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

(21) **PI 0619838-4 A2**

(22) Data de Depósito: 13/12/2006
(43) Data da Publicação: 17/04/2012
(RPI 2154)

(51) Int.Cl.:
A01P 3/00
A01N 43/32
A01N 43/40
C07D 213/00
C07D 319/00

(54) Título: COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS, DERIVADO DE AMIDA DE ÁCIDO CARBOXÍLICO E MÉTODOS PARA CONTROLAR FUNGOS NOCIVOS, DOENÇAS DE PLANTAS, PROTEGER PLANTAS DE CULTIVO E MELHORAR O RENDIMENTO DOS CULTIVOS

(30) Prioridade Unionista: 16/12/2005 JP 2005-363286, 20/09/2006 JP 2006-254477

(73) Titular(es): Ishihara Sangyo Kaisha LTD

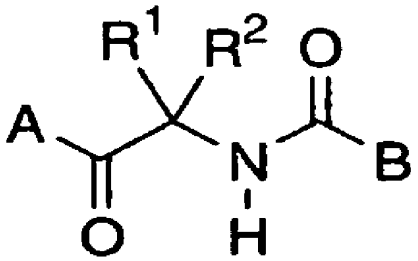
(72) Inventor(es): Shigeru Mitani, Shintaro Tsukuda, Yuji Nakamura

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

(86) Pedido Internacional: PCT JP2006325320 de 13/12/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/069777de 21/06/2007

(57) Resumo: COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS, DERIVADO DE AMIDA DE ÁCIDO CARBOXILICO E MÉTODOS PARA CONTROLAR FUGOS NOCIVOS, DOENÇAS DE PLANTAS, PROTEGER PLANTAS DE CULTIVO E MELHORAR O RENDIMENTO DOS CULTIVOS. Composições fungicidas convencionais tiveram problemas técnicos tal que tanto um efeito preventivo como curativo é inadequado, o efeito residual tende a ser inadequado, ou o efeito de controle contra doenças de plantas tende a ser inadequado dependendo do local de aplicação, e uma composição fungicida para superar tais problemas tem sido desejada. A presente invenção refere-se a uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, como um ingrediente ativo. em que A é fenila que pode ser substituida, benzodioxolanila que pode ser substituida, ou benzodioxanila que pode ser substituida; B é 2- ou 3-piridila que pode ser substituida; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou e R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; contanto que quando B for 3-piridila que pode ser substituida, A for fenila substituida por pelo menos dois substituintes.



(I)

PI 0619838-4

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS, DERIVADO DE AMIDA DE ÁCIDO CARBOXÍLICO E MÉTODOS PARA CONTROLAR FUGOS NOCIVOS, DOENÇAS DE PLANTAS, PROTEGER PLANTAS DE CULTIVO E MELHORAR O RENDIMENTO DOS CULTIVOS".**

CAMPO TÉCNICO

A presente invenção refere-se a uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico.

TÉCNICA ANTERIOR

O Documento de Patente 1 descreve que compostos da fórmula (I) mencionada posteriormente em que A é fenila que tem certo substituinte e B é piridila que tem certo substituinte, são úteis como ingredientes ativos para pesticidas, particularmente para inseticidas, acaricidas ou nematicidas. Além disso, O Documento de Patente 2 descreve que alguns de tais compostos têm atividades fungicidas e descreve especificamente que tal composto em que B é 3-flúor-4-piridila, isto é, 3-flúor-N-(2-metil-1-oxo-1-(4'-(trifluorometóxi)bifenil-4-il)propan-2-il)isonicotinamida é eficaz contra a queima da bainha do arroz. Além disso, o Documento de Patente 3 descreve que compostos da fórmula (I) mencionada posteriormente em que A é fenila que tem certos substituintes ou um grupo heterocíclico condensado que tem certo substituinte, e B é piridila que tem certo substituinte, são úteis como ingredientes ativos para pesticidas, particularmente para inseticidas, acaricidas ou nematicidas. Entretanto, nessas publicações, compostos da fórmula (I) mencionada posteriormente não estão descritos especificamente. Por outro lado, o Documento de Patente 4 descreve que compostos em que A é fenila que tem certo substituinte ou um grupo heterocíclico condensado que tem certo substituinte e B é um grupo heterocíclico que tem certo substituinte, têm atividades fungicidas, mas piridila não está incluída no grupo heterocíclico.

Documento de Patente 1: EP-A-1256569

Documento de Patente 2: JP-A-2005-179234

Documento de Patente 3: EP-A-1428817

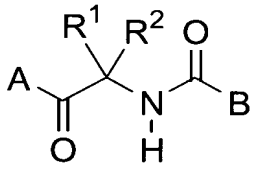
Documento de Patente 4: WO06/016708

DESCRIÇÃO DA INVENÇÃO

Muitas composições fungicidas convencionais têm tido problemas práticos tais que um efeito preventivo ou um efeito curativo são inadequados, o efeito residual tende a ser inadequado, ou o efeito de controle contra doenças de plantas tende a ser inadequado dependendo dos métodos de aplicação. Consequentemente, uma composição fungicida para solucionar tais problemas tem sido desejada.

Os presentes inventores conduziram uma pesquisa para solucionar os problemas acima e, como um resultado, descobriram que os compostos da fórmula (I) mencionada posteriormente em que B é 2- ou 3-piridila que pode ser substituída, exibem excelentes efeitos que não foram observados na técnica anterior, isto é, efeitos preventivos e efeitos curativos contra quaisquer das várias doenças causadas por fungos nocivos, tais como Oomicetos, Ascomicetos, Basidiomicetos e Deuteromicetos, e ao mesmo tempo têm atividades residuais praticamente satisfatórias e, além disso, eles exibem efeitos preventivos e efeitos curativos particularmente excelentes contra várias doenças causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos. A presente invenção foi realizada com base em tal descoberta.

Em outras palavras, a presente invenção fornece uma composição fungicida que contém um derivado amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse como um ingrediente ativo:



(I)

em que A é fenila que pode ser substituída por X, benzodioxolanila que pode ser substituída por X, ou benzodioxanila que pode ser substituída por X; B é 2- ou 3-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, hidróxi, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, cicloalquilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio,

alquiniltio, haloalquiniltio, alquilsulfonilóxi, haloalquilsulfonilóxi, alcoxialcóxi, haloalcoxialcóxi, alcóxi-haloalcóxi, haloalcóxi-haloalcóxi, alcoxialquila, haloalcoxialquila, alquiltioalquila, haloalquiltioalquila, fenila que pode ser substituída por Y, fenóxi que pode ser substituído por Y, benzilóxi que pode ser substituído por Y, piridila que pode ser substituída por Y, ou piridilóxi que pode ser substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, alcóxi ou haloalcóxi, contanto que quando B for 3-piridila que pode ser substituída, A seja fenila que pode ser substituída por pelo menos dois X (tal que uma pluralidade de X pode ser igual ou diferente).

A presente invenção fornece ainda um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse.

A presente invenção ainda fornece uma composição fungicida mista que compreende um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse e outro composto de ingrediente fungicidamente ativo, como ingredientes ativos.

Adicionalmente, a presente invenção fornece um método para controlar fungos nocivos, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse.

Ainda adicionalmente, a presente invenção fornece um método para controlar doenças de planta, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse.

Além disso, a presente invenção fornece um método para proteger plantas de cultivo, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse.

Além disso, a presente invenção fornece um método para melhorar os rendimentos de cultivo, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse.

A composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo (daqui em diante referido simplesmente como a composição da presente invenção) é

capaz de controlar eficazmente fungos nocivos, particularmente Ascomicetos ou Deuteromicetos, em uma baixa dose e assim é útil como uma composição fungicida agrícola ou de horticultura.

MELHOR MANEIRA DE EXECUTAR A INVENÇÃO

Em A, o número de substituintes X na fenila que pode ser substituída por X, na benzodioxolanila que pode ser substituída por X, e na benzodioxanila que pode ser substituída por X, pode ser um ou mais, e no caso de mais de um, tais substituintes podem ser os mesmos ou diferentes. Além disso, suas posições para substituição podem ser qualquer posição.

Em B, o substituinte na 2- ou 3-piridila que pode ser substituída, pode, por exemplo, ser halogênio, alquila, haloalquila, alcóxi ou haloalcóxi, e dentre eles, halogênio, alquila ou haloalquila é preferido, o número de tais substituintes pode ser um ou mais, e no caso de mais do que um, tais substituintes podem ser iguais ou diferentes. Além disso, suas posições para substituição podem ser qualquer posição. Entretanto, ele tem preferivelmente um substituinte na posição orto à posição aminocarbonila da fórmula (I) acima. Em tal caso, ele pode ter um substituinte apenas na posição orto à porção aminocarbonila, ou pode ter mais substituintes em outras posições.

Em X, o número de substituintes Y na fenila que pode ser substituída por Y, no fenóxi que pode ser substituído por Y, no benzilóxi que pode ser substituído por Y, ou no piridilóxi que pode ser substituído por Y, pode ser um ou mais, e no caso de mais de um, tais substituintes podem ser iguais ou diferentes. Além disso, suas posições para substituição podem ser quaisquer posições.

O número de halogênios como substituintes contidos em X ou Y pode ser um ou mais, e no caso de mais de um, eles podem ser iguais ou diferentes. Além disso, suas posições podem ser qualquer posição.

Um átomo de flúor, cloro, bromo, ou iodo pode ser mencionado como exemplo específico do halogênio ou porção de halogênio contida em um substituinte da 2- ou 3- piridila que pode ser substituída em B, ou o halogênio ou porção de halogênio contida em X ou Y.

A alquila ou porção de alquila contida em um substituinte da 2-

ou 3- piridila que pode ser substituída, em B, ou a alquila ou porção de alquila contida em R^1, R^2, X ou Y pode ser linear ou ramificada, e como um exemplo específico disso, C_{1-12} alquila pode ser mencionada tal como metila, etila, propila, isopropila, butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, pentila, isopentila, neopentila, terc-pentila, 1-metilbutila, hexila, heptila, octila, nonila, decanila, undecanila ou dodecanila.

A alquenila ou porção de alquenila contida em X ou Y pode ser linear ou ramificada, e como um exemplo específico disso, C_{2-6} alquenila pode ser mencionada tal como vinila, 1-propenila, alila, isopropenila, 1-butenila, 1,3-butadienila ou 1-hexenila.

A alquinila ou porção de alquinila contida em X ou Y pode ser linear ou ramificada, e como um exemplo específico disso, C_{2-6} alquinila pode ser mencionada tal como etinila, 2-butinila, 2-pentinila, 3-metil-1-butinila, 2-penten-4-inila, ou 3-hexinila.

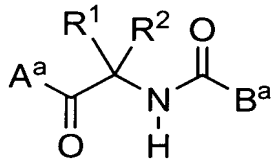
Como um exemplo específico da porção de cicloalquila contida em X, C_{3-6} cicloalquila pode ser mencionada tal como ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila ou ciclo-hexila.

O sal do derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima pode ser qualquer sal contanto que ele seja agricolamente aceitável. Por exemplo, ele pode ser um sal de metal alcalino tal como sal de sódio ou um sal de potássio; um sal de metal alcalino-terroso tal como um sal de magnésio ou um sal de cálcio; um sal de amina tal como um sal de dimetilamina ou um sal de trietilamina; um sal de ácido inorgânico tal como cloridrato, um perclorato, um sulfato ou um nitrato; ou um sal de ácido orgânico tal como um acetato ou sulfonato de metano.

O derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima tem vários isômeros tais como isômeros ópticos ou isômeros geométricos, e a presente invenção inclui tanto isômeros como misturas de tais isômeros. Além disso, a presente invenção também inclui vários isômeros que não os isômeros acima dentro do conhecimento comum no campo técnico em questão. Além disso, dependendo dos tipos de isômeros, eles podem ser estruturas químicas diferentes da fórmula (I) acima, mas eles estão dentro do esco-

po da presente invenção, já que é obvio para os versados na técnica que eles são isômeros.

No derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima, um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) ou um sal disso:



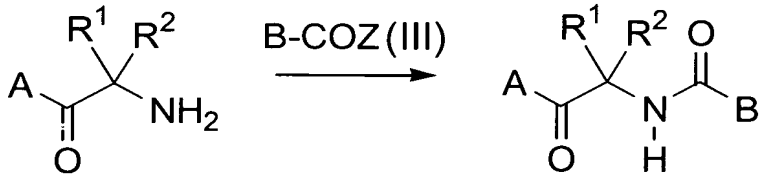
(I-a)

em que A^a é fenila que pode ser substituída por X, B^a é 2-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, hidróxi, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, cicloalquilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, alquilsulfonilóxi, haloalquilsulfonilóxi, alcoxialcóxi, haloalcoxialcóxi, alcóxi-haloalcóxi, haloalcóxi-haloalcóxi, alcoxialquila, haloalcoxialquila, alquiltioalquila, haloalquiltioalquila, fenila que pode ser substituída por Y, fenóxi que pode ser substituído por Y, benzilóxi que pode ser substituído por Y, piridila que pode ser substituída por Y, ou piridilóxi que pode ser substituída por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, alcóxi ou haloalcóxi, é um novo composto que não era especificamente conhecido anteriormente e é um composto que exibe efeitos preventivos e efeitos curativos particularmente excelentes contra várias doenças causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos.

O derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso pode ser produzido pelas seguintes reações (A) a (K), pelos métodos descritos nos Exemplos de Preparação 1 a 11 dados aqui posteriormente, ou por um processo comum para produzir um sal.

REAÇÃO (A)

[A]



(II) ou um sal disso (I)

Na reação (A), A, B, R', e R², são como definidos acima. Z é hidróxi, alcóxi ou halogênio, e o halogênio pode ser um átomo de flúor, cloro, bromo ou iodo.

Reação (A) pode ser realizada geralmente na presença de uma base e de um solvente.

A base pode ser uma ou mais selecionadas adequadamente a partir de, por exemplo, um metal alcalino tal como sódio ou potássio; um alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sódio, etóxido de sódio, ou butóxido terciário de potássio; um carbonato tal como carbonato de sódio ou carbonato de potássio; um bicarbonato tal como bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; um hidróxido de metal tal como hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio; um hidreto de metal tal como hidreto de sódio ou hidreto de potássio; uma amina tal como monometilamina, dimetilamina ou trietilamina; uma piridina tal como piridina ou 4-dimetilaminopiridina; e um lítio orgânico tal como metil-lítio, n-butil-lítio ou di-isopropil amida de lítio. A base pode ser usada em uma quantidade de 1 a 3 mols, preferivelmente de 1 a 2 mols, por mol do composto da fórmula (II).

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático tal como tetracloreto de carbono, cloreto de metila, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico, ou dimetoxietano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um solvente aprótico polar tal como sulfóxido de dimetila, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, piridina acetonitrila ou propionitrila; e uma cetona tal como

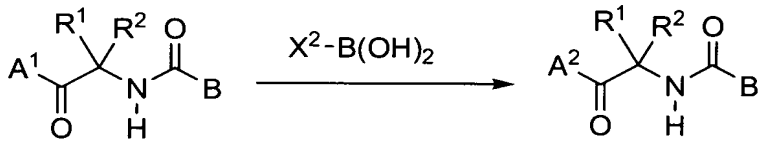
acetona ou metil etil cetona.

Reação (A) pode ser executada, se necessário, na presença de um agente de condensação de desidratação. O agente de condensação de desidratação pode, por exemplo, ser N,N'-diciclo-hexilcarbodi-imida, isocianato de clorossulfonila, N,N'-carbonildi-imidazol e anidrido trifluoroacético.

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

REAÇÃO B

[B]



(I-1) (I-2)

Na reação (B), B, R^1 e R^2 são como definidos acima, e X^2-$B(OH)_2$ é ácido borônico (nessa fórmula, B é boro). A^1 é fenila substituída por X^1, benzodioxolanila substituída por X^1 ou benzodioxanila substituída por X^1, A^2 é fenila substituída por X^2, benzodioxolanila substituída por X^2, ou benzodioxanila substituída por X^2, X^1 é um átomo de cloro, bromo ou iodo, X^2 é fenila que pode ser substituída por Y, fenóxi que pode ser substituído por Y, benzilóxi que pode ser substituído por Y, piridila que pode ser substituída por Y, ou piridilóxi que pode ser substituído por Y (Y é como definido acima).

A reação (B) pode ser realizada geralmente na presença de um catalisador, uma base, um solvente e um gás inerte.

O catalisador pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, complexos de paládio, tais como tetracis (trifenilfosfina)paládio(0), bis (dibenzilidenoacetona)paládio(0), e tris (dibenzilidenoacetona)dipaládio(0).

A base pode ser uma ou mais adequadamente selecionadas a partir de, por exemplo, um carbonato tal como carbonato de sódio, carbonato de potássio ou carbonato de cálcio; um bicarbonato tal como um bicarbonato de sódio ou bicarbonato de potássio; e um hidróxido de metal tal como hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio. A base pode ser usada em uma quantidade de 1 a 20 mols, preferivelmente de 1 a 10 mols, por mol do com-

posto da fórmula (I-1).

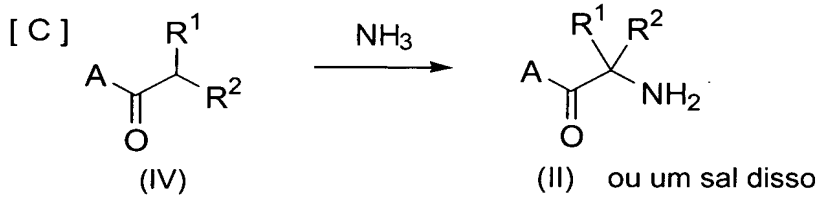
O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático tal como tetracloreto de carbono, cloreto de metila, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou 1,2-dimetoxietano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um solvente aprótico polar tal como sulfóxido de dimetila, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona ou piridina; uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilonitrila; uma cetona tal como acetona ou metil etil cetona; um álcool tal como metanol, etanol, propanol ou terc-butanol; e água.

