida; flutolanil; flutriafol; folpet; fosetyl-Al; fosetyl-sódio; fuberidazol; furalaxila; furametpir; furcarbanil; furmeciclox; guazatina; hexaclorobenzeno; hexaconazol; himexazol; imazalil; imibenconazol; triacetato de iminoctadina; tris(albesil) de iminoctadina; iodicarb; ipconazol; iprobenfos; iprodiona; iprovalicarb; irumamicina; isoprotiolo;
 30 no; isovalediona; casugamicina; cresoxim-metila; mancozeb; maneb; mefenimzina; mepanipirim; mepronila; metalaxila; metalaxil-M; metconazol; metasulfocarb; metfuroxam; metiram; metominostrobina; metsulfovax; mildiomi-

- cina; miclobutanila; miclozolina; natamicina; nicobifen; nitrotal-isopropila; noviflumuron; nuarimol; ofurace; orisastrobina; oxadixila; ácido oxolínico; oxpoconazol; oxicarboxina; oxifentiina; paclobutrazol; pefurazoato; penconazol; pencicuron; fosdifeno; ftaletol; picoxistrobina; piperalina; polioxinas; polioxirim; probenazol; prochloraz; procimidona; propamocarb; propanosina-sódio; propiconazol; propineb; proquinazid; protioconazol; piraclostrobina; pirazofos; pirifenox; pirimetanila; piroquilon; piroxifur; pirrolenitrina; quinconazol; quinoxifeno; quintozeno; simeconazol; spiroxamina; enxofre; tebucanazol; tecloftalam; tecnazeno; tetciclacis; tetraconazol; tiabendazol; ticlofeno; 10 tifulzamida; tiofanato-metila; thiram; tioximid; tolclófos-metila; tollfluand; triadimefon; triadimenol; triazbutil; triazóxido; triciclamida; triciclazol; tridemorf; trifloxistrobina; triflumizol; triforina; triticonazol; uniconazol; validamicina A; vinclozolina; zineb; ziram; zoxamida; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida; 1- 15 (1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina; 2-amino-4-metil-N-fenil-5-thiazolecarboxamida; 2-cloro-N-(2,3-diidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridinecarboxamida; 3,4,5-tricloro-2,6-piridinadicarbonitrilo; actinovato; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol; 1-(2,3-diidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metila; carbonato de monopotássio; N-(6-metóxi-3-piridinil)- 20 ciclopropanocarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaespíro[4,5] decano-3-amina; tetratiocarbonato de sódio; e sais de cobre e preparações, tais como mistura Bordeaux; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclóreto de cobre; sulfato de cobre; cufraneb; óxido de cobre; mancobre; oxina-cobre.

25 **Bactericidas:**

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, casugamicina, octilina, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

30 **Inseticidas / acaricidas / nematocidas:**

abamectina, ABG-9008, acefato, acequinocila, acetamiprida, acetoprol, acrinatrina, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, alanicarb, aldicarb,

aldoxycarb, aletrinas, isômeros 1R de aletrina, alfa-cipermetrina (alfametri-
na), amidoflumet, aminocarb, amitraz, avermectina, AZ-60541, azadiractina,
azametifos, azinfos-metila, azinfos-etila, azociclotina, *Bacillus popilliae*, *Ba-
cillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis* *Bacillus thuringien-*
5 *sis*, linhagem EG-2348, *Bacillus thuringiensis* linhagem GC-91, *Bacillus thu-*
ringiensis linhagem NCTC-11821, baculoviroses, *Beauveria bassiana*, *Beau-*
veria tenella, *benclothiaz*, *bendiocarb*, *benfuracarb*, *bensultap*, benzoximato,
beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bifenazato, bifentrina, binapacril, bioale-
trina, bioaletrin-S-ciclopentil-isômero, bioetanometrino, biopermetrina, bio-
10 resmetrina, bistrifluron, BPMC, brofenprox, bromophos-etila, bromopropilato,
bromfenvinfos (-metila), BTG-504, BTG-505, bufencarb, buprofezina, butati-
ofos, butocarboxim, butoxicarboxim, butilpiridaben, cadusafos, camfeclor,
carbarila, carbofurano, carbofenotion, carbosulfan, cartap, CGA-50439, qui-
nometionat, clordano, clordimeform, cloetocarb, cloretoxifos, clorfenapir,
15 clorfenvinfos, clorfluazuron, clormefos, clorobenzilato, cloropicrina, clorproxi-
feno, clorpirifos-metila, clorpirifos (-etila), clovaportrina, cromafenozida, cis-
cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrinas, cloetocarb, clofente-
zina, clotianidina, clotiazoben, codlemona, cumafos, cianofenfos, cianofos,
ciclopreno, cicloprotrins, *Cydia pomonella*, ciflutrina, cihalotrino, cihexatina,
20 cipermetrina, cifenotrino (1R-trans-isômero), ciromazina, DDT, deltametrino,
demeton-S-metila, demeton-S-metilsulfona, diafentiuron, dialifos, diazinon,
diclofentiona, diclorvos, dicofol, dicrotofos, diciclanila, diflubenzuron, dimeflu-
trino, dimetoato, dimetilvinfos, dinobuton, dinocap, dinotefurano, diofenolan,
disulfoton, docusat-sódio, dofenapin, DOWCO-439, eflusilanato, emamecti-
25 na, emamectin-benzoato, empentrino (1R-isômero), endosulfan, Entomopto-
ra spp., EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etiprol, etion, etoprofthos, etofen-
prox, etoxazol, etrimfos, famphur, fenamifos, fenazaquin, óxido de fenbutati-
na, fenflutrina, fenitrotrino, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxicarb,
fenpropatrino, fenpirad, fenpiritrino fenpiroximato, fensulfotion, fention, fentri-
30 fanila, fenvalerato, fipronila, flonicamid, fluacripirim, fluazuron, flubenzimino,
flubrocitrinato, flucicloخور, flucitrinato, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox,
flumetrins, flupirazofos, flutenzina (flufenzina), fluvalinato, fonofos, formeta-