O gás inerte pode ser, por exemplo, gás nitrogênio ou gás argônio.

A temperatura de reação para a reação (B) é geralmente de 0 a 150°C, preferivelmente de 15 a 100°C. o tempo de reação é geralmente de 0,5 a 96 horas, preferivelmente de 1 a 48 horas.

O composto da fórmula (II) a ser usado na reação (A) acima pode ser produzido pelas seguintes reações (C) a (E).

<u>REAÇÃO (C)</u>



Na reação (C), A, R^1 e R^2 são como definidos acima. Na reação (C), um sal do composto (II) pode ser produzido por pós-tratamento da reação ou de acordo com uma reação comum para formar um sal.

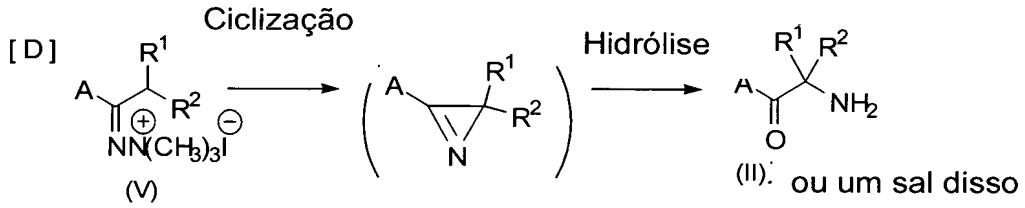
A reação (C) pode ser executada geralmente na presença de um agente oxidante e um solvente.

O agente oxidante pode, por exemplo, ser ferricianeto de potássio. O agente oxidante pode ser usado em uma quantidade de 1 a 10 mols, preferivelmente de 1 a 5 mols, por mol do composto da fórmula (IV).

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais selecionados a partir de, por exemplo, um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um solvente aprótico polar, tal como sulfóxido de dimetila, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona ou piridina; uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilonitrila; uma cetona tal como acetona ou metil etil cetona; e água.

A temperatura de reação para a reação (C) é geralmente de 20 a 150°C, preferivelmente de 50 a 100°C. O tempo de reação é geralmente de 0,5 a 30 horas, preferivelmente de 1 a 20 horas.

REAÇÃO (D)



Na reação (D), A, R^1 e R^2 são como definidos acima. Na reação (D), um sal do composto (II) pode ser produzido por pós-tratamento da reação ou de acordo com uma reação comum para formar um sal.

A reação de ciclização na reação (D) pode ser executada geralmente na presença de uma base e um solvente.

A base pode ser uma ou mais selecionadas adequadamente a partir de, por exemplo, um metal alcalino tal como sódio ou potássio; um alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sódio, etóxido de sódio ou terc-butóxido de sódio; e um hidreto de metal tal como hidreto de sódio ou hidreto de potássio. A base pode ser usada em uma quantidade de 1 a 3 mols, preferivelmente de 1 a 1,5 mol por mol do composto da fórmula (V).

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno ou clorobenzeno; um éter tal como éter dioxano, tetra-

hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um álcool tal como metanol, etanol ou propanol ou terc-butanol; e uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilonitrila.

A temperatura de reação para a reação de ciclização na reação (D) é geralmente de 0 a 150°C, preferivelmente de 30 a 100°C. O tempo de reação é geralmente de 0,5 a 24 horas, preferivelmente de 1 a 12 horas.

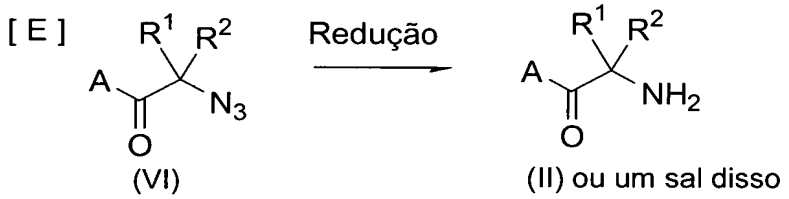
A reação hidrilítica na reação (D) pode ser executada de acordo com uma reação hidrolítica comum e pode ser executada geralmente na presença de um ácido ou uma base e um solvente.

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

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser ou mais adequadamente selecionados, por exemplo, um álcool tal como metanol, etanol, propanol, ou terc-butanol; uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilonitrila; uma cetona tal como acetona ou metil etil cetona; e água.

A temperatura de reação para a reação hidrolítica na reação (D) é geralmente de 1 a 100 °C, preferivelmente de 20 a 80°C. O tempo de reação é geralmente de 0,1 a 12 horas, preferivelmente de 0,1 a 1 hora.

REAÇÃO (E)



Na reação (E), A, R^1 e R^2 são como definidos acima. Na reação (E), um sal do composto (II) pode ser produzido por pós-tratamento da reação ou de acordo com uma reação comum para formar um sal.

A reação de redução na reação (E) pode, por exemplo, ser redução catalítica, redução por um hidreto de metal (tal como boro idreto de sódio, ou hidreto de alumínio e lítio); redução, por exemplo, por trifenilfosfina, sulfito de dimetila ou sulfito de difenila; ou redução em um sistema de reação

constituído por um metal tal como ferro ou cobre e um ácido carboxílico tal como ácido fórmico ou ácido acético. A redução catalítica é geralmente executada em uma atmosfera de hidrogênio pelo uso de um catalisador, tal como platina, óxido de platina, negro de platina, Níquel de Raney, paládio, paládio-carbono, ródio ou ródio-alumina.

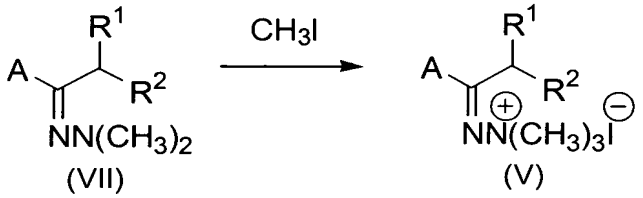
A reação (E) pode ser executada geralmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno ou xileno; um hidrocarboneto alifático tal como hexano ou ciclo-hexano; um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um solvente aprótico polar tal como sulfóxido de dimetila, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona ou piridina; uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilonitrila; uma cetona tal como acetona ou metil etil cetona; um álcool tal como metanol, etanol, propanol ou terc-butanol; e água.

A temperatura de reação na reação (E) é geralmente de 0 a 150°C, preferivelmente de 0 a 80°C. O tempo de reação é geralmente de 0,5 a 96 horas, preferivelmente de 0,5 a 48 horas.

O composto da fórmula (V) a ser usado na reação (D) acima pode ser produzido pela seguinte reação (F).

<u>REAÇÃO (F)</u>

[F]



Na reação (F), A, R^1 e R^2 são como definidos acima.

A reação (F) pode ser executada, se necessário, na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja inerte para a reação e, por exemplo, ele possa ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático

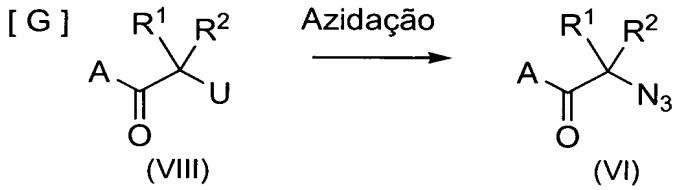
tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático tal como tetracloreto de carbono, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloretano, hexano ou ciclo-hexano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um álcool tal como metanol, etanol ou terc-butanol; uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilonitrila; e uma cetona tal como acetona ou metil etil cetona.

Iodeto de metila na reação (F) pode ser usado em uma quantidade de 1 a 10 mols, preferivelmente de 1 a 3 mols, por mol do composto da fórmula (VII). Além disso, iodeto de metila também pode servir como um solvente se usado em excesso.

A temperatura de reação para a reação (F) é geralmente de 0 a 100°C, preferivelmente de 10 a 50°C. O tempo de reação é geralmente de 0,5 a 48 horas, preferivelmente de 1 a 24 horas.

O composto da fórmula (VI) a ser usado na reação acima (E) pode ser produzido pela seguinte reação (G).

REAÇÃO (G)



Na reação (G), A, R^1 e R^2 são como definidos acima, U é um átomo de cloro ou bromo.

A reação (G) pode ser executada na presença de um agente de azidação; o agente de azidação pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, azida de sódio, azida de potássio e azida de trimetilsilila.

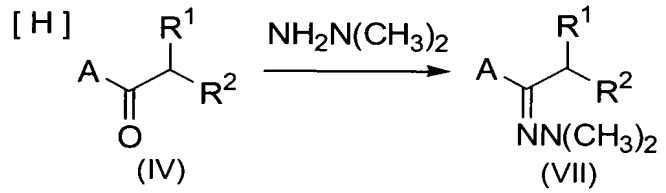
A reação (G) pode ser executada geralmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno ou xileno ou clorobenzeno; hidrocarboneto alifático tal como tetracloreto de carbono, cloreto de metila, clorofórmio, diclo-

rometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um solvente aprótico polar tal como sulfóxido de dimetila, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metil-pirrolidona ou piridina; uma nitrila tal como acetonitrila, propionitrila ou acrilo-nitrila; uma cetona tal como acetona ou metil etil cetona; um álcool tal como metanol, etanol, propanol ou terc-butanol; e água.

A temperatura de reação para a reação (G) é geralmente de 0 a 150°C, preferivelmente de 20 a 90°C. O tempo de reação é geralmente de 0,1 a 96 horas, preferivelmente de 0,5 a 12 horas.

O composto da fórmula (VII) a ser usado na reação (F) acima pode ser produzido pela seguinte reação (H).

<u>REAÇÃO (H)</u>



Na reação (H), A, R^1 e R^2 são como definidos acima

A reação (H) pode ser executada de acordo com uma reação sintética de hidrazona comum e, se necessário, na presença de um agente desidratante e/ou um catalisador.

Como o agente desidratante, a peneira molecular pode, por e-xemplo, ser mencionada. O agente desidratante pode ser usado geralmente de 1 a 30 vezes, preferivelmente de 5 a 10 vezes em relação ao peso do composto da fórmula (IV).

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

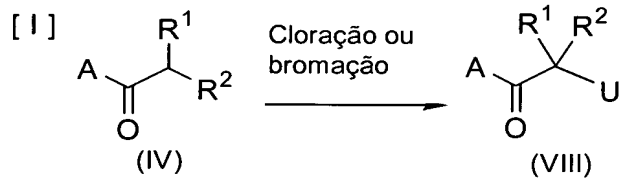
Dimetil-hidrazina para a reação (H) pode ser usada geralmente em uma quantidade de 1 a 30 mols, preferivelmente de 5 a 10 mols, por mol do composto da fórmula (IV).

A temperatura de reação para a reação (H) é geralmente de 20 a 150°C, preferivelmente de 50 a 120°C. O tempo de reação é geralmente de

5 a 200 horas, preferivelmente de 24 a 120 horas.

O composto da fórmula (VIII) a ser usado na reação acima (G) pode ser produzido pela seguinte reação (I).

REAÇÃO (I)



Na reação (I), A, R^1, R^2 e U são como definidos acima.

A reação (I) pode ser executada na presença de um agente de cloração ou um agente de bromação. O agente de cloração pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, cloro e N-clorossuccinimida. O agente de bromação pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, bromo, N-bromossuccinimida e tribrometo de feniltrimetil amônio.

A reação (I) pode ser executada geralmente na presença de um solvente. O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um hidrocarboneto aromático tal como benzeno, tolueno, xileno ou clorobenzeno; um hidrocarboneto alifático tal como tetracloreto de carbono, cloreto de metila, clorofórmio, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano ou ciclo-hexano; um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano, éter dietílico ou dimetoxietano; um éster tal como acetato de metila ou acetato de etila; um solvente aprótico polar tal como sulfóxido de dimetila, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona ou piridina; um ácido orgânico tal como ácido acético ou ácido propiônico; e água.

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

A base pode, por exemplo, ser di-isopropilamida de lítio. A base é usada em uma quantidade de 1 a 2 mols, preferivelmente de 1 a 1,2 mol, por mol do composto da fórmula (IV).

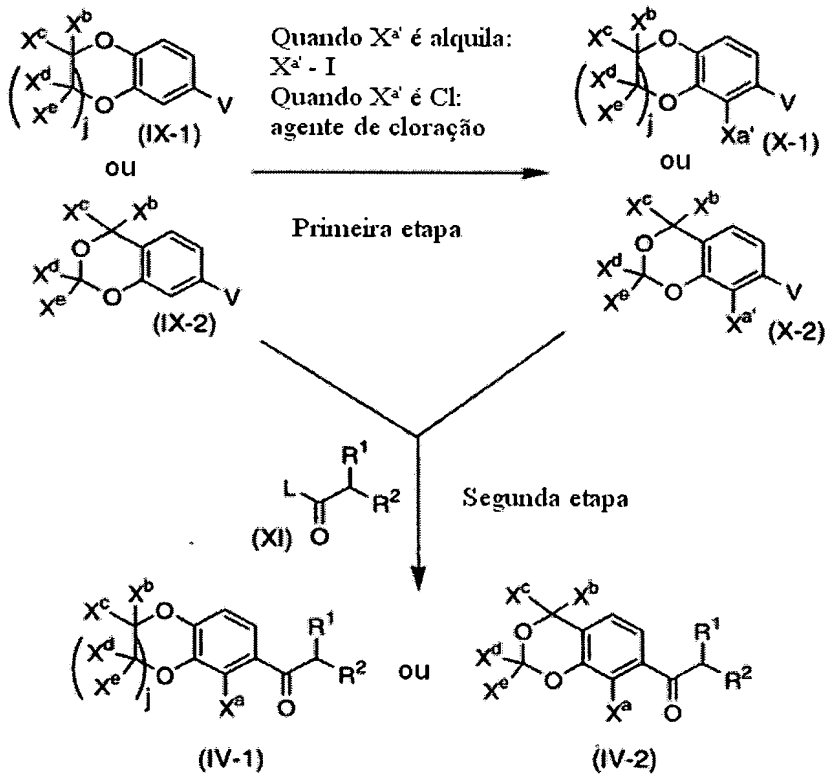
O ácido pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um ácido orgânico tal como ácido acético ou ácido propiô-

nico, e ácido de Lewis tal como cloreto de alumínio. O ácido é geralmente usado em uma quantidade catalítica. Além disso, um ácido orgânico como um solvente pode servir tanto como um solvente como um ácido de usado em excesso.

A temperatura de reação para a reação (I) é geralmente de -100 a 150°C, preferivelmente de -78 a 110°C. O tempo de reação de geralmente de 0,1 a 48 horas, preferivelmente de 0,5 a 24 horas. Entretanto, se ela for realizada na presença de uma base, a temperatura de reação é geralmente de -100 a 0°C, preferivelmente de -78 a -20°C, e o tempo de reação é geralmente de 0,1 a 12 horas, preferivelmente de 0,5 a 6 horas. Se ela for realizada na presença de um ácido, a temperatura de reação é geralmente de 0 a 150°C, preferivelmente de 20 a 110°C, e o tempo de reação é geralmente de 0,1 a 48 horas, preferivelmente, de 1 a 24 horas.

O composto da fórmula (IV) a ser usado na reação (C), (H) ou (I) acima é um composto conhecido, ou pode ser produzido pelas seguintes reações (J) ou (K) ou pelos métodos de acordo com eles.

REAÇÃO (J)



Na reação (J), R^1 e R^2 são como definidos acima, e X^a é um átomo de hidrogênio, um átomo de cloro ou alquila, $X^{a'}$ é um átomo de cloro ou alquila, cada um de X^b, X^c, X^d e X^e é um átomo de hidrogênio, flúor ou cloro, V é um átomo de bromo ou iodo, j é 0 ou 1, e L é um grupo de saída, especificamente um halogênio tal como um átomo de cloro ou um átomo de bromo; alcóxi tal como metóxi ou etóxi; dialquilamino tal como dimetilamino ou dietilamino; N-metóxi-N-metilamino, ou aziridinila que pode ser substituída por alquila.

A primeira etapa na reação (J) pode ser executada na presença de uma base e um solvente.

A base pode ser adequadamente selecionada a partir de um composto orgânico de lítio tal como di-isopropilamida de lítio. A base pode ser usada em uma quantidade de 1 a 2 mols, preferivelmente de 1 a 1,5 mol, por mol do composto da fórmula (IX-1) ou (IX-2).

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano e éter dietílico.

O agente de cloração a ser usado para a primeira etapa na reação (J) pode, por exemplo, ser N-clorossuccinimida.

A fórmula $X^{a'}$-I a ser usada para a primeira etapa na reação (J) pode ser usada em uma quantidade de 1 a 10 mols, preferivelmente de 1 a 5 mols, por mol do composto da fórmula (IX-1) ou (IX-2). Além disso, o agente de cloração a ser usado para a primeira etapa na reação (J) é usado em uma quantidade de 1 a 5 mols, preferivelmente de 1 a 3 mols, por mol do composto da fórmula (IX-1) ou (IX-2).

A primeira etapa na reação (J) pode ser executada, se necessário, na presença de um gás inerte. O gás inerte pode ser adequadamente selecionado a partir de, por exemplo, gás nitrogênio ou gás argônio.

A temperatura da reação para a primeira etapa na reação (J) é geralmente de -100 a 50°C, preferivelmente de -70 a 25°C. O tempo de reação é geralmente de 1 a 48 horas, preferivelmente de 1 a 20 horas.

A segunda etapa na reação (J) pode ser realizada, geralmente na presença de uma base e um solvente.

A base pode ser uma ou mais adequadamente selecionadas a partir de, por exemplo, compostos de lítio orgânicos tais como metil-lítio e n-butil-lítio; e compostos de Grignard tais como cloreto de isopropil magnésio. A base pode ser usada em uma quantidade de 1 a 2 mols, preferivelmente de 1 a 1,5 mols, por mol do composto de fórmula (IX-1), (IX-2), (X-1) ou (X-2).

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano e éter dietílico.

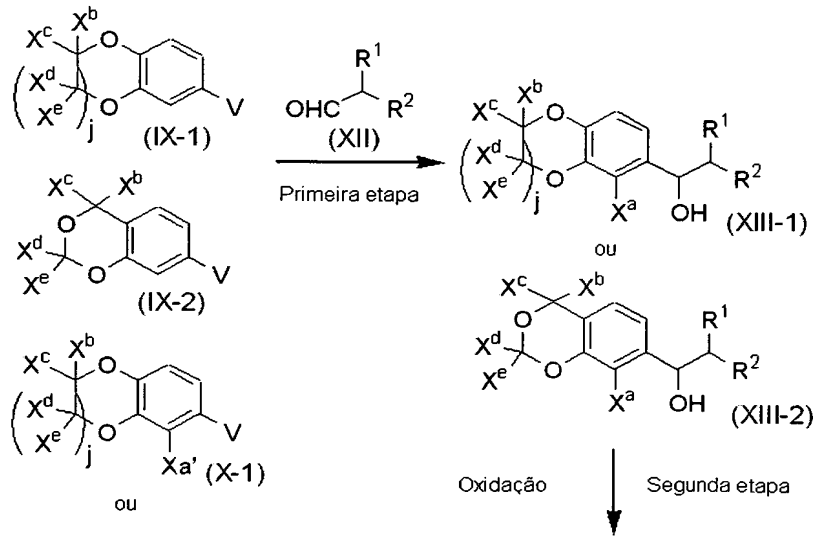
O composto da fórmula (XI) a ser usado para a segunda etapa na reação (J) é usado em uma quantidade de 1 a 3 mols, preferivelmente de 1 a 1,5 mols, por mol do composto da fórmula (IX-1), (IX-2), (X-1) ou (X-2).

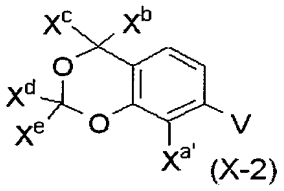
A segunda etapa na reação (J) pode ser executada, se necessário, na presença de um gás inerte. O gás inerte pode ser adequadamente selecionado a partir de, por exemplo, gás nitrogênio e gás argônio.

A temperatura de reação para a segunda etapa na reação (J) é geralmente de -100 a 50°C, preferivelmente de -70 a 25°C. O tempo de reação é geralmente de 1 a 48 horas, preferivelmente de 1 a 20 horas.

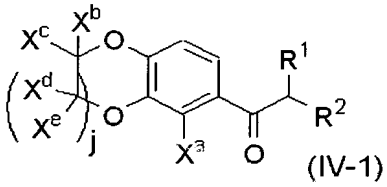
<u>REAÇÃO (K)</u>

[K]



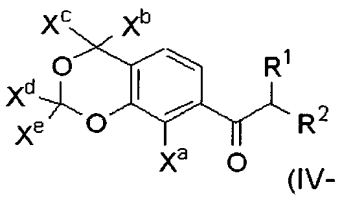


(X-2)



(IV-1)

ou



(IV-2)

Na reação (K), R^1, R^2, X^a, $X^{a'}$, X^b, X^c, X^d, X^e, V e j são como definidos acima.

A primeira etapa na reação (K) pode ser executada geralmente na presença de uma base e um solvente.

A base pode ser uma ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, compostos de lítio orgânico tais como metil-lítio e n-butil-lítio; e compostos de Grignard tais como cloreto de isopropil magnésio.

A base é usada em uma quantidade de 1 a 2 mols, preferivelmente de a 1 a 1,5 mol, por mol do composto da fórmula (IX-1), (IX-2), (X-1) ou (X-2).

O solvente pode ser qualquer solvente contanto que ele seja um solvente inerte para a reação. Por exemplo, ele pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, um éter tal como dioxano, tetra-hidrofurano e éter dietílico.

O composto da fórmula (XII) a ser usado para a primeira etapa na reação (K) é usado em uma quantidade de 1 a 3 mols, preferivelmente de 1 a 1,5 mol, por mol do composto da fórmula (IX-1), (IX-2), (X-1) ou (X-2).

A primeira etapa na reação (K) pode ser executada, se necessário, na presença de um gás inerte. O gás inerte pode ser adequadamente selecionado a partir de, por exemplo, gás nitrogênio e gás argônio.

A temperatura de reação para a primeira etapa na reação (K) é geralmente de -100 a 50°C, preferivelmente de -70 a 25°C. O tempo de reação é geralmente de 1 a 48 horas, preferivelmente de 1 a 20 horas.

A segunda etapa para a reação (K) pode ser geralmente executada na presença de um agente oxidante e um solvente.

O agente oxidante pode ser um ou mais adequadamente selecionados a partir de, por exemplo, clorocromato de piridínio e dióxido de manganês. O agente oxidante é usado em uma quantidade de 1 a 10 mols, preferivelmente de 1 a 3 mols, por mol do composto da fórmula (XIII-1) ou (XIII-2).

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

A temperatura de reação para a segunda etapa na reação (K) é geralmente de 0 a 150°C, preferivelmente de 20 a 100°C. O tempo da reação é geralmente de 0,5 a 24 horas, preferivelmente de 1 a 12 horas.

A composição da presente invenção é útil como uma composição fungicida capaz de controlar fungos nocivos em uma baixa dose, particularmente útil como uma composição agrícola ou de horticultura. Quando usada como uma composição agrícola ou de horticultura, a composição da presente invenção é capaz de controlar fungos nocivos tais como Oomicetos, Ascomicetos, Basidiomicetos, Deuteromicetos e particularmente eficaz para controlar fungos nocivos que pertencem a, por exemplo, Ascomicetos ou Deuteromicetos.

Os seguintes podem ser mencionados como exemplos específicos dos fungos nocivos acima.

Oomicetos podem, por exemplo, ser do gênero Phytophthora, tal como o patógeno da queima tardia da batata ou tomate (Phytophthora infestans), ou patógeno de haiiro-eki-byo de tomate (Phytophthora capsici); gênero Pseudoperonospora, tal como patógeno do míldio do pepino (Pseudoperonospora cubensis); gênero Plasmopara, tal como patógeno do míldio da uva (Plasmopara viticola); e gênero Pythium, tal como patógeno da queima

das mudas do arroz (Pythium graminicola), ou patógeno da podridão radicular do trigo (Pythium iwayamai).

Ascomicetos podem, por exemplo, ser do gênero Erysiphe, tal como patógeno do oídio do trigo (Erysiphe graminis); gênero Sphaerotheca, tal como patógeno do oídio do pepino (Sphaerotheca fuliginea), ou patógeno do oídio do morango (Sphaerotheca humuli); gênero Uncinula, tal como patógeno do míldio da uva (Uncinula necator); gênero Podosphaera, tal como patógeno do oídio da maçã (Podosphaera leucotricha); gênero Mycosphaerella, tal como patógeno da mancha da folha de Septoria de trigo (Mycosphaerella graminicola), patógeno da queima de Mycosphaerella de ervilha (Mycosphaerella pinodes), patógeno da mancha foliar da maçã (Mycosphaerella fijiensis, Mycosphaerella pomi), patógeno da sigatoka negra da banana (Mycosphaerella musicola), patógeno da mancha foliar circular o caqui (Mycosphaerella nawae), ou patógeno da mancha foliar de morango (Mycosphaerella fragariae); gênero Venturia, tal como patógeno da sarna da macieira (Venturia inaequalis), ou patógeno da sarna da pêra (Venturia nashicola); gênero Pyrenophora, tal como patógeno da mancha reticular da cevada (Pyrenophora teres), ou patógeno do estriado da cevada (Pyrenophora graminea); gênero Sclerotinia, tal como vários patógenos da doença de Sclerotinia (Sclerotinia Sclerotiorum) tal como patógeno da podridão de colo de feijão, patógeno da podridão de Sclerotinia de pepino, patógeno da podridão de Sclerotinia de repolho, patógeno da podridão de Sclerotinia de acelga, patógeno da podridão de Sclerotinia de pimenta vermelha, patógeno da podridão de Sclerotinia de pimentão, ou patógeno da podridão aquosa de cebola, patógeno da queima branca de Sclerotinia de trigo (Sclerotinia borealis), patógeno do syoryu-kinkaku de tomate (Sclerotinia minor), ou podridão de Sclerotinia de alfafa e patógeno da podridão da coroa (Sclerotinia trifoliorum); gênero Botryolinia, tal como patógeno da podridão de Sclerotinia do amendoim (Botryolinia arachidis); gênero Cochliobolus, tal como patógeno da mancha marrom do arroz (Cochliobolus miyabeanus); gênero Didymella, tal como o patógeno do crestamento gomoso do caule (Didymella bryoniae); gênero Gibberella, tal como patógeno da fusariose de trigo (Gibberella zeae,

Gibberella avenacea); gênero Elsinoe, tal como patógeno da antracnose de uva (Elsinoe ampelina), ou patógeno da verrugose de cítricos (Elsinoe fawcettii); gênero Diaporthe, tal como patógeno da melanose de cítricos (Diaporthe citri), ou patógeno do ramo inchado de uva (Diaporthe sp.); gênero Monilinia, tal como patógeno da queima de flor de maçã (Monilinia mali), patógeno da podridão parda do pêssego (Monilinia fructicola), patógeno da podridão parda da maçã ou pêra (Monilinia fructigena), ou patógeno da podridão parda do damasco (Monilinia fructicola, Monilinia laxa); e gênero Glomerella, tal como patógeno da podridão da uva madura (Glomerella cingulata).

Basidiomicetos podem, por exemplo, ser do gênero Rhizoctonia, tal como patógeno da queima da bainha do arroz (Rhizoctonia solani); gênero Ustilago, tal como patógeno o carvão do trigo (Ustilago nuda); gênero Puccinia, tal como patógeno da ferrugem de coroa da aveia (Puccinia coronata), patógeno da ferrugem marrom do trigo (Puccinia recondita), ou patógeno da ferrugem estriada do trigo (Puccinia striiformis); gênero Typhula, tal como patógeno da queima branca da cevada (Typhula incarnata, Typhula ishikariensisis); e gênero Phakopsora, tal como patógeno da ferrugem da soja (Phakopsora pachyrhizi, Phakopsora meibomiae).

Deuteromicetos podem, por exemplo, ser do gênero Septoria, tal como patógeno septoriose das glumas da trigo (Septoria nodorum), mancha da folha do trigo (Septoria tritici); gênero Botrytis, tal como vários patógenos do mofo cinzento (Botrytis cinerea) tal como patógeno do mofo cinzento da uva, patógeno do mofo cinzento de cítricos, patógeno do mofo cinzento de pepino, patógeno do mofo cinzento de tomate, patógeno do mofo cinzento do morango, patógeno do mofo cinzento de berinjela, patógeno do mofo cinzento de feijão, patógeno do mofo cinzento de feijão de adzuki, patógeno do mofo cinzento de soja patógeno do mofo cinzento de ervilha, patógeno do mofo cinzento de amendoim, patógeno do mofo cinzento da pimenta vermelho, patógeno do mofo cinzento do pimentão, patógeno do mofo cinzento da cebola, patógeno do mofo cinzento de statice, patógeno do mofo cinzento do cravo, patógeno da queima de Botrytis da rosa, patógeno do mofo cinzento de amor perfeito de jardim (garden pansy), ou patógeno de mofo cinzento de

girassol, patógeno da podridão cinza de cebola (Botrytis allii), gênero Pyricularia, tal como patógeno de brusone de arroz (Pyricularia oryzae); gênero Cercospora, tal como patógeno da mancha foliar de Cercospora de beterraba (Cercospora beticola), ou patógeno da mancha foliar de caqui (Cercospora kakivola); gênero Colletotrichum, tal como patógeno da antracnose de pepino (Colletotrichum orbiculare); gênero Alternaria, tal como patógeno da mancha foliar de Alternaria de maçã (patótipo Alternaria alternata de maçã), patógeno da mancha negra de pêra (patótipo Alternaria alternata de pêra japonesa), patógeno do crestamento precoce de batata ou tomate (Alternaria solani), patógeno da mancha foliar de Alternaria de repolho ou acelga (Alternaria brassicae), patógeno da mancha de fuligem de Alternaria repolho (Alternaria brassicola), patógeno da mancha foliar de Alternaria de cebola ou cebola galega (Alternaria porri); gênero Pseudocercosporella, tal como patógeno da acama do trigo (Pseudocercosporella herpotrichoides); gênero Pseudocercospora, tal como patógeno da mancha foliar de uva (Pseudocercospora vitis); gênero Rhynchosporium, tal como patógeno da escaldadura de cevada (Rhynchosporium secalis); gênero Cladosporium, tal como patógeno escabiose de pêssego (Cladosporium carpophilum); gênero Phomopsis, tal como patógeno da podridão de Phomopsis de pêssego (Phomopsis sp.); gênero Gloeosporium, tal como patógeno da antracnose de caqui (Gloeosporium kaki); gênero Fulvia, tal como patógeno do mofo da folha de tomate (Fulvia fulva); gênero Corynespora, tal como patógeno da mancha foliar de Corynespora de pepino (Corynespora cassiicola); e gênero Cylindrosporum, tal como patógeno de kappan-byo de tomate (Cylindrosporum sp.).

A composição da presente invenção é capaz de controlar os vários fungos nocivos acima e assim é capaz de controlar preventiva ou curativamente várias doenças. Particularmente, a composição da presente invenção é eficaz para controlar várias doenças. Particularmente, a composição da presente invenção é eficaz para controlar várias doenças que são problemáticas no campo agrícola ou de horticultura, tal como ferrugem, mancha marrom, queima da bainha, ou tombamento de arroz (Oryza sativa, etc.); oídio, escabiose, ferrugem marrom, ferrugem estriada, mancha reticular, es-

triado, mofo branco, queima branca, carvão, acama, escaldadura, mancha foliar, ou septoriose das glumas de cereais (Hordeum vulgare, Tricum aestivum, etc.); melanose ou escabiose de cítricos (Citrus spp., etc.); queima de flores, oídio, melanose, mancha foliar de Alternaria ou escabiose de maçã (Malus pumila); escabiose ou mancha negra de pêra (Pyrus serotina, Pyrus ussuriensis, Pyrus communis); podridão parda, escabiose ou podridão de Phomopsis de pêssego (Prunus persica, etc.); antracnose, podridão madura, mancha foliar, ramo inchado, oídio ou míldio de uva (Vitis vinifera spp., etc.); antracnose, mancha foliar circular ou mancha foliar de Cercospora de caqui japonês (Diospyros kaki, etc.); antracnose, oídio, crestamento gomoso, mancha foliar de corynespora ou míldio de cucúrbita (Cucumis melo, etc.); crestamento precoce, haiiro-eki-byo, mofo foliar, ou crestamento tardio de tomate (Lycopersicon esculentum); sigatoka negra de banana (Musa sapientum, etc.); mancha foliar de Cercospora de beterraba (Beta vulgaris var. saccharifera, etc.); queima de Mycosphaerella de ervilha (Pisum sativum); vários patógenos de doença de Alternaria de vegetais crucíferos (Brassica sp., Raphanus sp., etc); crestamento tardio ou crestamento precoce de batata (Solanum tuberosum); oídio ou mancha foliar de morango (Fragaria, etc.); e mofo cinzento ou doença causada por Sclerotinia de vários cultivos tal como ervilhas, vegetais, frutas ou flores. Dentre eles, a composição da presente invenção é particularmente eficaz para controlar doenças de plantas causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos, isto é, várias doenças de plantas tais como mofo cinzento, doenças causadas por Sclerotinia, oídio, ferrugem, septoriose das glumas, ou doenças de plantas causadas por Alternaria.

Especificamente, a composição da presente invenção é particularmente eficaz contra vários mofos cinzentos de pepino (Cucumis sativus), feijão (Phaseolus vulgaris), feijão adzuki (Vigna angularis), soja (Glycine max), ervilha, amendoim, (Arachis hypogaea), tomate, morango, berinjela, (Solanum melongena), pimenta vermelha (Capsicum annuum), pimentão (Capsicum annuum), alface (Lactuca sativa), cebola (Allium cepa), uva, cítricos, Estatice (Limonium spp.), cravo (Dianthus spp.), rosa (Rosa spp.), amor perfeito (Viola, etc.) ou girassol (Helianthus annuus); doenças causadas por

Sclerotinia, de feijão (Phaseolus vulgaris), pepino (Cucumis sativus), repolho (Brassica oleracea var. capitata), acelga (Brassica rapa), pimenta vermelha (Capsicum annuum), pimentão (Capsicum annuum) ou cebola (Allium cepa); oídio de trigo (Triticum aestivum), pepino (Cucumis sativus), morango, uva ou maçã (Malus pumila var. domestica); septoriose das glumas de trigo; septoriose de Alternaria de maçã; mancha negra de peras; crestamento precoce de batata e mancha foliar de Alternaria de repolho ou acelga.

Além disso, a composição da presente invenção é eficaz também para o controle preventivo ou curativo de doenças do solo causadas por patógenos de planta tais como Fusarium, Pythium, Rhizoctonia, Verticillium e Plasmodiophora.