nato, formotion, fosmetilan, fostiazato, fubfenprox (fluproxifeno), furatiocarb, gama-cihalotrina, gama-HCH, gossyplure, grandlure, viroses de granulose, halfenprox, halofenozida, HCH, HCN-801, heptenofos, hexaflumuron, hexiti-
 5 azox, hidrametilnona, hidropreno, IKA-2002, imidacloprida, imiprotrina, indo-
 xacarb, iodofenfos, iprobenfos, isazofos, isofenfos, isoprocarb, isoxation, ivermectina, japonilure, cadertrina, viroses de polihedrose nuclear, cinopreno, lambda-cihalotrina, lindano, lufenuron, malation, mecarbam, mesulfenfos, metaldeído, metam-sódio, metacrifos, metamidofos, *Metharhizium anisoplia-*
e, *Metharhizium flavoviride*, metidação, metiocarb, metomila metopreno, me-
 10 toxiclor, metoxifenoazida, metoflutrina, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, milbemectina, milbemicina, MKI-245, MON-45700, monocrotofos, moxidecti-
 na, MTI-800, naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, niclosami-
 da, nicotina, nitenpiram, nitiazina, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-
 9768, novaluron, noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-
 15 9701, OK-9802, ometoato, oxamila, oxidemeton-metila, *Paecilomyces fumo-*
soroseus, *paration-metila*, paration (-etil), permetrina (cis-, trans-), petróleo, PH-6045, fenotrina (isômero 1R-trans), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, piperonila butóxido, pirimicarb, pirimifos-metila, pirimifos-etila, oleato de potássio, praletrina, profenofos, proflutrin, prome-
 20 carb, propaphos, propargita, propetamfos, propoxur, protiofos, protoato, pro-
 trifenbuto, pimetozina, piraclofos, piresmetrina, piretrum, piridaben, piridali-
 la, piridafention, piridation, pirimidifeno, piriproxifeno, quinalfos, resmetrina, RH-5849, ribavirina, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, salition, sebufos, SI-0009, silafluofen, spinosad, espiroclorfen, espiromesifeno, sulfluramid,
 25 sulfotep, sulprofos, SZI-121, tau-fluvalinato, tebufenozida, tebufenpirad, te-
 bupirimfos, teflubenzuron, teflutrina, temefos, temivinfos, terbam, terbufos, tetraclorvinfos, tetradifon, tetrametrina, tetrametrina (1R-isômero), tetrasul, teta-cipermetrina, tiacloprid, tiametoxam, tiapronila, tiatrifos, hidrogenoxalato de tiociclam, tiodicarb, tiofanox, tiometon, tiosultap-sódio, turingiensina, tol-
 30 fenpirad, tralocitrina, tralometrina, transflutrina, triaratenos, triazamato, triazo-
 fos, triazuron, triclofenidina, triclorfon, *Trichoderma atroviride*, triflumuron, trimetacarb, vamidotion, vaniliprol, verbutina, *Verticillium lecanii*, WL-108477,

WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, xililcarb, ZA-3274, zeta-cipermetrina, zolapros, ZXI-8901, o composto propilcarbamato de 3-metilfenila (tsumacida Z), o composto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoroetil)-8-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carbonitrila (CAS-Reg. n° 185982-80-3) e o correspondente 3-endo-isômero (CAS-Reg. n° 185984-60-5) (conforme WO-96/37494, WO-98/25923), e as preparações que compreendem extratos de planta inseticidamente ativos, nematódeos, fungos ou viroses.

Uma mistura com outros compostos ativos conhecidos, tal como herbicidas, ou com fertilizantes e reguladores de crescimento, protetores e/ou semioquímicas é também possível.

Além disso, os compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção também têm atividade antimicótica muito boa. Eles têm um espectro muito amplo de atividade antimicótica em particular contra dermatófitos e leveduras mofos e fungos difásicos (por exemplo, contra a espécie *Candida* tal como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) e *Epidermophyton floccosum*, espécie *Aspergillus* tal como *Aspergillus niger* e *Aspergillus fumigatus*, espécie *Trichophyton* tal como *Trichophyton mentagrophytes*, espécie *Microsporon* tal como *Microsporon canis* e *audouinii*. A lista destes fungos de modo algum limita o espectro micótico que pode ser abrangido, porém é apenas para ilustração.

Os compostos ativos podem ser empregados como tal, na forma de suas formulações ou as formas de uso preparadas delas, tal como soluções prontas-para-uso, suspensões, pós umectáveis, pastas, pós solúveis, polvilhos e grânulos. A aplicação é realizada de uma maneira habitual, por exemplo, banho, vaporização, atomização, disseminação, empoeiramento, espumação, dispersão, etc. É também possível aplicar os compostos ativos pelo métodos de volume ultrabaixo, ou injetar a preparação de composto ativo ou o próprio composto ativo no solo. É também possível tratar as sementes das plantas.

Quando empregando-se os compostos ativos de acordo com a invenção como fungicidas, as taxas de aplicação podem ser variadas dentro de uma faixa relativamente ampla, dependendo do tipo de aplicação. Para o

tratamento de partes de plantas, as taxas de aplicação do composto ativo são geralmente entre 0,1 e 10.000 g/ha, preferivelmente entre 10 e 1000 g/ha. Para adubar semente, as taxas de aplicação de composto ativo são geralmente entre 0,001 e 50 g por quilograma de semente, preferivelmente entre 0,01 e 10 g por quilograma de semente. Para o tratamento do solo, as taxas de aplicação do composto ativo são geralmente entre 0,1 e 10.000 g/ha, preferivelmente entre 1 e 5.000 g/ha.

Como já mencionado acima, é possível possibilitar tratar todas as plantas e suas partes de acordo com a invenção. Em uma modalidade preferida, as espécies de planta Silvestre e espécies de planta, ou aquelas obtidas por reprodução biológica convencional, tal como cruzamento ou fusão de protoplasto, e partes destes, são tratadas. Em uma outra modalidade preferida, as plantas transgênicas e espécies de planta obtidas por engenharia genética, se apropriado em combinação com métodos convencionais (Organismos Geneticamente Modificados), e partes destas, são tratadas. O termo "partes" ou "partes de plantas" ou "partes de planta" foram explicados acima.

Particularmente preferível, plantas das espécies de planta que são em cada caso comercialmente disponíveis ou em uso são tratadas de acordo com a invenção. Espécies de planta devem ser entendidas como significando plantas tendo novas propriedades ("características") e que foram obtidas por reprodução convencional, por mutagênese ou por técnicas de DNA recombinantes. Elas podem ser espécies, variedades, bio- ou genótipos.

Dependendo da variedade de planta ou da espécie de planta, sua localização e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, dieta), o tratamento de acordo com a invenção pode também resultar em efeitos superaditivos ("sinérgicos"). Desse modo, por exemplo, as taxas de aplicação reduzidas e/ou uma ampliação do espectro de atividade e/ou um aumento na atividade das substâncias e composições que podem ser empregadas de acordo com a invenção, melhor crescimento da planta, tolerância aumentada a temperaturas elevadas ou baixas, tolerância aumentada

à estiagem ou à água ou teor de sal do solo, desempenho de floração aumentado, colheita mais fácil, maturação acelerada, produções de colheita maiores, melhor qualidade e/ou um valor nutricional maior dos produtos colhidos, melhor estabilidade em estocagem e/ou processabilidade dos produtos colhidos são possíveis, as quais excedem os efeitos que devem realmente ser esperados.

As plantas transgênicas ou espécies de planta (isto é, aquelas obtidas por engenharia genética) que devem preferivelmente ser tratadas de acordo com a invenção incluem todas as plantas que, na modificação genética, receberam material genético que conferiu propriedades úteis particularmente vantajosas ("características") a estas plantas. Exemplos de tais propriedades são melhor crescimento da planta, tolerância aumentada a temperaturas elevadas ou baixas, tolerância aumentada à estiagem ou à água ou teor de sal do solo, desempenho de floração aumentado, colheita mais fácil, maturação acelerada, produções de colheita maiores, melhor qualidade e/ou um valor nutricional maior dos produtos colhidos, melhor estabilidade em estocagem e/ou processabilidade dos produtos colhidos. Além disso e particularmente enfatizados exemplos de tais propriedades são uma defesa melhor das plantas contra pestes animais e microbianas, tal como contra insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e/ou viroses, e também tolerância aumentada das plantas a certos compostos herbicidamente ativos. Exemplos de plantas transgênicas que podem ser mencionados são as plantas de colheita importantes, tal como cereais (trigo, arroz), milho, feijões soja, batatas, algodão, tabaco, óleo de semente de colza e também plantas frutíferas (com as frutas maçãs, peras, frutos cítricos e uvas), e ênfase particular é dada ao milho, feijões soja, batatas, algodão, tabaco e óleo de semente de colza. Características que são enfatizadas são em particular defesa aumentada das plantas contra insetos, aracnídeos, nematódeos e lesmas e caracóis por toxinas formadas nas plantas, em particular aquelas formadas nas plantas pelo material genético do *Bacillus thuringiensis* (por exemplo, pelos genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb e CryIF e também combinações

destes) (infra-referidas como "plantas Bt"). As características que são também particularmente enfatizadas são a defesa aumentada das plantas contra fungos, bactérias e viroses por resistência adquirida sistêmica (SAR), sisteminas, fitoalexinas, eliciadores e genes de resistência e correspondentemente proteínas e toxinas expressas. As características que são também particularmente enfatizadas são a tolerância aumentada das plantas a certos compostos herbicidamente ativos, por exemplo imidazolinonas, sulfoniluréias, glifosato ou fosfinotricina (por exemplo, o gene "PAT"). Os genes que conferem as características desejadas em questão podem também estar presentes em combinação entre si nas plantas transgênicas. Exemplos de "plantas Bt" que podem ser mencionados são variedades de milho, variedades de algodão, variedades de feijão soja e variedades de batata que são vendidas sob as marcas comerciais YIELD GARD® (por exemplo milho, algodão, feijões soja), KnockOut® (por exemplo milho), StarLink® (por exemplo milho), Bollgard® (algodão), Nucoton® (algodão) e NewLeaf® (batata). Exemplos de plantas tolerantes a herbicida que podem ser mencionados são variedades de milho, variedades de algodão e variedades de feijão soja que são vendidos sob as marcas comerciais Roundup Ready® (tolerância ao glifosato, por exemplo, milho, algodão, feijão soja), Liberty Link® (tolerância à fosfinotricina, por exemplo, óleo de semente de colza), IMI® (tolerância às imidazolinonas) e STS® (tolerância às sulfoniluréias, por exemplo, milho). As plantas resistentes a herbicida (plantas reproduzidas de uma maneira convencional para tolerância a herbicida) que podem ser mencionadas também incluem as variedades vendidas sob a marca comercial Clearfield® (por exemplo, milho). Realmente, estas declarações também se aplicam às espécies de planta que têm estas características genéticas ainda a serem desenvolvidas, e que serão desenvolvidas e/ou comercializadas no futuro.

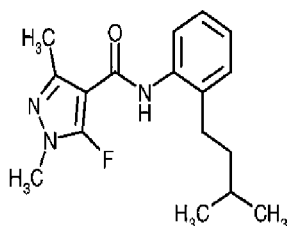
As plantas listadas podem ser tratadas de acordo com a invenção de uma maneira particularmente vantajosa com os compostos da fórmula geral (I) ou as misturas de composto ativo de acordo com a invenção. As faixas preferidas estabelecidas acima para os compostos ativos ou misturas também aplicam-se ao tratamento destas plantas. Ênfase particular é dada

ao tratamento de plantas com os compostos ou misturas especificamente mencionados no presente texto.

A preparação e o uso dos compostos ativos de acordo com a invenção são ilustrados pelos exemplos abaixo.

5 **Exemplos de preparação**

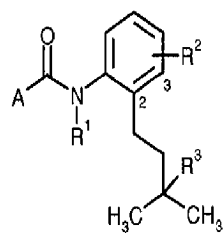
Exemplo 1



326,5 mg (2,0 mmols) de [2-(3-metilbutil)fenil]amina (III-1) são adicionados a uma solução compreendendo 388,5 mg (2,2 mmols) de cloreto de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonila e 0,45 ml (3,2 mmols) de trietilamina em 20 ml de tetraidrofurano. A solução de reação é agitada a 60°C durante 90 minutos, filtrada através de sílica-gel e concentrada. Cromatografia de coluna (gradiente de cicloexano/acetato de etila) fornece 592 mg (98% de teoria) de 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[2-(3-metilbutil)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida de logP (pH 2,3) = 3,12.

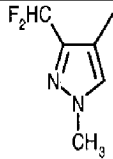
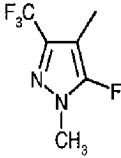
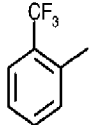
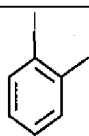
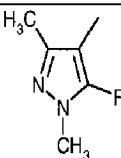
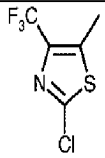
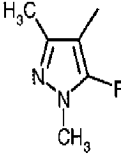
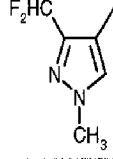
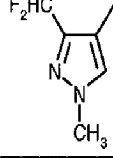
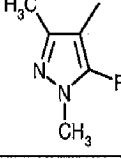
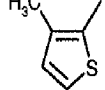
Os compostos da fórmula (I) listados na Tabela 1 abaixo são obtidos analogamente ao Exemplo 1 e de acordo com as instruções nas descrições gerais dos processos.