Ainda adicionalmente, a composição da presente invenção é eficaz também para controlar vários patógenos resistentes a fungicidas tais como benzimidazóis, dietofencarb, estrobilurinas, dicarboximidas, fenilamidas, fluazinam, quinoxifeno, ciflufenamida, inibidores da biossíntese de ergosterol e inibidores de biossíntese de melanina.

Além disso, a composição da presente invenção tem uma propriedade sistêmica penetrante, e quando um pesticida que contém a composição da presente invenção é aplicado ao solo, é possível controlar fungos nocivos em troncos e folhas ao mesmo tempo em que controla fungos nocivos no solo.

A composição da presente invenção, é geralmente formulada ao misturar o derivado de amida de ácido carboxílico representado pela fórmula (I) ou um sal desse com vários adjuvantes agrícolas e usada na forma de uma formulação tal como uma névoa, grânulos, grânulos dispersíveis em água, pó molhável, concentrado de suspensão à base de água, um concentrado de suspensão à base de óleo, grânulos solúveis em água, um concentrado emulsificável, um concentrado solúvel, uma pasta, um aerossol, ou uma formulação de volume ultrabaixo. Entretanto, contanto que ela seja adequada para a finalidade da presente invenção, ela pode ser formulada em qualquer tipo de formulação que é comumente usada nesse campo. Tais adjuvantes agrícolas incluem veículos sólidos tais como terra de diatomá-

ceas, cal extinta, carbonato de cálcio, talco, carbono branco, caulim, bentonita, uma mistura de caulinita e sericita, argila, carbonato de sódio, bicarbonato de sódio, mirabilita, zeolita e amido; solventes tais como água, tolueno, xileno, solvente nafta, dioxano, acetona, isoforona, metil isobutil cetona, clorobenzeno, ciclo-hexano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona, e álcool; tensoativos aniônicos e espalhadores tais como um sal de ácido graxo, um benzoato, um alquilsulfossuccinato, um dialquilsulfossuccinato, um policarboxilato, um sal de éster de ácido alquilsulfúrico, um sulfato de alquila, um sulfato de alquilarila, um sulfato de éter diglicólico de alquila, um sal de éster de ácido sulfúrico de álcool, um sulfonato de alquila, um sulfonato de alquilarila, um sulfonato de arila, um sulfonato de lignina, um dissulfonato de éter de alquildifenila, um sulfonato de poliestireno, um sal de éster de ácido alquilfosfórico, um fosfato de alquilarila, um fosfato de estirilarila, um sal de éster de ácido sulfúrico de éter de alquila de polioxietileno, um sulfato de éter de alquilarila de polioxietileno, um sal de éster de ácido sulfúrico de éter de alquilarila de polioxietileno, um fosfato de éter de alquila de polioxietileno, um sal de éster de ácido fosfórico de alquilarila de polioxietileno, e um sal de um condensado de sulfonato de naftaleno com formalina; tensoativos não iônicos e espalhadores tais como éster de ácido graxo de sorbitano, um éster de ácido graxo de glicerina, um poliglicerídeo de ácido graxo, um éter poliglicólico de álcool de ácido graxo, um acetileno glicol, álcool acetileno, um polímero em bloco de oxialquileno, um éter de alquila de polioxietileno, um éter de alquilarila de polioxietileno, éter de estirilarila de polioxietileno, um éter de alquila de polioxietileno, um polietileno glicol, um éster de ácido de graxo de polioxietileno, um éster de ácido graxo de polioxietileno sorbitano, um éster de ácido graxo de polioxietileno glicerina, um óleo de mamona de polioxietileno hidrogenado, e um éster de ácido graxo de polioxipropileno; e óleos vegetais e minerais tais como óleo de oliva, óleo de palmeira, óleo de mamona, óleo de palma, óleo de camélia, óleo de coco, óleo de gergelim, óleo de milho, óleo de farelo de arroz, óleo de amendoim, óleo de semente de algodão, óleo de soja, óleo de colza, óleo de linhaça, óleo de tungue, e parafinas líquidas. Cada um dos componentes

como tais adjuvantes pode ser um ou mais adequados selecionados para uso, contanto que o propósito da presente invenção possa ser assim atingido. Além disso, vários aditivos que são comumente usados, tais como carga, espessante, um agente antissedimentação, um agente anticongelante, um estabilizador de dispersão, um agente redutor de fitotoxicidade, e um agente antimofo também podem ser empregados.

A proporção em peso do derivado de amida de ácido carboxílico representado pela fórmula (I) ou um sal desse em relação aos vários adjuvantes agrícolas é geralmente entre 0,001:99,999 a 95:5, preferivelmente entre 0,005:99,995 a 90:I0.

Na aplicação real de tal formulação ela pode ser usada como está ou pode ser diluída para uma concentração predeterminada com um diluente tal como água e vários dispersantes, por exemplo, tensoativos, óleos vegetais ou óleos minerais, podem ser adicionados a ela conforme o caso.

A aplicação da composição da presente invenção não pode ser geralmente definida, já que ela varia dependendo das condições climáticas, do tipo da formulação, das plantas de cultivo a serem tratadas, da estação de aplicação, do local de aplicação, dos tipos ou estados de germinação dos fungos nocivos e dos tipos ou grau de surgimento das doenças. Entretanto, ela é geralmente aplicada em uma concentração do ingrediente ativo estando entre 0,1 a 10.000 ppm, preferivelmente entre 1 a 2000 ppm no caso de tratamento de folhagens e sua dose pode ser tal que o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse está geralmente de 0,1 a 50.000 g, preferivelmente de 1 e 30.000 g por hectare. No caso de tratamento de solo, ele é geralmente aplicado em uma dose tal que o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, está de 10 a 100.000 g, preferivelmente de 200 a 20.000 g por hectare.

A formulação que contém a composição da presente invenção, ou um produto diluído disso, pode ser aplicada por um método de aplicação que é comumente usado, tal como dispersão (dispersão, aspersão, pulverização, atomização, difusão em grão ou aplicação sobre a superfície da á-

gua), aplicação no solo (tal como mistura ou irrigação) ou aplicação na superfície (tal como cobertura, cobertura com pó ou revestimento). Além disso, ela pode ser aplicada também pelo assim chamado volume ultra baixo. Nesse método, a formulação pode conter 100% de ingrediente ativo.

A composição da presente invenção pode ser misturada ou pode ser usada em combinação com outros químicos agrícolas, fertilizantes ou agentes redutores de fitotoxicidade, através dos quais atividades ou efeitos sinérgicos podem ser algumas vezes obtidos. Tais outros produtos químicos agrícolas podem ser, por exemplo, um herbicida, um inseticida, um acaricida, um nematicida, um pesticida de solo, um fungicida, um agente antiviral, uma isca, um antibiótico, um hormônio de planta ou um agente que regula o crescimento da planta. Especialmente, quando uma composição fungicida mista que tem o derivado de amida do ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse misturado ou usado em combinação com um ou mais de outros compostos de ingredientes fungicidamente ativos, a taxa de aplicação, o tempo de aplicação, as atividades fungicidas, etc. podem ser melhoradas nas direções preferidas. Aqui, o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse, e o composto de ingrediente ativo de outro fungicida podem ser formulados separadamente tal que eles podem ser misturados para uso no momento da aplicação, ou eles podem ser formulados juntos para uso. A presente invenção inclui tal composição fungicida mista.

A taxa de mistura do derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse, com outro composto de ingrediente fungicidamente ativo geralmente não pode ser definida, já que ela varia dependendo das condições do clima, dos tipos de formulação, dos cultivos a serem tratadas, do tempo de aplicação, do local de aplicação, do tipo ou estado germinativo dos fungos nocivos, dos tipos ou estados das doenças, etc., mas geralmente está dentro da faixa de 1:300 a 300:1, preferivelmente 1:100 a 100:1, em peso. Além disso, a dose para aplicação pode ser tal que a quantidade total dos compostos ativos é entre 0,1 a 70.000 g, preferivelmente de 1 a 30.000 g por hectare. A presente invenção inclui um método para controlar fungos nocivos pela aplicação de tal composição fungicida mista.

O composto de ingrediente ativo (nome comum; incluindo alguns que estão sob pedido ou código de teste da associação de proteção a planta do Japão) do fungicida em tal outro produto químico agrícola, pode ser, por exemplo:

um composto de anilinopirimidina tal como Mepanipirim, Pirimetanila ou Ciprodinila;

um composto de piridinamina tal como Fluazinam;

um composto de azol tal como Triadimefon, Bitertanol, Triflumizol, Etaconazol, Propiconazol, Penconazol, Flusilazol, Miclobutanila, Ciproconazol, Tebuconazol, Hexaconazol, Furconazol-cis, Procloraz, Metconazol, Epoxiconazol, Tetraconazol, fumarato de Oxpoconazol, Sipconazol, Protioconazol, Triadimenol, Flutriafol, Difenoconazol, Fluquinconazol, Fenbuconazol, Bromuconazol, Diniconazol, Triciclazol, Probenazol, Simeconazol, Pefurazoato, Ipconazol ou Imibenconazol;

um composto de quinoxalina tal como Quinometionato;

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

um composto orgânico clorado tal como Ftalida, Clorotalonila ou Quintozeno;

um composto de imidazol tal como Benomila, Tiofanato-Metila, Carbendazim, Tiabendazol, Fuberiazol ou Ciazofamid;

um composto de ciano acetamida tal como Cimoxanil;

um composto de fenilamida tal como Metalaxila, Metalaxil-M, Oxadixila, Mefenoxam, Ofurace, Benalaxila, Benalaxila-M (outro nome; Kiralaxila ou Chiralaxila), Furalaxila ou Ciprofuram;

um composto de ácido sulfênico tal como Diclofluanid;

um composto de cobre tal como hidróxido de cobre ou Oxina Cobre;

um composto de isoxazol tal como Himexazol;

um composto orgânico de fósforo tal como Fosetil-Al, Tolcofos-Metila, O,O-di-isopropilfosforotioato de S-benzila, S,S-difenilfosforoditioato de O-etila ou fosfonato de etil-hidrogênio de alumínio;

um composto de N-halogenotioalquila tal como Captan, Captafol ou Folpet;

um composto de dicarboxi-imida tal como Procimidona, Iprodiona ou Vinclozolin;

um composto de benzanilida tal como Flutolanila, Mepronila, Zoxamid ou Tiadinila;

um composto de anilida tal como Carboxin, Oxicarboxin, Tiflu-zamida, MTF-753 (Pentiopirad) ou Boscalid;

um composto de piperazina tal como Triforina;

um composto de piridina tal como Pirifenox;

um composto de carbinol tal como Fenarimol ou Flutriafol;

um composto de piperidina tal como Fenpropidine;

um composto de morfolina tal como Fenpropimorf ou Tridemorf;

um composto orgânico de estanho tal como Hidróxido de Fentin ou Acetato de Fentin;

um composto de ureia tal como Pencicuron;

um composto de ácido cinâmico tal como Dimetomorf ou Flumorf;

um composto de fenilcarbamato tal como Dietofencarb;

um composto de cianopirrol tal como Fludioxonila ou Fenpiclonila;

um composto de estrobilurina tal como Azoxistrobina, Cresoxim-Metila, Metominofen, Trifloxistrobina, Picoxistrobina, Orizastrobina, Dimoxistrobina, Piraclostrobina, Fluoxastrobina ou Fluacripirina;

um composto de oxazolidinona tal como Famoxadona;

um composto de tiazolcarboxamida tal como Etaboxam;

um composto de sililamida tal como Siltiofam;

um composto de carbamato de amida de aminoácido tal como Iprovalicarb ou isopropil-Bentiavalicarb;

um composto de imidazolidina tal como Fenamidona;

um composto de hidroxianilida tal como Fenexamida;

um composto de benzenossulfonamida tal como Flusulfamida;

um composto oxima éter tal como Ciflufenamida;

um composto de fenoxiamida tal como Fenoxanila;

um antibiótico tal como Validamicina, Kasugamicina ou Polioxinas;

um composto de guanidina tal como Iminoctadina;

outro composto tal como Isoprotiolano, Piroquilon, Diclomezina, Quinoxifen, Cloridrato de Propamocarb, Espiroxamina, Cloropicrina, Dazomet, Metam-sódio, Metrafenona, UBF-307, Diclocimet, Proquinazid, Amisulbrom (outro nome: Amibromdol), KIF-7767 (KUF-1204, Piribencarb metila, Mepiricarb), Syngenta 446510 (Mandipropamid, Dipromandamid) ou Fluopicolida.

O composto de ingrediente ativo (nome comum; incluindo alguns que estão sob pedido) de inseticida, acaricida, nematicida ou pesticida de solo em tal outro químico agrícola pode ser, por exemplo:

um composto de fosfato orgânico tal como Profenofos, Diclorvos, Fenamiphos, Fenitrotion, EPN, Diazinon, Clorpirifos-metila, Acefato, Protiofos, Fostiazato, Fosfocarb, Cadusafos, Dissulfoton, Clorpirifos, Demeton-S-metila, Dimetoato, Metamidofos ou Imiciafos;

um composto de carbamato tal como Carbarila, Propoxur, Aldicarb, Carbofuran, Tiodicarb, Metomila, Oxamila, Etiofencarb, Pirimicarb, Fenobucarb, Carbosulfan ou Benfuracarb;

um derivado de nelicetoxina tal como Cartap, Tiociclam ou Bensultap;

um composto organo-clorado tal como Dicofol, Tetradifon ou Endosulfan;

um composto de metal orgânico tal como Óxido de Fenbutatin;

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

um composto de benzoil ureia tal como Diflubenzuron, Clorfluazuron, Teflubenzuron, Flufenoxuron, Lufenuron ou Novaluron;

um composto semelhante ao hormônio juvenil tal como Metopreno, Piriproxifen ou Fenoxicarb;

um composto de piridadinona tal como Piridaben;

um composto de pirazol tal como Fenpiroximato, Fipronila, Tebufenpirad, Etiprol, Tolfenpirad, Acetoprol, Pirafluprol ou Piriprol;

um composto neonicotinoide tal como Imidacloprida, Nitenpiram, Acetamiprida, Tiacloprida, Tiametoxam, Clotianidina ou Dinotefuran;

um composto de hidrazina tal como Tebufenozide, Metoxifenozida, Cromafenozida ou Halofenozida;

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

outros compostos tais como Flonicamid, Buprofezin, Hexitiazox, Amitraz, Clordimeform, Silafluofen, Triazamato, Pimetrozina, Pirimidifen, Clorfenapir, Indoxacarb, Acequinocila, Etoxazol, Ciromazina, 1,3-dicloropropeno, Diafentiuron, Benclotiaz, Flufenerim, Piridalila, Espirodiclofen, Bifenazato, Espiromesifen, Espirotetramat, Propargite, Clofentezina, Fluacripirim, Metaflumizona, Flubendiamida, Ciflumetofen, Clorantraniliprol, Cienopirafen, Pirifluquinazon ou Fenazaquin.

Além disso, um pesticida microbiano tal como agente BT, um agente de vírus patogênico de inseto, fungos entomopatogênicos ou fungos nematófagos;

um antibiótico tal como Avermectina, Benzoato de Emamectina, Milbemectina, Espinosad, Ivermectina ou Lepimectina;

um produto natural tal como Azadiractina ou Rotenona.

Modalidades preferidas da presente invenção são as seguintes. Entretanto, deve ser compreendido que a presente invenção não está restrita a tais modalidades específicas.

(1) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que B é 2-piridila que pode ser substituída.

(2) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila que pode ser substituída por X, benzodioxolanila que pode ser substituída por X, ou benzodioxanila que pode ser substituída por X; B é 2-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alqui-

nila, haloalquinila, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, fenila substituída por Y, fenóxi substituído por Y, piridila substituída por Y, ou piridilóxi substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila ou alcóxi.

(3) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B é 2-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(4) A composição fungicida de acordo com (3) acima, em que A é fenila substituída por pelo menos dois substituintes selecionados a partir do grupo que consiste em halogênio, alquila ou alcóxi.

(5) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que B é 3-piridila que pode ser substituída.

(6) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila que pode ser substituída por X, benzodioxolanila que pode ser substituída por X, ou benzodioxanila que pode ser substituída por X; B é 3-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, fenila substituída por Y, fenóxi substituído por Y, piridila substituída por Y, ou piridilóxi substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila ou alcóxi.

(7) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B é 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e

R^2 é alquila.

(8) A composição fungicida de acordo com (7) acima, em que A é fenila substituída por pelo menos dois substituintes selecionados a partir do grupo que consiste em halogênio, alquila e alcóxi.

(9) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é benzodioxolanila substituída por halogênio ou alquila; B é 2 ou 3 piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(10) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é benzodioxanila substituída por halogênio ou alquila; B é 2 ou 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(11) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila 2-alquil-3-halogênio-substituída; B é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(12) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila 2-alquil-4-halogênio-substituída; B é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(13) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila 2-alquil-4-alcóxi-substituída; B é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(14) Uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo, em que A é fenila 4-alcóxi-substituída; B é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(15) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso.

(16) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal desse, em que B é 2-piridila que pode ser substituída.

(17) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal disso.

(18) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal disso, em que A^a é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B^a é 2-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(19) O derivado de amida de ácido carboxílico ou um sal disso de acordo com (18) acima, em que A^a é fenila substituída por pelo menos dois substituintes selecionados a partir do grupo que consiste em halogênio, alquila ou alcóxi.

(20) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal disso, em que A^a é fenila 2-alquil-3-halogênio-substituída; B^a é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(21) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal disso, em que A^a é fenila 2-alquil-4-halogênio-substituída; B^a é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(22) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal disso, em que A^a é fenila 2-alquil-4-alcóxi-substituída; B^a é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(23) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal desse, em que A^a é fenila 4-alcóxi-substituída; B^a é 2-piridila substituída por haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(24) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso, em que B é 3-piridila que pode ser substituída.