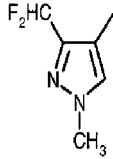
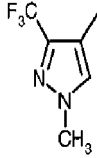
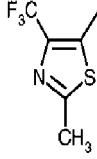
Tabela 1



(I)

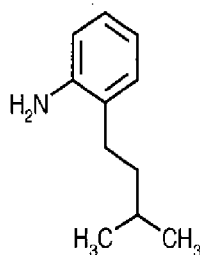
Ex.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
2	H	H	CH ₃		3,42
3	H	H	CH ₃		4,14
4	H	H	H		3,90
5	H	H	CH ₃		4,13
6	H	H	H		3,87
7	H	H	CH ₃		4,15
8	H	H	H		3,78
9	H	H	H		3,76
10	H	H	H		3,68

Ex.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
11	H	H	CH ₃		3,28
12	H	H	CH ₃		3,91
13	H	4-Cl	C ₂ H ₅		4,96
14	H	4-Cl	C ₂ H ₅		5,02
15	H	4-Cl	C ₂ H ₅		4,29
16	H	H	CH ₃		4,54
17	H	H	C ₂ H ₅		3,68
18	H	H	C ₂ H ₅		3,59
19	H	4-Cl	C ₂ H ₅		4,10
20	H	4-F	CH ₃		3,34
21	H	4-F	CH ₃		4,14

Ex.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
22	H	4-F	CH ₃		3,34
23	H	4-F	CH ₃		3,57
24	H	4-F	CH ₃		4,05

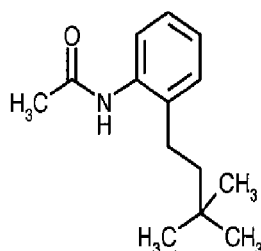
Preparação de materiais de partida da fórmula (III)

Exemplo (III-1)



- Uma solução compreendendo 8,0 g (0,045 mol) de 1-(2-aminofenil)-3-metilbutan-1-ona (X-1), 6,8 g (0,135 mol) de hidrato de hidrazina e 7,6 g (0,135 mol) de hidróxido de potássio em 90 ml de trietileno glicol é aquecida a 210°C durante 6 horas. Para preparação, água e acetato de etila são adicionados em temperatura ambiente. A fase orgânica é novamente lavada com água, secada sobre sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida. Purificação por cromatografia de coluna (ciclohexano/acetato de etila 3:1) fornece 5,3 g (71,5% de teoria) de [2-(3-metilbutil)-fenil]amina.

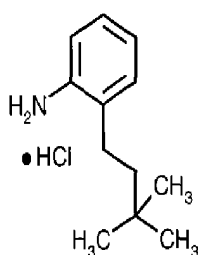
Exemplo (III-2)



3,23 g (15 mmols) de N-[2-(3,3-dimetilbut-1-inil)fenil]acetamida

- (XIII-1) foram inicialmente carregados em 40 ml de metanol. 0,5 g de paládio sobre carbono (5%) foi adicionado, e a mistura é então hidrogenada em uma autoclave em uma pressão de hidrogênio de 0,4 mPa (4 bar) durante 20 horas. A remoção do catalisador e o solvente produziu 3,1 g (94% de teoria) de
- 5 N-[2-(3,3-dimetilbutil)fenil]acetamida de logP (pH 2,3) = 2,69.

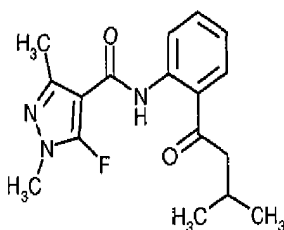
Exemplo (III-3)



- 0,5 g (2,3 mmols) de N-[2-(3,3-dimetilbutil)fenil]acetamida (III-2) foram agitados em 20 ml de 2N de ácido hidrocloreto a 100°C durante 5 ho-
- 10 ras. Após resfriamento, a mistura foi extraída 3 vezes em cada caso com 20 ml de acetato de etila. A fase orgânica foi removida, secada sobre sulfato de sódio e concentrada. Isto produziu 390 mg (29% de teoria) de hidrocloreto de 2-(3,3-dimetilbutil)fenilamina de logP (pH 2,3) = 2,20.

Preparação de materiais de partida da fórmula (V)

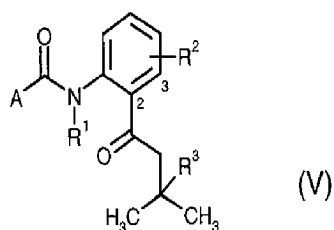
- 15 Exemplo (V-1)



- Em temperatura ambiente, 355,0 mg (2,0 mmols) de 1-(2-aminofenil)-3-metilbutan-1-ona são adicionados a uma solução compreendendo 388,5 mg (2,2 mmols) de cloreto de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonila e 0,45 ml (3,2 mmols) de trietilamina em 20 ml de tetraidrofurano.
- 20 Uma mistura de reação é agitada a 60°C durante 1,5 h, filtrada através de sílica gel e concentrada. Cromatografia de coluna (cicloexano/acetato de etila: 3/1) fornece 577,7 mg (1,8 mmol, 88% de teoria) de N-[2-(3-metilbutiril)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida de logP (pH = 2,3) = 3,42.

Os compostos da fórmula (V) listados na Tabela 2 abaixo são obtidos analogamente ao Exemplo (V-1) e de acordo com as instruções nas descrições gerais dos processos.

Tabela 2

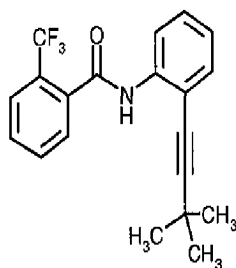


5

Ex.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
V-2	H	H	H		4,30
V-3	H	H	H		4,33
V-4	H	H	H		4,53
V-5	H	H	H		4,35
V-6	H	H	H		4,30
V-7	H	H	H		4,44

Preparação de materiais de partida da fórmula (VII)

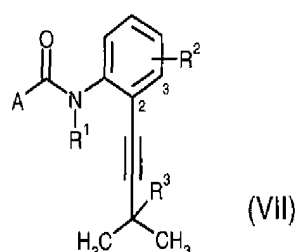
Exemplo (VII-1)



- 190 mg (1,0 mmol) de ácido 2-trifluorometilbenzóico, 178 mg (0,83 mmol) de 2-(3,3-dimetil-but-1-inil)fenilamina, 215 mg (1,67 mmol) de N,N-diisopropiletilamina e 583 mg (1,25 mmol) de PyBrOP em 8 ml de acetonitrilo foram agitados em temperatura ambiente durante 4 dias. 10 ml de acetato de etila/água 1:1 foram adicionados à mistura e a fase orgânica foi separada e lavada com 10 ml de solução de cloreto de amônio saturada e subsequentemente com 10 ml de água. Separação, concentração e secagem da fase orgânica produziu 950 mg de produto bruto. Purificação cromatográfica de coluna em sílica-gel 60 (éter de petróleo/acetato de etila 10:1 → acetato de etila) produziu 110 mg de N-[2-(3,3-dimetilbut-1-inil)fenil]-2-trifluorometilbenzamida [$\log P$ (pH 2,3) = 4,55].

Os compostos da fórmula (VII) listados na Tabela 3 abaixo são obtidos analogamente ao Exemplo (VII-1) e de acordo com as instruções nas descrições gerais dos processos.

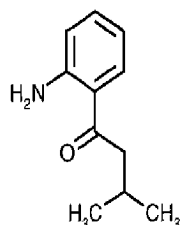
15 Tabela 3



Ex.	R ¹	R ²	R ³	A	logP
VII-2	H	H	CH ₃		4,73
VII-3	H	H	CH ₃		3,75
VII-4	H	H	CH ₃		4,52
VII-5	H	H	CH ₃		4,17

Preparação dos materiais de partidas da fórmula (X)

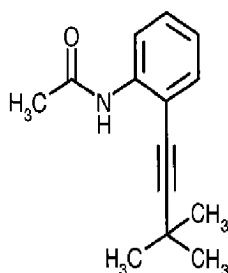
Exemplo (X-1)



- 5 Ao refluxo, uma solução de 29,5 g (0,25 mol) de antranilonitrilo em 150 ml de tetraidrofurano é adicionada em gotas a uma suspensão compreendendo 18,2 g (0,75 mmol) de magnésio, 375 ml de solução de 2 M de brometo de isobutilmagnésio em tetraidrofurano e 15 ml de éter de dietila. Após 5 horas de aquecimento sob refluxo, 100 ml de água são, a 0°C, adicionados à mistura de reação, e o pH é ajustado em 6 empregando ácido hidrocloreto. A fase orgânica é lavada com água e secada sobre sulfato de magnésio. Concentração sob pressão reduzida e purificação em sílica-gel (fase móvel: éter de petróleo/acetonitrila 95:5) fornece 11,0 g (25% de teoria) de 1-(2-aminofenil)-3-metilbutan-1-ona de $\log P$ (pH 2,3) = 2,89.

Preparação de materiais de partida da fórmula (XIII)

Exemplo (XIII-1)



- 15 Sob argônio, 25,7 g (120 mmols) de orto-bromoacetanilida, 5,05 g (7,2 mmols) de cloreto de bis(trifenilfosfina)paládio(II) e 1,37 g (7,2 mmols) de iodeto de cobre(I) foram inicialmente carregados em 450 ml de trietilamina. Em temperatura ambiente, 17,8 g (180 mmol) de 3,3-dimetil-1-butina foram então adicionados em gotas durante um período de 10 minutos, e a mistura é agitada a 50°C durante 5 horas. Uma mistura de reação foi despejada em 2 litros de água e extraída 3 vezes em cada caso com 250 ml de éter de dietila, e os extratos foram secados em sulfato de sódio e concentrados. Purificação cromatográfica de coluna em sílica-gel 60 com clore-

to de metileno produziu 25,9 g de N-[2-(3,3-dimetilbut-1-inil)-fenil]acetamida de logP (pH 2,3) = 3,03.

A determinação dos valores logP dados nos exemplos de preparação e tabelas acima é realizada de acordo com EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 por HPLC (Cromatografia Líquida de Desempenho Elevado) em
5 uma coluna de fase reversa (C 18). Temperatura: 43°C.

A determinação é realizada na faixa ácida em pH 2,3 empregando-se as fases móveis 0,1% de ácido fosfórico aquoso e acetonitrila; gradiente linear de 10% de acetonitrila a 90% acetonitrila.

10 A calibração é realizada empregando-se alcan-2-onas não ramificadas (de 3 a 16 átomos de carbono) cujos valores logP são conhecidos (determinação dos valores logP por tempos de retenção empregando-se interpolação linear entre duas alcanonas sucessivas).

Os valores lambda-max foram determinados nos máximos dos
15 sinais cromatográficos empregando-se os espectros de UV de 200 nm a 400 nm.

Exemplos de Uso:

Exemplo A

Teste de *Podosphaera* (maçã) / protetora

20 Solventes: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de éter alquilaril poliglicol.

Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1 parte em peso de composto é misturada com as quantidades estabelecidas
25 de solventes e emulsificante, e o concentrado é diluído com água para a concentração desejada.

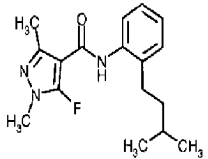
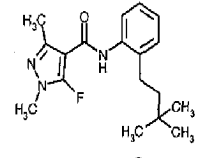
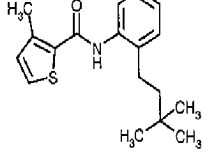
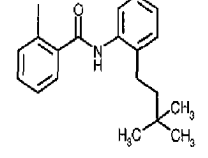
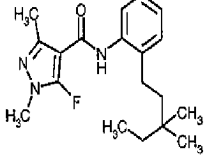
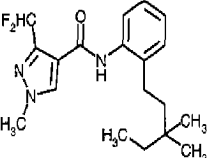
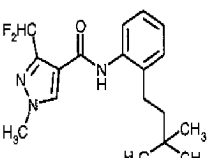
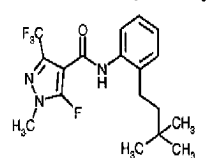
Para testar quanto à atividade protetora, plantas jovens são vaporizadas com a preparação de composto ativo nas taxas de aplicação estabelecidas. Após o revestimento por *spray* ter secado sobre, as plantas são
30 inoculadas com uma suspensão de esporo aquosa do patógeno de mofo da maçã *Podosphaera leucotricha*. As plantas foram então colocadas em uma estufa em aproximadamente 23°C e uma umidade atmosférica relativa de

cerca de 70%.

A avaliação é realizada 10 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, ao passo que uma eficácia de 100% significa que nenhuma infecção é observada.

5 Tabela A

Teste de *Podosphaera* (maçã) / protetora

Composto ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de composto ativo em g/ha	Eficácia em %
	100	100
	100	100
	100	99
	100	97
	100	99
	100	100
	100	100
	100	100

Exemplo B**Teste de *Venturia* (maçã) / protetora**

Solventes: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

- 5 Emulsificante: 1 parte em peso de éter alquilaril poliglicol.

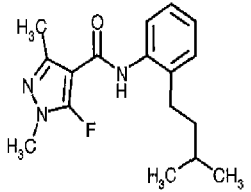
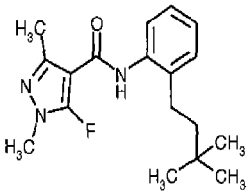
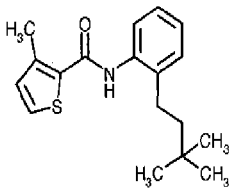
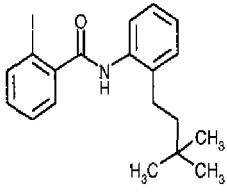
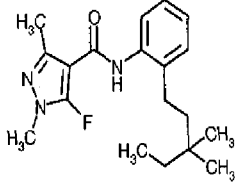
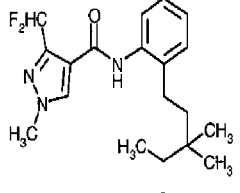
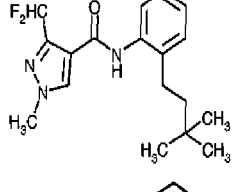
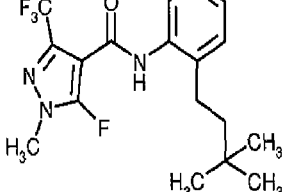
Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1 parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades estabelecidas de solventes e emulsificante, e o concentrado é diluído com água para a concentração desejada.