(25) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso, em que A é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B é 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(26) O derivado de amida de ácido carboxílico ou um sal disso de acordo com (25) acima, em que A^a é fenila substituída por pelo menos

dois substituintes selecionados a partir do grupo que consiste em halogênio, alquila e alcóxi.

(27) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso, em que A é benzodioxolanila substituída por halogênio ou alquila; B é 2 ou 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; cada um de R^1 e R^2 é alquila.

(28) Um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso, em que A é benzodioxanila substituída por halogênio ou alquila; B é 2- ou 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; e cada um de R_1 e R_2 é alquila.

(29) Uma composição fungicida mista que compreende um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso, e outro composto de ingrediente fungicidamente ativo, como ingredientes ativos.

(30) A composição fungicida mista de acordo com (29) acima, em que o dito outro composto de ingrediente fungicidamente ativo é pelo menos um membro selecionado a partir do grupo que consiste em um composto de anilinopirimidina, um composto de piridinamina, um composto de azol, um composto de quinoxalina, um composto de ditiocarbamato, um composto orgânico de cloro, um composto de imidazol, um composto de ciano acetamida, um composto de fenilamida, um composto de ácido sulfênico, um composto de cobre, um composto de isoxazol, um composto orgânico de fósforo, um composto de N-halogenotioalquila, um composto de dicarboximida, um composto de benzanilida, um composto de anilida, um composto de piperazina, um composto de piridina, um composto de carbinol, um composto de piperidina, um composto de morfolina, um composto orgânico de estanho, um composto de ureia, um composto de ácido cinâmico, um composto de fenilcarbamato, um composto de cianopirrol, um composto de estrobilurina, um composto de oxazolidinona, um composto de tiazolcarboxamida, um composto de sililamida, um composto de carbamato de amida de aminoácido, um composto de imidazolidina, um composto de hidroxianilida, um composto de benzenossulfonamida, um composto de éter de oxima, um compos-

to de fenoxiamida, um antibiótico, um composto de guanidina, Isoprotiolana, Piroquilon, Diclomezina, Quinoxifen, Cloridrato de Propamocarb, Espiroxamina, Cloropicrina, Dazomet, Metam-sódio, Metrafenona, UBF-307, Diclocimet, Proquinazid, Amisulbrom, KIF-7767, Syngenta 446510 e Fluopicolida.

(31) A composição fungicida mista de acordo com (29) acima, em que o dito outro composto de ingrediente fungicidamente ativo é pelo menos um membro selecionado a partir do grupo que consiste em um composto de anilinopirimidina, um composto de piridinamina, um composto de azol, um composto de ditiocarbamato, um composto orgânico de cloro, um composto de imidazol, um composto de cobre, um composto de dicarboximida, um composto de anilida, um composto de piperazina, um composto de piridina, um composto de carbinol, um composto de fenilcarbamato, um composto de cianopirrol, um composto de estrobilurina, um composto de hidroxianilida e KIF-7767.

(32) A composição fungicida mista de acordo com o (29) acima, em que o dito outro composto de ingrediente fungicidamente ativo é pelo menos um membro selecionado a partir do grupo que consiste em Mepanipirim, Pirimetanila, Ciprodinila, Fluazinam, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizol, Etaconazol, Propiconazol, Penconazol, Flusilazol, Miclobutanila, Ciproconazol, Tebuconazol, Hexaconazol, Furconazol-cis, Procloraz, Metconazol, Epoxiconazol, Tetraconazol, fumarato de Oxpoconazol, Sipconazol, Protioconazol, Triadimenol, Flutriafol, Difenoconazol, Fluquinconazol, Fenbuconazol, Bromuconazol, Diniconazol, Triciclazol, Probenazol, Simeconazol, Pefurazoato, Ipconazol, Imibenconazol, Maneb, Zineb, Mancozeb, Policarbamato, Metiram, Propineb, Ftalida, Clorotalonila, Quintozeno, Benomila, Tiofanato-Metila, Carbendazim, Ciazofamid, hidróxido cúprico, Oxina Cobre, Procimidona, Iprodiona, Vinclozolin, Boscalid, Dietofencarb, Fludioxonila, Fenpiclonila, Azoxistrobina, Cresoxim-Metila, Metominofen, Trifloxistrobina, Picoxistrobina, Orizastrobina, Dimoxistrobina, Piraclostrobina, Fluoxastrobina, Fluacripirina, Fenexamid, Polioxinas, Iminoctadina, MTF-753 e KIF-7767.

(33) Um método para controlar fungos nocivos, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida do ácido carboxí-

lico da fórmula (I) acima ou um sal desse.

(34) Um método para controlar fungos nocivos, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida do ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal disso.

(35) O método para controlar fungos nocivos de acordo com (33) ou (34) acima, em que os fungos nocivos são Ascomicetos ou Deuteromicetos.

(36) Um método para controlar doenças de plantas, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso.

(37) Um método para controlar doenças de plantas, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) acima ou um sal desse.

(38) O método para controlar doenças de plantas de acordo com (36) ou (37) acima em que as doenças de planta são doenças de plantas causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos.

(39) O método para controlar doenças de plantas de acordo com (38) acima, em que as doenças de planta causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos são mofo cinzento, doenças causadas por Sclerotinia, míldio, brusone, mancha das glumas, ou doenças de planta causadas por Alternaria.

(40) Um método para proteger plantas de cultivo, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso.

(41) Um método para proteger cultivos de plantas, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I-a) ou um sal disso.

(42) Um método para melhorar o rendimento dos cultivos, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida do ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso.

(43) Um método para melhorar o rendimento dos cultivos, que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácí-

do carboxílico da fórmula (I-a) ou um sal disso.

Agora, a presente invenção será descrita em mais detalhes com referência aos Exemplos. Entretanto, deve ser compreendido que a presente invenção não está restrita a eles de nenhuma maneira. Primeiramente, preparações para o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse serão descritas.

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 1

Preparação de N-[(3'-difluorometóxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-21 mencionado posteriormente)

(1) Um reagente de Grignard preparado pelo uso de 0,75 g de magnésio, 4,46 g de 2-bromopropano e 24 ml de éter dietílico anidro, foi adicionado por gotejamento a uma mistura compreendendo 4,09 g de 3-difluorometoxibenzonitrila e 20 ml de éter dietílico anidro. Após o término da adição por gotejamento, a mistura foi reagida em temperatura ambiente por 27 horas. A mistura de reação foi colocada em água gelada, e ácido sulfúrico a 6N foi adicionado para tornar a mistura fracamente ácida, seguido por agitação por 0,5 hora. A mistura foi extraída com éter dietílico e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/19), para se obter 2,04 g de 3-difluorometoxi-isobutirofenona. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/300 MHz)

1,23(d,6H), 3,52(m,1H), 6,56(t,1H), 7,32(dd,1H), 7,48(t,1H), 7,70 (s,1H), 7,80(d,1H)

(2) 3,58 g de tribrometo de feniltrimetilamônio foram adicionados a uma mistura compreendendo 2,04 g de 3-difluorometoxi-isobutirofenona e 30 ml de tetra-hidrofurano, seguido por uma reação por 2 horas à temperatura ambiente. A mistura de reação foi filtrada e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 2,79 g de α-bromo-3-difluorometoxi-isobutirofenona oleosa.

(3) 1,24 g de azida sódica foi adicionado à mistura que compreende 2,79 g de α-bromo-3-difluorometoxi-isobutirofenona e 35 ml de sulfóxido de dimetila, seguido por uma reação por 1 hora a 50°C. A mistura de reação foi colocada em água e extraída com acetato de etila, seguido por lavagem com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9), para se obter 2,21 g de α-azida-3-difluorometoxi-isobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/300 MHz)

1,61 (s, 6H), 6,56 (t,1H), 7,34 (dd,1H), 7,48 (t,1H), 7,86 (s,1H), 7,98 (d,1H)

(4) Uma mistura compreendendo 2,18 g de α-azida-3-difluorometoxi-isobutirofenona, 35 ml de metanol e 0,109 g de paládio carbono a 5% foi reagida por 1,5 hora à temperatura ambiente em atmosfera de hidrogênio. A mistura de reação foi filtrada através de celite e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. Ao resíduo, foi adicionado acetato de etila e o gás de cloreto de hidrogênio foi introduzido sob resfriamento com gelo, seguido pela concentração sob pressão reduzida para se obter 1,76 g de cloridrato de α-amino-3-difluorometoxi-isobutirofenona.

(5) 0,33 g de trietilamina foi adicionado a uma mistura compreendendo 0,3 g de cloridrato de α-amino-3-difluorometoxi-isobutirofenona e 10 ml de 1,2-dicloroetano e uma mistura compreendendo 0,26 g de cloreto de ácido 3-trifluorometilpicolínico e 5 ml de 1,2-dicloroetano foi adicionada por gotejamento sob resfriamento com gelo. Após o término da adição por gotejamento, a mistura foi reagida em temperatura ambiente por 2 horas. A mistura de reação foi lavada com água e a camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 2/3) para se obter 0,35 g do produto desejado que tem um ponto de fusão entre 81 e 83°C. Os dados do

espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,80(s,6H), 6,48(t,1H), 7,21(dd,1H), 7,36(t,1H), 7,57(dd,1H), 7,78 (s,1H), 7,87(d,1H), 8,10(d,1H), 8,18(s,1H), 8,75(d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 2

Preparação de N-[(3',4'-dicloro-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-9 mencionado posteriomente)

(1) Uma mistura compreendendo 10,0 g de cloreto de 3,4-diclorobenzoíla, 9,31 g de 2-bromoisobutirato de etila e 90 ml de éter dietílico anidro foi adicionada por gotejamento a 3,12 g de zinco, em uma atmosfera de nitrogênio, seguido por uma reação por 15 horas sob refluxo. A mistura de reação foi filtrada através de celite e o filtrado foi lavado com ácido sulfúrico a 20% e então com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/19) para se obter 8,7 g de 2-(3',4'-diclorobenzoil)isobutirato de etila oleoso. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,11 (t,3H), 1,52 (s,6H), 4,14 (q,2H), 7,48 (d,1H), 7,63 (dd,1H), 7,96 (d,1H)

(2) Uma mistura compreendendo 8,7 g de 2-(3',4'-diclorobenzoil) isobutirato de etila, 14,2 ml de ácido sulfúrico, 14,2 ml de água e 40 ml de ácido acético foi reagida por 15 horas sob refluxo. A mistura de reação foi colocada em gelo e água e extraída com acetato de etila, seguido por lavagem com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/19) para se obter 6,47 g de 3,4-dicloroisobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,21(d,6H), 3,46(m,1H), 7,55(d,1H), 7,79(dd,1H), 8,02(d,1H)

(3) 9,32 g de tribrometo de feniltrimetilamônio foram adicionados a uma mistura compreendendo 6,47 g de 3,4-dicloroisobutirofenona e 100 ml de tetra-hidrofurano, seguido por uma reação por 4 horas em temperatura ambiente. A mistura de reação foi filtrada, e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 6,39 g de α-bromo-3,4-dicloroisobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/300 MHz)

2,01(s,6H), 7,50(d,1H), 8,0(dd,1H), 8,20(d,1H)

(4) 2,8 g de azida sódica foram adicionados a uma mistura compreendendo 6,39 g de α-bromo-3,4-dicloroisobutirofenona e 60 ml de dimetilsulfóxido, seguido por uma reação por 1 hora a 50°C. A mistura de reação foi colocada em água e extraída com acetato de etila, seguido por lavagem com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9) para se obter 6,34 g de α-azida-3,4-dicloroisobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/300 MHz)

1,60(s,6H), 7,53(d,1H), 7,97(dd,1H), 8,20(d,1H)

(5) 7,74 g de trifenilfosfina foram adicionados a uma mistura compreendendo 6,34 g de α-azida-3,4-dicloroisobutirofenona, 90 ml de tetrahidrofurano e 3,2 ml de água, seguido por uma reação por 23 horas em temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e ao resíduo, água e então ácido clorídrico foram adicionados para torná-lo fracamente ácido, seguido por lavagem com éter dietílico. A camada aquosa foi neutralizada com solução de hidróxido de sódio aquoso e extraída com éter dietílico. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. Acetato de etila foi adicionado ao resíduo e gás de cloreto de hidrogênio foi introduzido sob resfriamento com gelo. O sólido formado foi coletado por filtração e seco para se obter 5,92 g de cloridrato de α-amino-3,4-dicloroisobutirofenona.

(6) 0,33 g de trietilamina foi adicionado a uma mistura compreendendo 0,3 g de cloridrato de α-amino-3,4-dicloroisobutirofenona e 10 ml de 1,2-dicloroetano, seguido por agitação por 0,2 hora em temperatura ambiente. A mistura foi então resfriada com gelo e uma mistura compreendendo 0,27 g de cloreto de ácido 3-trifluorometilpicolínico e 2 ml de 1,2-dicloroetano, foi adicionada por gotejamento, seguido por uma reação por 1,5 hora em temperatura ambiente. A mistura de reação foi diluída com diclorometano e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 2/3) para se obter 0,29 g do produto desejado que tem um ponto de fusão entre 106 a 109°C. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,77 (s,6H), 7,41 (d,1H), 7,57 (dd,1H), 7,87 (dd,1H), 8,10-8,12 (m,2H), 8,14 (d,1H), 8,76 (d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 3

Preparação de N-[(4'-metóxi-2'-metil-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-3 mencionado depois)

(1) Uma mistura compreendendo 5,7 g de cloreto de isobutirila e 5 ml de dissulfeto de carbono foi adicionada por gotejamento a uma mistura compreendendo 7,15 g de cloreto de alumínio e 20 ml de dissulfeto de carbono em uma temperatura não superior a 10°C, seguido por uma reação por 0,5 hora. Então uma mistura compreendendo 5,0 g de m-cresol e 5 ml de dissulfeto de carbono foi adicionada por gotejamento a uma temperatura não superior a 5°C, seguido por uma reação por 4 horas à temperatura ambiente. A mistura de reação foi colocada em uma mistura de gelo e água e ácido hidroclorídrico e extraída com cloreto de metileno, seguido por lavagem com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de sódio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo, 60 ml de tetra-hidrofurano, 30 ml de água e 3,7 g de hidróxido de sódio foram adicionados, seguido por uma reação por 1,5 hora em temperatura ambiente. A mistura de reação foi con-

centrada sob pressão reduzida e então colocada água gelada, levemente acidificada com ácido sulfúrico diluído e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9) para se obter 2,45 g de 4-hidróxi-2-metilisobutirofenona sólida. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,15(d,6H), 2,43(s,3H), 3,40(m,1H), 6,70(m,2H), 7,57(d,1H)

(2) Uma mistura compreendendo 0,62 g de sulfato de dimetila e 3 ml de dimetilformamida foi adicionada a uma mistura compreendendo 0,8 g de 4-hidróxi-2-metilisobutirofenona, 0,68 g de carbonato de potássio e 15 ml de dimetilformamida, seguido por uma reação por 3 horas em temperatura ambiente. A mistura de reação foi colocada em água, extraída com acetato de etila e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9) para se obter 0,59 g de 4-metóxi-2-metilisobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,13(d,6H), 2,46(s,1H), 3,38(m,1H), 6,72(m,2H), 7,59(d,1H)

(3) 1,16 g de tribrometo de feniltrimetilamônio foi adicionado a uma mistura compreendendo 0,59 g de 4-metóxi-2-metilisobutirofenona e 15 ml de tetra-hidrofurano, seguido por uma reação por 2,5 horas em temperatura ambiente. Éter dietílico foi adicionado à mistura de reação e um material insolúvel foi filtrado. O filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 0,7 g de α-bromo-4-metóxi-2-metilisobutirofenona oleosa. 0,4 g de azida sódica foi adicionado a uma mistura compreendendo 0,7 g de α-bromo-4-metóxi-2-metilisobutirofenona e 8 ml de dimetilsulfóxido, seguido por uma reação por 1,5 hora a 50°C. A mistura de reação foi colocada em água, extraída com acetato de etila e então lavada com água. A camada orgânica foi

seca em sulfato de magnésio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9) para se obter 0,67 g de α-azida-4-metóxi-2-metilisobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/300 MHz)

1,54 (s,6H), 2,33 (s,1H), 3,81 (s,3H), 6,72 (dd,1H), 6,75 (d,1H), 7,61(d,1H)

(4) Uma mistura compreendendo 0,19 g de α-azida-4-metóxi-2-metilisobutirofenona, 10 ml de metanol e 13 mg de paládio carbono a 5% foi reagida por 1 hora em temperatura ambiente em uma atmosfera de hidrogênio. A mistura de reação foi filtrada através de celite e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 0,17 g de α-amino-4-metóxi-2-metilisobutirofenona oleosa.