- 10 Para testar quanto à atividade protetora, plantas jovens são vaporizadas com a preparação do composto ativo nas taxas de aplicação estabelecidas. Após o revestimento por *spray* ter secado sobre, as plantas são inoculadas com uma suspensão de conidia aquosa do patógeno de sarna de maçã *Venturia inaequalis* e em seguida permanecem em uma cabine de
- 15 incubação em aproximadamente 20°C e 100% de umidade atmosférica relativa durante 1 dia.

As plantas foram então colocadas em uma estufa em aproximadamente 21°C e uma umidade atmosférica relativa de aproximadamente 90%.

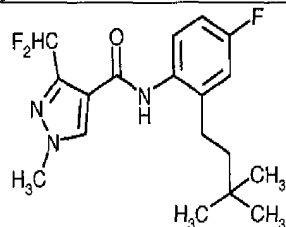
Tabela B

Teste de *Venturia* (maçã) / protetora

Composto ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de composto ativo em g/ha	Eficácia em %
	100	96
	100	100
	100	99
	100	97
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100

Teste de *Venturia* (maçã) / protetora

Composto ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de composto ativo em g/ha	Eficácia em %
---	---	---------------



100

100

Exemplo C**Teste de *Botrytis* (feijão) / protetora**

Solventes: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

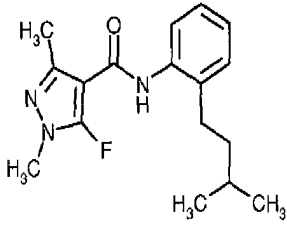
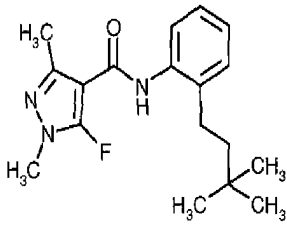
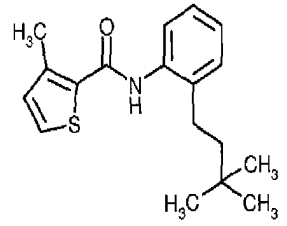
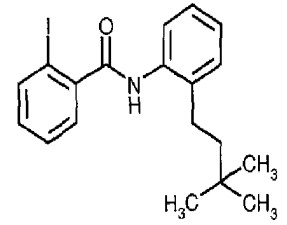
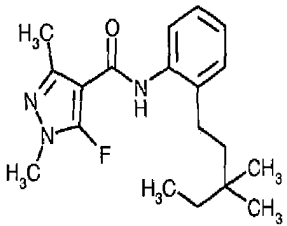
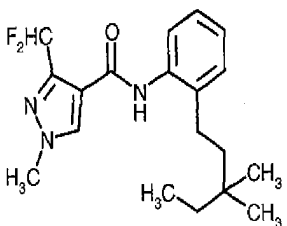
- 5 Emulsificante: 1 parte em peso de éter alquilaril poliglicol.

Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1 parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades estabelecidas de solventes e emulsificante, e o concentrado é diluído com água para a concentração desejada.

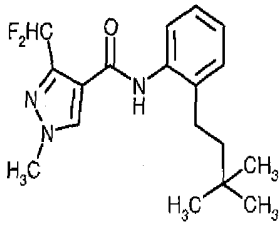
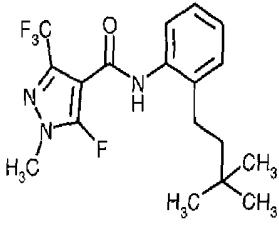
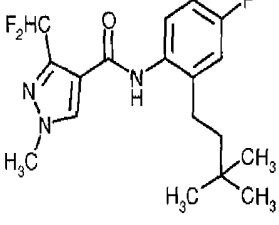
- 10 Para testar quanto à atividade protetora, plantas jovens são vaporizadas com a preparação do composto ativo nas taxas de aplicação estabelecidas. Após o revestimento por *spray* ter secado sobre, 2 pequenos pedaços de ágar colonizado por *Botrytis cinerea* são colocados sobre cada folha. As plantas inoculadas são colocadas em uma câmara escura em aproximadamente 20°C e 100% de umidade atmosférica relativa.

15 Após dois dias de inoculação, o tamanho das áreas infectadas sobre as folhas é avaliado. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, ao passo que uma eficácia de 100% significa que nenhuma infecção é observada.

Tabela C

Teste de <i>Botrytis</i> (feijão) / protetora		
Ingrediente Ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de composto ativo em g/ha	Eficácia em %
	500	84
	500	100
	500	100
	500	87
	500	100
	500	100

Teste de *Botrytis* (feijão) / protetora

Ingrediente Ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de composto ativo em g/ha	Eficácia em %
	500	100
	500	100
	500	100

Exemplo D**Teste de *Puccinia* (trigo) / curativo**

Solvente: 50 partes em peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de éter alquilaril poliglicol.

- 5 Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1 parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades estabelecidas de solvente e emulsificante, e o concentrado é diluído com água para a concentração desejada.

- 10 Para testar quanto à atividade curativa, plantas jovens são vaporizadas com suspensão conídica de *Puccinia recondita*. As plantas permanecem em uma cabine de incubação a 20°C e 100% de umidade atmosférica relativa durante 48 horas. As plantas são então vaporizadas com a preparação de composto ativo nas taxas de aplicação estabelecidas.

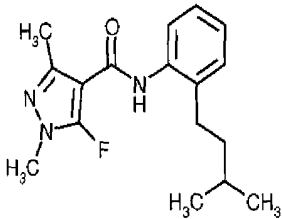
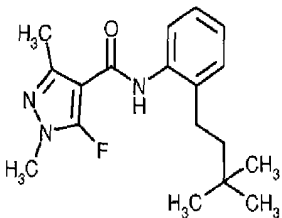
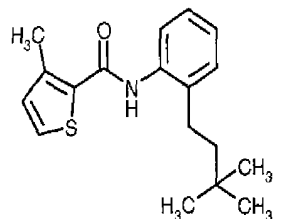
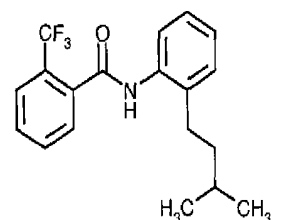
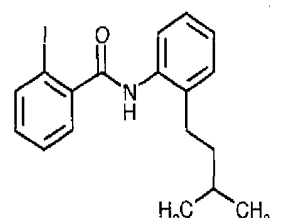
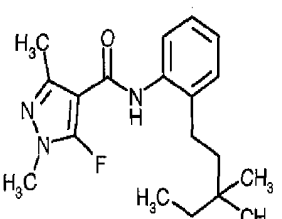
- 15 As plantas foram então colocadas em uma estufa em uma temperatura de cerca de 20°C e uma umidade atmosférica relativa de 80% para promover o desenvolvimento de pústulas de ferrugem.