(5) 0,10 g de trietilamina foi adicionado a uma mistura compreendendo 0,17 g de α-amino-4-metóxi-2-metilisobutirofenona e 10 ml de tetra-hidrofurano e uma mistura compreendendo 0,17 g de cloreto de ácido 3-trifluorometilpicolínico e 2 ml de tetra-hidrofurano foi adicionada por gotejamento a esta sob resfriamento com gelo. Após o término da adição por gotejamento, a mistura foi reagida por 1 hora em temperatura ambiente. A mistura de reação foi extraída com acetato de etila e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio anidro e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 3/7) para se obter 0,25 g do produto desejado que tem um ponto de fusão entre 116 a 118°C. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/300 MHz)

1,81(s,6H), 2,38(s,3H), 3,79(s,3H), 6,65(dd,1H), 6,76(d,1H), 7,49 (d,1H), 7,53(dd,1H), 8,11(d,1H), 8,40(s,1H), 8,73(d,1H)

<u>EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 4</u>

Preparação de N-[2-[(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolan-5-il) carbonil]-2-propil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 2-1

mencionado depois)

(1) 52,7 ml de n-butil-lítio (solução de n-hexano a 1,56 M) foram adicionados por gotejamento a uma mistura compreendendo 8,77 g de diisopropilamina e 150 ml de tetra-hidrofurano em uma atmosfera de nitrogênio a -20°C, seguido por agitação por 30 minutos na mesma temperatura. Em uma temperatura não superior a -50°C, 15,0 g de 5-bromo-2,2-diflúor-1,3-benzodioxolano foram adicionados por gotejamento, seguido por agitação por 30 minutos na mesma temperatura. 19,7 ml de iodeto de metila foram adicionados por gotejamento em uma temperatura não superior a -70°C, então a mistura foi aquecida até a temperatura ambiente e reagida por 15 horas. Após o término da reação, a mistura de reação foi colocada em água, levemente acidificada com ácido clorídrico e então extraída com éter de dietila. A camada orgânica foi lavada com água, seca em sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: n-hexano) para se obter 12,54 g de 5-bromo-2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolano oleoso. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

2,34(s,3H), 6,79(d,1H), 7,27(d,1H)

(2) 35,2 ml de n-butil-lítio (solução de n-hexano a 1,56 M) foram adicionados por gotejamento a uma mistura compreendendo 12,54 g de 5-bromo-2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolano e 150 ml de éter dietílico a -50°C em uma atmosfera de nitrogênio, seguido por agitação por 30 minutos na mesma temperatura. Em uma temperatura não superior a -70°C, 5,4 g de isobutilaldeído foram adicionados por gotejamento e então a mistura foi aquecida até a temperatura ambiente e reagida por 15 horas. Após o término da reação, a mistura de reação foi colocada em água, levemente acidificada com ácido clorídrico e extraída com éter dietílico. A camada orgânica foi lavada com água, seca em sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9) para se obter 10,65 g de 1-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolan-5-il)-2-metilpropanol ole-

oso. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

0,84(d,3H), 1,02(d,3H), 1,94(m,1H), 2,29(s,3H), 4,57(m,1H), 6,90 (d,1H), 7,14(d,1H)

(3) Uma mistura compreendendo 10,65 g de 1-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolan-5-il)-2-metilpropanol e 35 ml de diclorometano foi adicionada a uma mistura compreendendo 11,7 g de clorocromato de piridínio, 5,94 g de acetato de sódio e 100 ml de diclorometano em temperatura ambiente, seguido por uma reação por 2 horas na mesma temperatura com agitação. Após o término da reação, a mistura de reação foi filtrada através de celite e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/19) para se obter 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil)2-propil cetona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,16(d,6H), 2,40(s,3H), 3,35(m,1H), 6,94(d,1H), 7,39(d,1H)

(4) 13,41 g de tribrometo de feniltrimetilamônio foram adicionados a uma mistura compreendendo 8,64 g de 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil)2-propil cetona e 86 ml de tetra-hidrofurano, seguido por uma reação por 2 horas em temperatura ambiente. Após o término da reação, a mistura de reação foi filtrada e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 11,4 g de 2-bromo-2-propil 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolamil) cetona oleosa 4,64 g de azido sódico foi adicionado a uma mistura compreendendo 11,4 g de 2-bromo-2-propil 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil)cetona e 69,6 ml de dimetilsulfóxido, seguido por uma reação por 2 horas a 50°C. Após o término da reação, a mistura de reação foi colocada em água, extraída com éter dietílico e então lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de magnésio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/9) para se obter 9,6 g de 2-azida-2-propil 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil)cetona

oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,57(s,6H), 2,27(s,3H), 6,94(d,1H), 7,38(d,1H)

(5) Uma mistura compreendendo 0,20 g de 2-azida-2-propil 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil)cetona, 5 ml de metanol e 20 mg de paládio carbono a 5%, foi reagida por 1 hora em temperatura ambiente em uma atmosfera de hidrogênio. Após o término da reação, a mistura de reação foi filtrada através de celite e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 0,18 g de 2-amino-2-propil 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil) cetona oleosa. 86 mg de trietilamina foram adicionados a uma mistura compreendendo 0,18 g de 2-amino-2-propil 5-(2,2-diflúor-4-metil-1,3-benzodioxolanil) cetona e 7 ml de 1,2-dicloroetano, e 0,15 g de cloreto de ácido 3-trifluorometilpicolínico foram adicionados por gotejamento a isso sob resfriamento com gelo. Após o término da adição por gotejamento, a mistura foi reagida por 1,5 hora em temperatura ambiente. Após o término da reação, a mistura de reação foi lavada com água, seca em sulfato de sódio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 3/7) para se obter 0,20 g do produto desejado que tem um ponto de fusão entre 130 a 134°C. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,79 (s,6H), 2,37 (s,3H), 6,77 (d,1H), 7,31 (d,1H), 7,55 (dd,1H), 8,11 (d,1H), 8,16 (s,1H), 8,72 (d,1H)

<u>EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 5</u>

Preparação de N-[[3'-(2-propilóxi)-1,1-dimetil]fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-131 mencionado posteriormente)

Usando 5,0 g de 3-isopropiloxibenzonitrila, 0,97 g de um produto viscoso desejado foi obtido da mesma maneira que no Exemplo de Preparação 1 (1) a (5). Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,28 (d, 6H), 1,82 (s, 6H), 4,55 (m, 1H), 6,97 (dd, 1H), 7,21 (d,

1H), 7,47 (d, 1H), 7,53 (m, 2H), 8,10 (d, 1H), 8,73 (d, 1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 6

Preparação de N[(3'-hidróxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-130 mencionado posteriormente)

0,51 g de tetracloreto de titânio foi adicionado a uma mistura compreendendo 0,70 g de N-[[3'-(2-propilóxi)-1,1-dimetil]fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida e 20 ml de cloreto de metileno sob resfriamento com gelo. Então, 0,36 g de cloreto de alumínio foi adicionado e então a mistura foi levada para temperatura ambiente e reagida por 13 horas. A mistura de reação foi colocada em gelo e extraída com cloreto de metileno. A camada orgânica foi seca em sulfato de sódio anidro e então concentrada sob pressão reduzida para se obter 0,61 g de um produto viscoso desejado. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,78 (s,6H), 6,93 (dd,1H), 7,18 (t,1H), 7,51 (d,1H), 7,55 (m,2H), 8,11(d,1H), 8,32 (s,1H), 8,72 (d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 7

Preparação de N-[[3'-(2-pentilóxi)-1,1-dimetil]fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-136 mencionado posteriormente)

0,18 g de carbonato de potássio, 2 mg de brometo de tetra n-butilamônio e 0,23 g de 2-bromopentano foram adicionados a uma mistura compreendendo 0,25 g de N-[(3'-hidróxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida e 10 ml de dimetilformamida, seguido por uma reação por 27 horas a 50°C. A mistura de reação foi colocada em água, extraída com éter dietílico e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de sódio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 2/3) para se obter 0,25 g do produto viscoso desejado. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

0,88 (t,3H), 1,22 (d,3H), 1,38 (s,6H), 4,36 (m,1H), 6,96 (dd,1H), 7,21 (t,1H), 7,47 (d,1H), 7,52 (m,2H), 8,09 (d,1H), 8,36 (s,1H), 8,72 (d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 8

Preparação de N-[[4'-(2-propilóxi)-1,1-dimetil]fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-42 mencionado posteriomente)

Usando 10,0 g de 4-isopropiloxibenzonitrila, 2,8 g do produto desejado que tem um ponto de fusão entre 118 e 120°C foram obtidos da mesma maneira que no Exemplo de Preparação 1 (1) a (5). Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,31 (d,6H) 1,85 (s,6H), 4,59 (m,1H), 6,82 (d,2H), 7,53(dd,1H), 8,03(d,2H), 8,09(d,1H), 8,48(s,1H), 8,74(d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 9

Preparação de N-[(4'-hidróxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-71 mencionado posteriormente)

2,02 g de tetracloreto de titânio foram adicionados a uma mistura compreendendo 2,8 g de N-[[4'-(2-propilóxi)-1,1-dimetil]fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida e 70 ml de cloreto de metileno sob resfriamento com gelo. Então, 1,42 g de cloreto de alumínio foi adicionado e então a mistura foi trazida para temperatura ambiente e reagida por 16 horas. A mistura de reação foi colocada em gelo e cloreto de metileno foi adicionado, seguido por agitação. Um material insolúvel foi filtrado e o sólido foi dissolvido em acetato de etila e lavado com água. O produto obtido foi seco em sulfato de sódio anidro e então concentrado sob pressão reduzida para se obter 2,3 g do produto desejado que tem um ponto de fusão de 238 a 240°C. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,59 (s,6H), 6,59 (d,2H), 7,38 (dd,1H), 7,80 (d,2H), 7,91(d,1H), 8,37(s,1H), 8,58(d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 10

Preparação de N-[(4'-ciclopentilóxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-72 mencionado posteriormente)

0,12 g de carbonato de potássio e 0,34 g de iodeto de ciclopentila foram adicionados a uma mistura compreendendo 0,15 g de N-[(4'-hidróxi-

1,1-dimetil)fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida e 8 ml de dimetilformamida, seguido por uma reação por 20 horas a 90°C. A mistura de reação foi colocada em água, extraída com éter dietílico e lavada com água. A camada orgânica foi lavada com solução de hidróxido de sódio aquosa e lavada com água. Então, ela foi seca em sulfato de sódio anidro e concentrada sob pressão reduzida. Ao resíduo, n-hexano foi adicionado, e o sólido foi coletado por filtração para se obter 0,14 g do produto desejado que tem um ponto de fusão de 132 a 134°C. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,58 (m,4H), 1,70-1,90 (m,4H), 1,84 (s,6H), 4,78 (m,1H), 6,81 (d,2H), 7,53 (dd,1H), 8,03 (d,2H), 8,09(d,1H), 8,49(s,1H), 8,74(d,1H)

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 11

Preparação de N-[[4'-(2-heptilóxi)-1,1-dimetil]fenacil]-3-trifluorometil-2-piridinocarboxamida (composto No. 1-119 mencionado posteriormente)

(1) Usando 25,0 g de 4-isopropiloxibenzonitrila, 22,4 g de α-azida-4-isopropiloxisobutirofenona oleosa foram obtidos da mesma maneira que no Exemplo de Preparação 1 (1) a (3). Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,34(d,6H), 1,64(s,6H), 4,63(m,1H), 6,88(d,2H), 8,13(d,2H)

(2) 1,1 g de tetracloreto de titânio foi adicionado a uma mistura compreendendo 1,38 g de α-azida-4-isopropiloxisobutirofenona e 20 ml de cloreto de metileno sob resfriamento com gelo. Então, 0,75 g de cloreto de alumínio foi adicionado e a mistura foi trazida para temperatura ambiente e reagida por 17 horas. A mistura de reação foi colocada em gelo e extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca em sulfato de sódio anidro e então concentrada sob pressão reduzida para se obter 1,1 g de α-azida-4-hidroxisobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

1,58(s,6H), 6,86(d,2H), 8,11(d,2H)

(3) Uma mistura compreendendo 1,02 g de dietilazocarboxilato (solução de tolueno a 40%) e 2 ml de tetra-hidrofurano foi adicionada por gotejamento a uma mistura compreendendo 0,40 g de α-azida-4-hidroxisobutirofenona, 0,25 g de 2-heptanol, 0,61 g de trifenilfosfina e 10 ml de tetra-hidrofurano, seguido por uma reação por 1 hora em temperatura ambiente. A mistura de reação foi concentrada sob pressão reduzida e o resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 5/95) para se obter 0,34 g de α-azida-4-(2-heptilóxi)isobutirofenona oleosa. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

0,82(t,3H), 1,22-1,37(m,7H), 1,26(d,3H), 1,53(s,6H), 1,68(m,1H), 4,39(m,1H), 6,82(d,2H), 8,08(d,2H)

(4) Uma mistura compreendendo 0,34 g de α-azida-4-(2-heptilóxi)isobutirofenona, 15 ml de metanol e 20 mg de paládio carbono a 5% foi reagida por 3,5 horas em temperatura ambiente em uma atmosfera de hidrogênio. A mistura de reação foi filtrada através de celite e o filtrado foi concentrado sob pressão reduzida para se obter 0,25 g de α-amino-4-(2-heptilóxi)isobutirofenona oleosa.

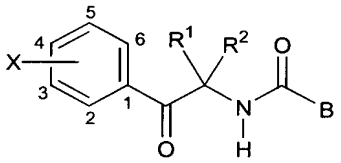
(5) 55 mg de trietilamina foram adicionados a uma mistura compreendendo 0,125 g de α-amino-4-(2-heptilóxi)isobutirofenona e 10 ml de tetra-hidrofurano e uma mistura compreendendo 0,10 g de cloreto de ácido 3-trifluorometilpicolínico e 2 ml de tetra-hidrofurano foi adicionada por gotejamento sob resfriamento com gelo. Após o termino da adição por gotejamento, a mistura foi reagida por 2 horas em temperatura ambiente. Após adicionar água, a mistura foi extraída com acetato de etila e lavada com água. A camada orgânica foi seca em sulfato de sódio anidro e então concentrada sob pressão reduzida. O resíduo foi purificado por cromatografia em coluna de sílica-gel (solvente desenvolvedor: acetato de etila/n-hexano = 1/2) para se obter 0,13 g do produto desejado que tem um ponto de fusão de 99 a 101°C. Os dados do espectro RMN desse produto são como segue:

^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)

0,80(t,3H), 1,22(t,3H), 1,22-1,35(m,5H), 1,49(m,1H), 1,66(m,1H), 4,35 (m,1H), 6,76(d,2H), 7,47(dd,1H), 7,98(d,2H), 8,04(d,1H), 8,43(s,1H), 8,69(d,1H)

Agora, exemplos típicos do derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso estão descritos especificamente nas Tabelas 1 e 2. Esses compostos podem ser preparados com base nos Exemplos de Preparação acima mencionados ou nos vários processos de produção acima mencionados. Nas Tabelas, No. representa o número do composto. Além disso, Me representa metila, Et etila, Pr(n) propila normal, Pr(i) isopropila, Bu(n) butila normal, Bu(i) isobutila, Bu(sec) butila secundária e Ph fenila. Além disso, com relação àqueles que não têm as propriedades físicas mostradas pelos pontos de fusão, os dados do espectro RMN são mostrados na Tabela 3.

Tabela 1



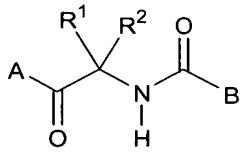
Nº	R^1	R^2	X	B	Propriedade Física (ponto de fusão °C)
1-1	Me	Me	2-Me-4-Cl	3-CF_3-2-piridila	125-130
1-2	Me	Me	2-Me-4-Br	3-CF_3-2-piridila	115-118
1-3	Me	Me	2-Me-4-OMe	3-CF_3-2-piridila	116-118
1-4	Me	Me	2-Me-4-OBu(sec)	3-CF_3-2-piridila	82-84
1-5	Me	Me	3-Me-4-Cl	3-CF_3-2-piridila	104-107
1-6	Me	Me	3-Me-4-Br	3-CF_3-2-piridila	103-106
1-7	Me	Me	4-Br	3-CF_3-2-piridila	115-120
1-8	Me	Me	2-Me-4-OEt	3-CF_3-2-piridila	70-75
1-9	Me	Me	3-Cl-4-Cl	3-CF_3-2-piridila	106-109
1-10	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	98-100
1-11	Me	Me	2-Me-4-OPr(n)	3-CF_3-2-piridila	88-90
1-12	Me	Me	2-Me-4-OBu(n)	3-CF_3-2-piridila	54-57
1-13	Me	Me	2-Me-3-Cl	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-14	Me	Me	2-Me-4-OEt	3-Cl-2-piridila	70-75
1-15	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	3-Cl-2-piridila	72-76
1-16	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	3-Me-2-piridila	82-85
1-17	Me	Me	3-Cl-4-Cl	3-Me-2-piridila	102-106
1-18	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	2-Br-3-piridila	119-121
1-19	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	2-Me-3-piridila	148-158
1-20	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	2-CF_3-3-piridila	97-100
1-21	Me	Me	3-$OCHF_2$	3-CF_3-2-piridila	81-83
1-22	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	3-Br-2-piridila	74-78

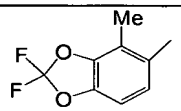
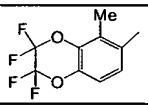
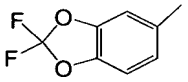
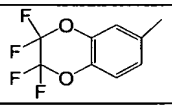
Nº	R^1	R^2	X	B	Propriedade Física (ponto de fusão °C)
1-23	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	2-Cl-3-piridila	120-124
1-24	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	4-CF_3-3-piridila	122-128
1-25	Me	Me	3-Cl-4-Cl	2-Cl-3-piridila	136-140
1-26	Me	Me	3-Cl	3-CF_3-2-piridila	105-108
1-27	Me	Me	3-Br	3-CF_3-2-piridila	117-118
1-28	Me	Me	2-Me-3-OPr(n)	3-CF_3-2-piridila	107-109
1-29	Me	Me	3-OPr(n)	3-CF_3-2-piridila	103-106
1-30	Me	Me	3-OBu(n)	3-CF_3-2-piridila	
1-31	Me	Me	3-$(CH_2)_4CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-32	Me	Me	3-$O(CH_2)_4CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-33	Me	Me	3-$(CH_2)_5CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-34	Me	Me	3-$O(CH_2)_5CH_3$	3-CF_3-2-piridila	59-65
1-35	Me	Me	3-$(CH_2)_6CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-36	Me	Me	3-SBu(n)	3-CF_3-2-piridila	
1-37	Me	Me	3-$S(CH_2)_4CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-38	Me	Me	3-$S(CH_2)_5CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-39	Me	Me	4-OMe	3-CF_3-2-piridila	
1-40	Me	Me	4-OEt	3-CF_3-2-piridila	114-118
1-41	Me	Me	4-OPr(n)	3-CF_3-2-piridila	
1-42	Me	Me	4-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	118-120
1-43	Me	Me	4-OBu(sec)	3-CF_3-2-piridila	105-108
1-44	Me	Me	3-OMe	3-CF_3-2-piridila	
1-45	Me	Me	3-OEt	3-CF_3-2-piridila	
1-46	Me	Me	4-OBu(n)	3-CF_3-2-piridila	103-106
1-47	Me	Me	4-$O(CH_2)_4CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-48	Me	Me	4-$O(CH_2)_5CH_3$	3-CF_3-2-piridila	77-79
1-49	Me	Me	2-Me-3-OBu(n)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-50	Me	Me	4-$O(CH_2)_6CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-51	Me	Me	4-$(CH_2)_6CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-52	Me	Me	4-$O(CH_2)_7CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-53	Me	Me	4-$O(CH_2)_8CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-54	Me	Me	4-$O(CH_2)_9CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-55	Me	Me	4-$O(CH_2)_{10}CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-56	Me	Me	4-$O(CH_2)_{11}CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-57	Me	Me	3-Me-4-OBu(n)	3-CF_3-2-piridila	
1-58	Me	Me	4-OBu(i)	3-CF_3-2-piridila	116-118
1-59	Me	Me	3-Me-4-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	
1-60	Me	Me	2-Me-3-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	
1-61	Me	Me	4-Cl	3-CF_3-2-piridila	116-118
1-62	Me	Me	2-Me-4-$OCHF_2$	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-63	Me	Me	4-OSO_2Me	3-CF_3-2-piridila	174-176
1-64	Me	Me	4-OPh	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-65	Me	Me	4-Ciclo-hexilóxi	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-66	Me	Me	4-$OCH(CH_2CH_2CH_3)_2$	3-CF_3-2-piridila	125-126
1-67	Me	Me	4-$OCH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	89-92
1-68	Me	Me	4-$(CH_2)_4CH_3$	3-CF_3-2-piridila	101-107
1-69	Me	Me	2-Me-3-$O(CH_2)_5CH_3$	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-70	Me	Me	4-$O(CH_2)_2OCH_3$	3-CF_3-2-piridila	101-103
1-71	Me	Me	4-OH	3-CF_3-2-piridila	238-240
1-72	Me	Me	4-Ciclopentilóxi	3-CF_3-2-piridila	132-134
1-73	Me	Me	4-OCH_2Ph	3-CF_3-2-piridila	142-145

Nº	R^1	R^2	X	B	Propriedade Física (ponto de fusão °C)
1-74	Et	Et	4-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	130-133
1-75	Me	Et	4-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	112-114
1-76	Me	Me	4-(3-Hexilóxi)	3-CF_3-2-piridila	105-106
1-77	Me	Me	4-(2-Hexilóxi)	3-CF_3-2-piridila	107-111
1-78	Me	Me	2-Me-4-(2-Pentilóxi)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-79	Me	Me	4-(3-Pentilóxi)	3-CF_3-2-piridila	106-108
1-80	Me	Me	4-$OCH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	102-105
1-81	Me	Me	4-$OCH_2CH_2CH(CH_3)CH_3$	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-82	Me	Me	2-Me-4-OMe	2-Cl-3-piridila	
1-83	Me	Me	2-Me-4-OEt	2-Cl-3-piridila	
1-84	Me	Me	2-Me-4-OPr	2-Cl-3-piridila	
1-85	Me	Me	2-Me-4-OBu	2-Cl-3-piridila	
1-86	Me	Me	2-Me-4-OBu(sec)	2-Cl-3-piridila	
1-87	Me	Me	2-Me-4-OBu(i)	2-Cl-3-piridila	
1-88	Me	Me	2-Me-4-Heptilóxi	2-Cl-3-piridila	
1-89	Me	Me	2-Me-4-(2-Heptilóxi)	2-Cl-3-piridila	
1-90	Me	Me	2-Me-4-(3-Heptilóxi)	2-Cl-3-piridila	
1-91	Me	Me	4-OMe	2-Cl-3-piridila	
1-92	Me	Me	4-OEt	2-Cl-3-piridila	
1-93	Me	Me	4-OPr	2-Cl-3-piridila	
1-94	Me	Me	4-OPr(i)	2-Cl-3-piridila	
1-95	Me	Me	4-OBu	2-Cl-3-piridila	
1-96	Me	Me	4-OBu(sec)	2-Cl-3-piridila	
1-97	Me	Me	4-OBu(i)	2-Cl-3-piridila	
1-98	Me	Me	4-Heptilóxi	2-Cl-3-piridila	
1-99	Me	Me	4-(2-Heptilóxi)	2-Cl-3-piridila	viscoso
1-100	Me	Me	4-(3-Heptilóxi)	2-Cl-3-piridila	viscoso
1-101	Me	Me	2-Me-4-OBu(i)	3-CF_3-2-piridila	
1-102	Me	Me	2-Me-4-Pentilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-103	Me	Me	2-Me-4-(3-Pentilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-104	Me	Me	2-Me-4-Hexilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-105	Me	Me	2-Me-4-(2-Hexilóxi)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-106	Me	Me	2-Me-4-(3-Hexilóxi)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-107	Me	Me	2-Me-4-Heptilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-108	Me	Me	2-Me-4-(2-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-109	Me	Me	2-Me-4-(3-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-110	Me	Me	2-Me-4-(4-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-111	Me	Me	2-Me-4-(2-Octilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-112	Me	Me	2-Me-4-(2-Nonilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-113	Me	Me	4-Pentilóxi	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-114	Me	Me	4-$O(CH_2)_3CH(CH_3)CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-115	Me	Me	4-$O(CH_2)_2CH(CH_3)CH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-116	Me	Me	4-$OCH_2CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-117	Me	Me	4-$OCH_2CH(CH_2CH_3)CH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-118	Me	Me	4-Heptilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-119	Me	Me	4-(2-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	99-101
1-120	Me	Me	4-(3-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	111-115
1-121	Me	Me	4-Octilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-122	Me	Me	4-(2-Octilóxi)	3-CF_3-2-piridila	100-101
1-123	Me	Me	4-(3-Octilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-124	Me	Me	4-(4-Octilóxi)	3-CF_3-2-piridila	

Nº	R^1	R^2	X	B	Propriedade Física (ponto de fusão °C)
1-125	Me	Me	4-Nonilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-126	Me	Me	4-(2-Nonilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-127	Me	Me	4-(3-Nonilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-128	Me	Me	4-(4-Nonilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-129	Me	Me	4-(5-Nonilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-130	Me	Me	3-OH	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-131	Me	Me	3-OPr(i)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-132	Me	Me	3-OBu	3-CF_3-2-piridila	81-83
1-133	Me	Me	3-OBu(sec)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-134	Me	Me	3-OBu(i)	3-CF_3-2-piridila	
1-135	Me	Me	3-Pentilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-136	Me	Me	3-(2-Pentilóxi)	3-CF_3-2-piridila	viscoso
1-137	Me	Me	3-(3-Pentilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-138	Me	Me	3-(2-Hexilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-139	Me	Me	3-(3-Hexilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-140	Me	Me	3-Heptilóxi	3-CF_3-2-piridila	
1-141	Me	Me	3-(2-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-142	Me	Me	3-(3-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-143	Me	Me	3-(4-Heptilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-144	Me	Me	3-(2-Octilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-145	Me	Me	3-(2-Nonilóxi)	3-CF_3-2-piridila	
1-146	Me	Me	4-CH_2OCH_3	3-CF_3-2-piridila	
1-147	Me	Me	4-$CH_2OCH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-148	Me	Me	4-$CH_2OCH(CH_3)_2$	3-CF_3-2-piridila	100-102
1-149	Me	Me	4-$CH_2OCH_2CF_3$	3-CF_3-2-piridila	
1-150	Me	Me	4-$CH_2SCH_2CH_3$	3-CF_3-2-piridila	

Tabela 2



Nº	A	R^1	R^2	B	Propriedade Física (ponto de fusão°C)
2-1		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	130-134
2-2		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	140-142
2-3		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	
2-4		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	

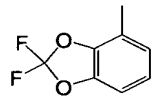
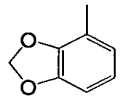
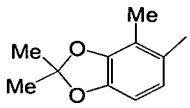
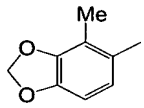
Nº	A	R^1	R^2	B	Propriedade Física (ponto de fusão°C)
2-5		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	
2-6		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	149-151
2-7		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	
2-8		Me	Me	3-CF_3-2-piridila	

Tabela 3

Nº	^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)
1-13	1,76(s, 6H), 2,33 (s, 3H), 7,25 (d,1H), 7,64 (dd,1H), 7,76 (dd,1H), 7,88 (d,1H), 8,06 (d,1H), 8,20 (s, 1H), 8,71 (d,1H)
1-49	0,93 (t,3H), 1,47 (m,2H), 1,74 (m,2H), 1,84 (s, 6H), 3,96 (t,2H), 6,73 (d,1H), 7,51 (dd,1H), 7,91 (m,2H), 8,05 (d,1H), 8,48 (s, 1H), 8,72 (d,1H)
1-62	1,77 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 6,46 (t,1H), 6,84 (dd,1H), 6,96 (s, 1H), 7,48 (d,1H), 7,53 (dd,1H), 8,10 (d,1H), 8,25 (s, 1H), 8,71 (d,1H)
1-64	1,82 (s, 6H), 6,92 (d,2H), 7,01 (d,2H), 7,14 (t,1H), 7,34 (m,2H), 7,54 (dd,1H), 8,03 (d,2H), 8,08 (d,1H), 8,72 (d,1H)
1-65	1,33 (m,2H), 1,51 (m,2H), 1,76 (m,6H), 1,87 (s, 6H), 4,30 (m,1H), 6,82 (d,2H), 7,52 (dd,1H), 8,01 (d,2H), 8,08 (d,1H), 8,49 (s, 1H), 8,73 (d,1H)
1-69	0,91 (t,3H), 1,35 (m,4H), 1,47 (m,2H), 1,80 (m,2H), 1,87 (s, 6H), 2,23 (s, 3H), 4,0 (t,2H), 6,78 (d,1H), 7,54 (dd,1H), 7,89 (d,1H), 7,93 (dd,1H), 8,10 (d,1H), 8,48 (s, 1H), 8,75 (d,1H)
1-78	0,90 (t,3H), 1,24 (d,3H), 1,47 (m,4H), 1,78 (s, 6H), 4,36 (m,1H), 6,58 (dd,1H), 6,72 (d,1H), 7,44 (d,1H), 7,51 (dd,1H), 8,08 (d,1H), 8,39 (s, 1H), 8,71 (d,1H)
1-81	0,93 (d,6H), 1,66 (q,2H), 1,82 (m,1H), 1,86 (s, 6H), 4,01 (t,2H), 6,85 (d,2H), 7,54 (dd,1H), 8,06 (d,2H), 8,10 (d,1H), 8,48 (s, 1H), 8,75 (d,1H)
1-99	0,88 (t,3H), 1,29 (d,3H), 1,34 (m,6H), 1,54 (m,1H), 1,73 (m,1H), 1,87 (s, 6H), 4,43 (m, 1H), 6,86 (d,2H), 7,29 (dd,1H), 7,70 (s, 1H), 7,91 (dd,1H), 8,04 (d,2H), 8,43 (dd,1H)
1-100	0,88 (t,3H), 0,94 (t,3H), 1,32 (m,4H), 1,68 (m,4H), 1,87 (s, 6H), 4,25 (m,1H), 6,87 (d,2H), 7,28 (dd,1H), 7,70 (s, 1H), 7,90 (dd,1H), 8,03 (d,2H), 8,43 (dd,1H)
1-105	0,89 (t,3H), 1,27 (d,3H), 1,33 (m,4H), 1,55 (m,1H), 1,73 (m,1H), 1,82 (s, 6H), 2,37 (s, 3H), 4,36 (m,1H), 6,61 (dd,1H), 6,74 (d,1H), 7,47 (d,1H), 7,55 (dd,1H), 8,11 (dd,1H), 8,41 (s, 1H), 8,74 (dd,1H)
1-106	0,91 (t,3H), 0,92 (t,3H), 1,39 (m,2H), 1,63 (m,4H), 1,88 (s, 6H)2,37 (s, 3H), 4,19 (m,1H), 6,61 (dd,1H), 6,74 (d,1H), 7,46 (d,1H), 7,54 (dd,1H), 8,11 (dd,1H), 8,42 (s, 1H), 8,74 (dd,1H)
1-113	0,90 (t,3H), 1,36 (m,4H), 1,74 (m,2H), 1,85 (s, 6H), 3,96 (t,2H), 6,83 (m,2H), 7,53 (dd,1H), 8,05 (m,2H), 8,10 (d,1H), 8,48 (s, 1H), 8,74 (d,1H)

Nº	^{1}H-RMN δ ppm (Solvente: $CDCl_3$/400 MHz)
1-130	1,78 (s, 6H), 6,93 (dd,1H), 7,18 (t,1H), 7,51 (d,1H), 7,55 (m,2H), 8,11 (d,1H), 8,32 (s, 1H), 8,72 (d,1H)
1-131	1,28 (d,6H), 1,82 (s, 6H), 4,55 (m,1H), 6,97 (dd,1H), 7,21 (d,1H), 7,47 (d,1H), 7,53 (m,2H), 8,10 (d,1H), 8,73 (d,1H)
1-133	0,87 (m,3H), 1,19 (m,3H), 1,38 (s, 6H), 1,52 (s, 6H), 1,61 (m,2H), 4,21 (m,1H), 6,77 (dd,1H), 6,89 (m,2H), 7,16 (t,1H), 7,53 (m,1H), 7,61 (t,1H), 8,15 (d,1H)
1-136	0,88 (t,3H), 1,22 (d,3H), 1,38 (s, 6H), 4,36 (m,1H), 6,96 (dd,1H), 7,21 (t,1H), 7,47 (d,1H), 7,52 (m,2H), 8,09 (d,1H), 8,36 (s, 1H), 8,72 (d,1H)

Agora, Exemplos de Teste para a composição da presente invenção serão descritos. Em cada teste, o índice de controle foi determinado com base nos seguintes padrões:

[Índice de controle]: [Grau de surto da doença: Observação visual]

5: Sem lesões nem esporulação reconhecível

4: Extensão das lesões, número de lesões ou área de esporulação é menor do que 10% do lote não tratado

3: Extensão das lesões, número de lesões ou área de esporulação é menor do que 40% do lote não tratado

2: Extensão das lesões, número de lesões ou área de esporulação é menor do que 70% do lote não tratado

1: Extensão das lesões, número de lesões ou área de esporulação é pelo menos 70% do lote não tratado

EXEMPLO DE TESTE 1: Teste sobre o Efeito Preventivo Contra Oídio de Trigo

Trigo (cultivar: Norin-61-go) foi cultivado em um recipiente de plástico que tem um diâmetro de 7,5 cm e quando ele alcançou o estágio de 1,5 folha, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso ajustada para uma concentração prescrita foram aplicados por uma pistola de pulverização. Após a solução química ter secado (no mesmo dia da aplicação), conídios de *Erysiphe graminis* foram pulverizados e inoculados e mantidos em uma câmara de temperatura constante a 20°C. De 6 a 7 dias após a inoculação, a área de esporulação foi investigada e o índice de controle foi determinado de acordo com os padrões de avaliação acima. O teste foi realizado com relação aos compostos No. 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-9, 1-12, 1-20, 1-22, 1-

24, 1-46, 1-48, 1-67, 1-75, 1-76, 1-78, 1-80, 1-132 e 2-1 acima e todos os compostos mostraram efeitos com um índice de controle de 4 ou 5 em uma concentração de 500 ppm.

Com o propósito de comparação, o teste foi realizado com relação ao composto No. 1-52 descrito em JP-A-2005-179234, isto é 3-flúor-N-(2-metil-1-oxo-(4'-(trifluorometóxi)bifenil-4-il)propan-2-il)isonicotinamida (daqui em diante referido como Composto Comparativo 1), no qual o índice de controle em 500 ppm foi 1.

EXEMPLO DE TESTE 2: Teste sobre o Efeito Preventivo Contra o Oídio de Pepino

Pepino (cultivar: Sagamihanpaku) foi cultivado em um recipiente de plástico tendo um diâmetro de 7,5 cm e quando alcançou o estágio de 1,5 folha, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, ajustada para uma concentração prescrita foram aplicados por uma pistola de pulverização. Após a solução química ter secado (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), uma suspensão de conídios de Sphaerotheca fuliginea foi pulverizada e inoculada e mantida em uma câmara de temperatura constante a 20°C. De 6 a 7 dias após a inoculação, a área de esporulação foi investigada e o índice de controle foi determinado de acordo com os padrões de avaliação acima. O teste foi realizado com relação aos compostos No. 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-6, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-20, 1-22, 1-23, 1-43, 1-46, 1-48, 1-58, 1-65, 1-66, 1-67, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-120, 1-122, 1-131, 1-136 e 2-1 e todos os compostos mostraram efeitos com um índice de controle de 4 ou 5 em uma concentração de 500 ppm.