A avaliação é realizada 8 dias após a inoculação. 0% significa

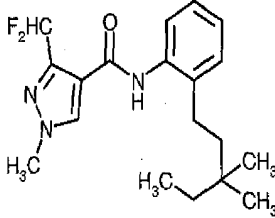
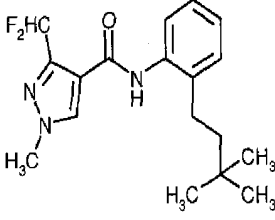
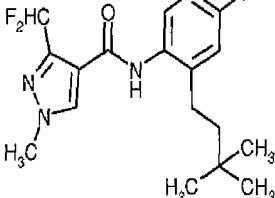
uma eficácia que corresponde àquela do controle, ao passo que uma eficácia de 100% significa que nenhuma infecção é observada.

Tabela D

Teste de *Puccinia* (trigo) / curativo

Ingrediente Ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de ingrediente ativo em g/ha	Eficácia em %
 <chem>CC(C)CCc1ccc(cc1)NC(=O)c2c(F)n(C)c(C)n2</chem>	500	100
 <chem>CC(C)CCc1ccc(cc1)NC(=O)c2c(F)n(C)c(C)n2</chem>	500	100
 <chem>CC(C)CCc1ccc(cc1)NC(=O)c2c(F)n(C)c(C)n2</chem>	500	100
 <chem>CC(C)CCc1ccc(cc1)NC(=O)c2c(F)n(C)c(C)n2</chem>	500	100
 <chem>CC(C)CCc1ccc(cc1)NC(=O)c2c(F)n(C)c(C)n2</chem>	500	100
 <chem>CC(C)CCc1ccc(cc1)NC(=O)c2c(F)n(C)c(C)n2</chem>	500	100

Teste de *Puccinia* (trigo) / curativo

Ingrediente Ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de ingrediente ativo em g/ha	Eficácia em %
	500	100
	500	100
	500	100

Exemplo E**Teste de *Sphaerotheca* (pepino) / protetora**

Solvente: 49 partes em peso de N, N-dimetilformamida

Emulsificante: 1 parte em peso de éter alquiláril poliglicol.

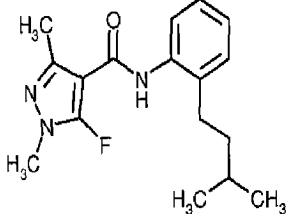
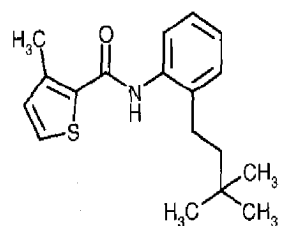
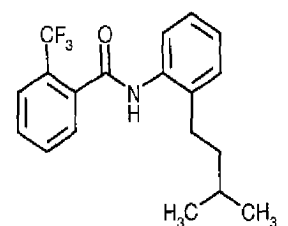
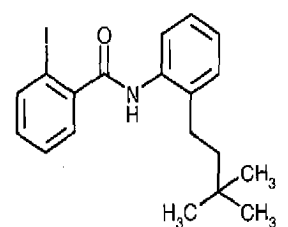
- 5 Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1 parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades estabelecidas de solvente e emulsificante, e o concentrado é diluído com água para a concentração desejada.

- 10 Para testar a atividade protetora, plantas de pepino jovens são vaporizadas com a preparação de composto ativo nas taxas de aplicação estabelecidas. Um dia depois do tratamento, as plantas são inoculadas com uma suspensão de esporo de *Sphaerotheca fuliginea*. As plantas são então colocadas em uma estufa a 70% de umidade atmosférica relativa e uma temperatura de 23°C.

- 15 A avaliação é realizada 7 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, ao passo que uma eficácia de 100% significa que nenhuma infecção é observada.

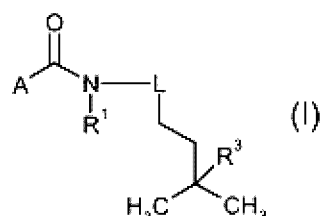
Tabela E

Teste de *Sphaerotheca* (pepino) / protetora

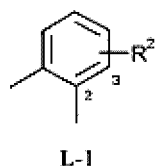
Ingrediente Ativo de acordo com a invenção	Taxa de aplicação de composto ativo em g/ha	Eficácia em %
 <chem>CC(C)CCc1ccc(NC(=O)c2c(F)c(C)n(C)c2)cc1</chem>	750	100
 <chem>CC(C)(C)CCc1ccc(NC(=O)c2cc(C)s2)cc1</chem>	750	100
 <chem>CC(C)CCc1ccc(NC(=O)c2cc(C(F)(F)F)ccc2)cc1</chem>	750	100
 <chem>CC(C)(C)CCc1ccc(NC(=O)c2cc(I)ccc2)cc1</chem>	750	100

REIVINDICAÇÕES

1. Isopentilcarboxanilidas, caracterizadas pelo fato de que apresentam a fórmula (I)



na qual
L representa



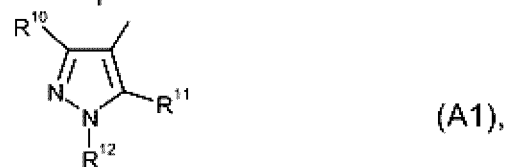
na qual

R¹ representa hidrogênio;

5 R² representa hidrogênio, flúor, cloro ou metila;

R³ representa hidrogênio ou metila;

A representa o radical da fórmula (A1)



na qual

R¹⁰ representa hidrogênio, hidroxila, formila, ciano, halogênio, nitro, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio;

R¹¹ representa hidrogênio, halogênio ou C₁-C₄-haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de halogênio; e

10 R¹² representa hidrogênio ou C₁-C₄-alquila;

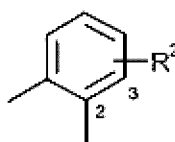
com a condição de que R¹⁰ não represente iodo se R¹¹ representa hidrogênio, e

com a condição de que R¹⁰ não represente trifluorometila ou di-

fluorometila se R^3 e R^{11} representarem hidrogênio, e R^{12} representar metila.

2. Isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), de acordo com a reivindicação 1, caracterizadas pelo fato de que:

L representa



L-1 ,

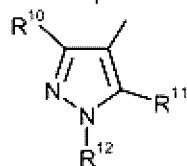
na qual

5 R^1 representa hidrogênio;

R^2 representa hidrogênio, flúor, cloro ou metila;

R^3 representa hidrogênio ou metila;

A representa o radical da fórmula (A1)



(A1),

Na qual

R^{10} representa hidrogênio, hidroxila, formila, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo;

10 R^{11} representa hidrogênio, cloro, bromo, iodo ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo de 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, e

R^{12} representa hidrogênio, metila, etila, n-propila ou isopropila ;

com a condição de que R^{10} não represente iodo se R^{11} representa hidrogênio e

15 com a condição de que R^{10} não represente trifluorometila ou difluorometila se R^3 e R^{11} representarem hidrogênio, e R^{12} representar metila,

3. Isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizadas pelo fato de que R^{10} representa mono-flúor-metila, di-flúor-metila e tri-flúor-metila.

4. Isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizadas pelo fato de que R^3 representa hidrogênio.

5. Isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizadas pelo fato de que R^3 representa metila.

6. Processo para preparar os compostos da fórmula (I), como definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que:

(a) ácido carboxílico derivados da fórmula (II)

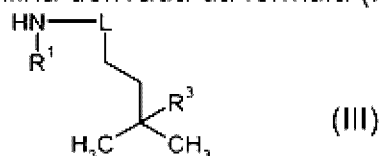


na qual

A é como definido na reivindicação 1, e

X^1 representa halogênio ou hidroxila,

são reagidos com uma anilina derivada da fórmula (III)



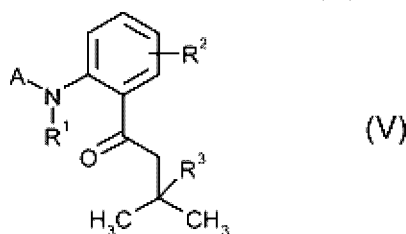
na qual

L, R^1 e R^3 são como definidos na reivindicação 1,

se apropriado, na presença de um catalisador, se apropriado, na presença de um agente condensador, se apropriado, na presença de um ácido aglutinante, e, se apropriado, na presença de um diluente,

ou

(c) isopentona derivadas da fórmula (V)



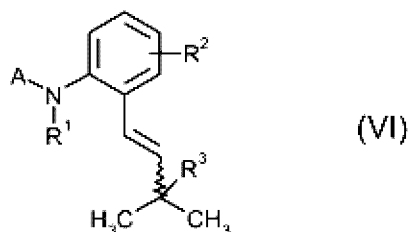
na qual

R^1 , R^2 , R^3 e A são como definidos na reivindicação 1,

são reagidos com hidrazina (ou hidrazina hidratada), na presença de uma base, e, se apropriado, na presença de um diluente,

ou

(d) derivados de isopenteno da fórmula (VI)



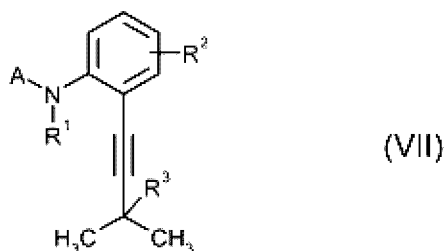
na qual

R^1 , R^2 , R^3 e A são como definidos na reivindicação 1,

5 são hidrogenados, se apropriado, na presença de um diluente, e,
se apropriado, na presença de um catalisador,

ou

(e) derivados de isopentina da fórmula (VII)



na qual

10 R^1 , R^2 , R^3 e A são como definidos na reivindicação 1,

são hidrogenados, se apropriado, na presença de um diluente, e,
se apropriado, na presença de um catalisador.

7. Composição para controlar microorganismos indesejados,
caracterizada pelo fato de que compreende pelo menos uma isopentilcarbo-
15 xanilida da fórmula (I), como definida em qualquer uma das reivindicações 1
a 5, em adição à extensores e/ou tensoativos.

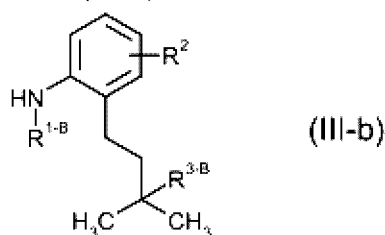
8. Uso de isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), como definidas
em qualquer uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que é
para controlar microorganismos indesejados, excluídos os tratamentos em
20 humanos e/ou animais.

9. Método para controlar microorganismos indesejados, caracte-
rizado pelo fato de que isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), como definidas
em qualquer uma das reivindicações 1 a 5, são aplicadas aos microorganis-

mos e/ou seu habitat, excluídos os tratamentos em humanos e/ou animais.

10 10. Processo para preparar composições para controlar microorganismos indesejados, caracterizado pelo fato de que isopentilcarboxanilidas da fórmula (I), como definidas em qualquer uma das reivindicações 1 a 5,
5 são misturadas com extensores e/ou tensoativos.

11. Intermediários derivados de anilina, caracterizado pelo fato de que apresentam a fórmula (III-b)



na qual

(a) R^{1-B} representa C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_6 -alquilsulfonila, C_1 - C_6 -alquilsulfonila, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -cicloalquila; C_1 - C_6 -haloalquila, C_1 - C_4 -haloalquiltio, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, C_1 - C_4 -haloalquilsulfonila, halo- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_8 -halocicloalquila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; formila, formil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alquil)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, (C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila; halo-(C_1 - C_3 -alquil)carbonil- C_1 - C_3 -alquila, halo-(C_1 - C_3 -alcóxi)carbonil- C_1 - C_3 -alquila tendo em cada caso de 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; (C_1 - C_8 -alquil)carbonila, (C_1 - C_8 -alcóxi)carbonila, (C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquil)carbonila, (C_3 - C_8 -cicloalquil)carbonil; (C_1 - C_6 -haloalquil)carbonila, (C_1 - C_6 -haloalcóxi)carbonila, (halo- C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquil)carbonila, (C_3 - C_8 -halocicloalquil)carbonila tendo em cada caso de 1 a 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo; ou $-C(=O)C(=O)R^4$, $CONR^5R^6$ ou $-CH_2NR^7R^8$, e

R^{3-B} representa hidrogênio ou metila,

ou

(b) R^{1-B} representa hidrogênio, e

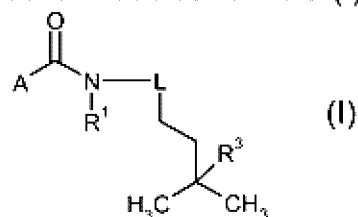
25 R^{3-B} representa halogênio ou metila, e

R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e R^8 são, cada um, como definidos na reivindicação 1, para uso em um processo como definido na reivindicação 6.

RESUMO

Patente de Invenção: "ISOPENTILCARBOXANILIDAS, SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, SEU USO E SEUS INTERMEDIÁRIOS, COMPOSIÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, E MÉTODO PARA CONTROLAR MICROORGANISMOS INDESEJADOS".

Novas isopentilcarboxanilidas da fórmula (I)



na qual

L, R¹, R³ e A são como definidos na descrição,

uma pluralidade de processos para preparação destes compostos e o uso deles para controlar microorganismos indesejados, e também novos intermediários e preparação deles.