EXEMPLO DE TESTE 3: Teste sobre o Efeito Preventivo Contra Brusone de Arroz

Arroz (cultivar: Nihonbare) foi cultivado em um recipiente de plástico tendo um diâmetro de 7,5 cm e quando alcançou o estágio de 1,5 folha 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, ajustada para uma concentração

prescrita, foram aplicados com uma pistola de pulverização. Após a solução química ter secado (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), uma suspensão de conídios de Pyricularia oryzae foi pulverizada e inoculada e mantida em uma caixa de inoculação a 20°C por 24 a 96 horas e após isso mantida em uma câmara de temperatura constante a 20°C. De 5 a 7 dias após a inoculação, o número de lesões foi investigado e o índice de controle foi determinado de acordo com os padrões de avaliação acima. O teste foi realizado com relação aos compostos No. 1-2 e 1-20 e todos os compostos mostraram efeitos com um índice de controle de 4 ou 5 em uma concentração de 500 ppm.

EXEMPLO DE TESTE 4: Teste Sobre o Efeito Preventivo Contra a Podridão do Colo de Feijão

Feijão (cultivar: Taisyou Kintoki) foi cultivado em um recipiente de plástico tendo um diâmetro de 15 cm, e quando a folha principal se desenvolveu suficientemente, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, ajustada para uma concentração prescrita, foram aplicados com uma pistola de pulverização. Após a solução química ter secado (no mesmo dia da aplicação ou no dia seguinte), disco de micélio de Sclerotinia sclerotiotum foi inoculado e mantido em uma câmara com temperatura constante a 20°C. Três dias após a inoculação, a extensão das lesões (mm) foi investigada e o índice de controle foi determinado de acordo com os padrões de avaliação acima. O teste foi realizado com relação aos compostos No. 1-1, 1-2, 1-11, 1-17, 1-18, 1-34, 1-43, 1-49, 1-58, 1-65, 1-66, 1-69, 70, 1-74, 1-77, 1-78, 1-79, 1-99, 1-100, 1-105, 1-106, 1-113, 1-119, 1-120, 1-122, 1-131 e 1-136 e todos os compostos mostraram efeitos com um índice de controle de 4 ou 5 em uma concentração de 500 ppm.

EXEMPLO DE TESTE 5: Teste Sobre o Efeito Preventivo Contra Mancha das Glumas do Trigo

Trigo (cultivar: Norin-61-go) foi cultivado em um recipiente de plástico tendo um diâmetro de 7,5 cm e quando alcançou o estágio de 1,5 folha, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido

carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, ajustada para uma concentração prescrita, foi aplicada por uma pistola de pulverizar. Apóas a solução química ter secado (no mesmo dia da aplicação), uma suspensão de conídios de Septoria nodorum foi pulverizada e mantida em uma caixa de inoculação a 20°C por 72 a 96 horas e mantida posteriormente em uma câmara de temperatura constante a 20°C. De 5 a 10 dias após a inoculação, o número de lesões foi investigado e o índice de controle foi determinado de acordo com os padrões de avaliação acima. O teste foi realizado com relação aos compostos No. 1-13, 1-14, 1-61, 1-62, 1-64 e 1-72 e todos os compostos mostraram efeitos com um índice de controle de 4 ou 5 em uma concentração de 500 ppm.

EXEMPLO DE TESTE 6: Teste Sobre o Efeito Preventivo Contra Mofo Cinzento do Feijão

Feijão (cultivar: Taisyou Kintoki) foi cultivado em um recipiente de plástico tendo um diâmetro de 15 cm, e quando a folha principal se desenvolveu suficientemente, 10 ml de uma solução química contendo o derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, ajustada para uma concentração prescrita, foram aplicados com uma pistola de pulverização. Após a solução química ter secado (no dia seguinte ao da aplicação), uma suspensão de esporos de Botrytis cinerea (extrato de glicose de batata diluído para 50% com água) foi inoculada e mantida em uma câmara com temperatura constante a 20°C. De 3 a 4 dias após a inoculação, a extensão das lesões (mm) foi investigada e o índice de controle foi determinado de acordo com os padrões de avaliação acima. O teste foi realizado com relação aos compostos No. 1-1, 1-2, 1-7, 1-8, 1-10, 1-15, 1-16, 1-18, 1-34, 1-49, 1-61, 1-62, 1-64, 1-68, 1-69, 1-70, 1-72, 1-81, 1-99, 1-100, 1-105, 1-106, 1-113 e 1-119 e todos os compostos mostraram efeitos com um índice de controle de 4 em uma concentração de 500 ppm.

Para a finalidade de comparação, o teste foi realizado com relação ao Composto Comparativo 1, no qual o índice de controle em 500 ppm foi de 1.

Agora, Exemplos de Formulação da composição da presente

invenção serão descritos abaixo. Entretanto, a proporção de peso, tipo de formulação ou semelhantes não estão restritos de nenhuma maneira aos Exemplos a seguir.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 1

(1)	Composto da fórmula (I)	20 partes em peso
(2)	Argila	72 partes em peso
(3)	Lignina sulfonato de sódio	8 partes em peso

Os componentes acima são uniformemente misturados para se obter um pó molhável.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 2

(1)	Composto da fórmula (I)	5 partes em peso
(2)	Talco	95 partes em peso

Os componentes acima são uniformemente misturados para se obter um pó.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 3

(1)	Composto da fórmula (I)	20 partes em peso
(2)	N,N'-dimetilacetamida	20 partes em peso
(3)	Alquil fenil éter de polióxi etileno	10 partes em peso
(4)	Xileno	50 partes em peso

Os componentes acima são uniformemente misturados e dissolvidos para se obter um concentrado emulsificável.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 4

(1)	Argila	68 partes em peso
(2)	Lignina sulfonato de sódio	2 partes em peso
(3)	Alquil aril sulfato de polióxi etileno	5 partes em peso
(4)	Sílica fina	25 partes em peso

Uma mistura dos componentes acima e o composto da formula (I) são misturados em uma proporção em peso de 4:1 para se obter um pó molhável.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 5

(1)	Composto da fórmula (I)	50 partes em peso
(2)	Polialquilfenil fosfato-trietanolamina oxilada	2 partes em peso

(3)	Silicone	0,2 parte em peso
(4)	Água	47,8 partes em peso

Os componentes acima são uniformemente misturados e pulverizados para se obter uma solução estoque e

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

são ainda adicionados a isso, seguido por misturação uniforme, granulação e secagem para se obter grânulos dispersíveis em água.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 6

(1)	Composto da fórmula (I)	5 partes em peso
(2)	Éter octilfenílico de polioxietileno	1 parte em peso
(3)	Fosfato de polioxietileno	0,1 parte em peso
(4)	Carbonato de cálcio particulado	93,9 partes em peso

Os componentes (1) a (3) acima são preliminarmente misturados uniformemente e diluídos com uma quantidade apropriada de acetona, a mistura diluída é pulverizada sobre o componente (4) e a acetona é removida para se obter grânulos.

EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 7

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

Os componentes acima são uniformemente misturados e dissolvidos para se obter uma formulação de volume ultrabaixo.

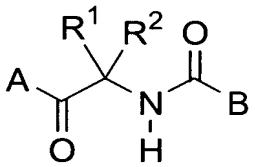
EXEMPLO DE FORMULAÇÃO 8

(1)	Composto da fórmula (I)	20 partes em peso
(2)	Trietanolamina de fosfato de polialquilfenila oxilada	2 partes em peso
(3)	Silicone	0,2 parte em peso
(4)	Goma xantana	0,1 parte em peso
(5)	Etileno glicol	5 partes em peso
(6)	Água	72,7 partes em peso

Os componentes acima são uniformemente misturados e pulverizados para se obter um concentrado de suspensão a base de água.

REIVINDICAÇÕES

1. Composição fungicida, caracterizada pelo fato de que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso como um ingrediente ativo:



(I)

em que A é fenila que pode ser substituída por X, benzodioxolanila que pode ser substituída por X, ou benzodioxanila que pode ser substituída por X; B é 2- ou 3-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, hidróxi, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, cicloalquilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, alquilsulfonilóxi, haloalquilsulfonilóxi, alcoxialcóxi, haloalcoxialcóxi, alcóxi-haloalcóxi, haloalcóxi-haloalcóxi, alcoxialquila, haloalcoxialquila, alquiltioalquila, haloalquiltioalquila, fenila que pode ser substituída por Y, fenóxi que pode ser substituído por Y, benzilóxi que pode ser substituído por Y, piridila que pode ser substituída por Y, ou piridilóxi que pode ser substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, alcóxi ou haloalcóxi, contanto que quando B for 3-piridila que pode ser substituída, A seja fenila que pode ser substituída por pelo menos dois X (tal que uma pluralidade de X pode ser iguais ou diferentes).

2. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que B é 2-piridila que pode ser substituída.

3. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que A é fenila que pode ser substituída por X, benzodioxolanila que pode ser substituída por X, ou benzodioxanila que pode ser substituída por X; B é 2-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila,

alquinila, haloalquinila, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, fenila substituída por Y, fenóxi substituído por Y, piridila substituída por Y, ou piridilóxi substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila ou alcóxi.

4. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 3, caracterizada pelo fato de que A é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B é 2-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; e cada um de R^1 e R^2 é alquila.

5. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 4, caracterizada pelo fato de que A é fenila substituída por pelo menos dois substituintes selecionados do grupo que consiste em halogênio, alquila e alcóxi.

6. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que B é 3-piridila que pode ser substituída.

7. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que A é fenila que pode ser substituída por X, benzodioxolanila que pode ser substituída por X, ou benzodioxanila que pode ser substituída por X; B é 3-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, fenila substituída por Y, fenóxi substituído por Y, piridila substituída por Y, ou piridilóxi substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila ou alcóxi.

8. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 7, caracterizada pelo fato de que A é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B é 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; e cada um de R^1 e R^2 é alquila.

9. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 8, caracterizada pelo fato de que A é fenila substituída por pelo menos dois subs-

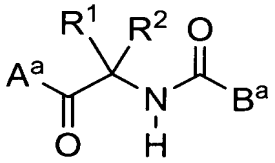
tituintes selecionados a partir do grupo que consiste em halogênio, alquila e alcóxi.

10. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que A é benzodioxolanila substituída por halogênio ou alquila; B é 2- ou 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; e cada um de R^1 e R^2 é alquila.

11. Composição fungicida de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que A é benzodioxanila substituída por halogênio ou alquila; B é 2- ou 3-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; e cada um de R^1 e R^2 é alquila.

12. Derivado de amida de ácido carboxílico, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula (I) ou um sal disso, como definido na reivindicação 1.

13. Derivado de amida de ácido carboxílico, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula (I-a) ou um sal disso:



(I-a)

em que A^a é fenila que pode ser substituída por X, B^a é 2-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um anel de carbono saturado de 3 a 6 membros; X é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, hidróxi, alcóxi, haloalcóxi, alquenilóxi, haloalquenilóxi, alquinilóxi, haloalquinilóxi, cicloalquilóxi, alquiltio, haloalquiltio, alqueniltio, haloalqueniltio, alquiniltio, haloalquiniltio, alquilsulfonilóxi, haloalquilsulfonilóxi, alcoxialcóxi, haloalcoxialcóxi, alcóxi-haloalcóxi, haloalcóxi-haloalcóxi, alcoxialquila, haloalcoxialquila, alquiltioalquila, haloalquiltioalquila, fenila que pode ser substituída por Y, fenóxi que pode ser substituído por Y, benzilóxi que pode ser substituído por Y, piridila que pode ser substituída por Y, ou piridilóxi que pode ser substituído por Y; e Y é halogênio, alquila, haloalquila, alquenila, haloalquenila, alquinila, haloalquinila, alcóxi ou haloalcóxi.

14. Derivado de amida de ácido carboxílico ou um sal disso de acordo com a reivindicação 13, caracterizado pelo fato de que A^a é fenila substituída por halogênio, alquila ou alcóxi; B^a é 2-piridila substituída por halogênio, alquila ou haloalquila; e cada um de R^1 e R^2 é alquila.

15. Derivado de amida de ácido carboxílico ou um sal disso, de acordo com a reivindicação 14, caracterizado pelo fato de que A^a é fenila substituída por pelo menos dois substituintes selecionados a partir do grupo que consiste em halogênio, alquila e alcóxi.

16. Composição fungicida mista, caracterizada pelo fato de que compreende um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, como definido da reivindicação 1, e outro composto de ingrediente fungicidamente ativo, como ingredientes ativos.

17. Composição fungicida mista de acordo com a reivindicação 16, caracterizada pelo fato de que o dito outro ingrediente fungicidamente ativo é pelo menos um membro selecionado a partir do grupo que consiste em um composto de anilinopirimidina, um composto de piridinamina, um composto de azol, um composto de quinoxalina, um composto de ditiocarbamato, um composto orgânico de cloro, um composto de imidazol, um composto de ciano acetamida, um composto de fenilamida, um composto de ácido sulfênico, um composto de cobre, um composto de isoxazol, um composto orgânico de fósforo, um composto de N-halogenotioalquila, um composto de dicarboxi-imida, um composto de benzanilida, um composto de anilida, um composto de piperazina, um composto de piridina, um composto de carbinol, um composto de piperidina, um composto de morfolina, um composto orgânico de estanho, um composto de ureia, um composto de ácido cinâmico, um composto de fenilcarbamato, um composto de cianopirrol, um composto de estrobilurina, um composto de oxazolidinona, um composto de tiazolcarboxamida, um composto de sililamida, um composto de carbamato de amida de aminoácido, um composto de imidazolidina, um composto de hidroxianilida, um composto de benzenossulfonamida, um composto de éter de oxima, um composto de fenoxiamida, um antibiótico, um composto de guanidina, Isoprotiolano, Piroquilon, Diclomezina, Quinoxifen, Cloridrato de

Propamocarb, Espiroxamina, Cloropicrina, Dazomet, Metam-sódio, Metrafenona, UBF-307, Diclocimet, Proquinazid, Amisulbrom, KIF-7767, Syngenta 446510 e Fluopicolida.

18. Método para controlar fungos nocivos, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal desse, como definido na reivindicação 1.

19. Método para controlar fungos nocivos de acordo com a reivindicação 18, caracterizado pelo fato de que os fungos nocivos são Ascomicetos ou Deuteromicetos.

20. Método para controlar doenças de plantas, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) acima ou um sal disso, como definido na reivindicação 1.

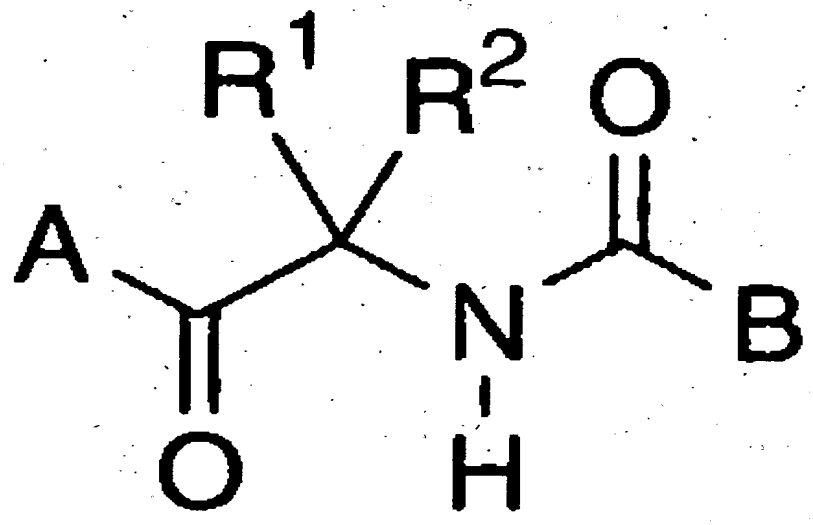
21. Método para controlar doenças de plantas de acordo com a reivindicação 20, caracterizado pelo fato de que as doenças de planta são doenças de plantas causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos.

22. Método para controlar doenças de plantas de acordo com a reivindicação 21, caracterizado pelo fato de que as doenças de planta causadas por Ascomicetos ou Deuteromicetos são mofo cinzento, doenças causadas por Sclerotinia, míldio, brusone, mancha das glumas, ou doenças de planta causadas por Alternaria.

23. Método para proteger plantas de cultivo, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, como definido na reivindicação 1.

24. Método para melhorar o rendimento dos cultivos, caracterizado pelo fato de que compreende aplicar uma quantidade eficaz de um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, como definido na reivindicação 1.

PI0619838-4



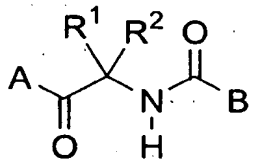
(I)

PI 0619838

RESUMO

Patente de Invenção: **"COMPOSIÇÕES FUNGICIDAS, DERIVADO DE AMIDA DE ÁCIDO CARBOXÍLICO E MÉTODOS PARA CONTROLAR FUGOS NOCIVOS, DOENÇAS DE PLANTAS, PROTEGER PLANTAS DE CULTIVO E MELHORAR O RENDIMENTO DOS CULTIVOS".**

Composições fungicidas convencionais tiveram problemas técnicos tal que tanto um efeito preventivo como curativo é inadequado, o efeito residual tende a ser inadequado, ou o efeito de controle contra doenças de plantas tende a ser inadequado dependendo do local de aplicação, e uma composição fungicida para superar tais problemas tem sido desejada. A presente invenção refere-se a uma composição fungicida que contém um derivado de amida de ácido carboxílico da fórmula (I) ou um sal disso, como um ingrediente ativo.



(I)

em que A é fenila que pode ser substituída, benzodioxolanila que pode ser substituída, ou benzodioxanila que pode ser substituída; B é 2- ou 3-piridila que pode ser substituída; cada um de R^1 e R^2 é alquila, ou R^1 e R^2 podem formar juntos um ânel de carbono saturado de 3 a 6 membros; contanto que quando B for 3-piridila que pode ser substituída, A for fenila substituída por pelo menos dois substituintes.