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

(11) PI 0616000-0 B1

(22) Data do Depósito: 12/09/2006

(45) Data de Concessão: 19/04/2016

(RPI 2363)

(54) Título: COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, PROCESSO DE PREPARAÇÃO DE COMPOSTO, COMPOSTO DERIVADO DE NITROFENILÉTER, COMPOSTO DERIVADO DE AMINOFENILÉTER, MÉTODO DE CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE SAFRAS E MÉTODO DE CONTROLE DE INSETOS DANINHOS.

(51) Int.Cl.: A01N 43/40; A01N 47/12; A01N 49/00; A01N 37/52; A01N 47/30; C07C 257/12; C07C 257/14; C07C 335/18; C07D 295/182

(52) CPC: A01N 43/40; A01N 47/12; A01N 49/00

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

(72) Inventor(es): PETER LUEMMEN, KLAUS KUNZ, JÖRG GREUL, OLIVER GUTH, BENOIT HARTMANN, KERSTIN ILG, WAHED MORADI, THOMAZ SEITZ, DARREN MANSFIELD, JEAN-PIERRE VORS, PETER DAHMEN, ARND VOERSTE, ULRIKE WACHENDORFF-NEUMANN, MARIE-CLAIRE GROSJEAN-COURNOYER, MARK DREWES, RALF DUNKEL, RONALD EBBERT

"COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, PROCESSO DE PREPARAÇÃO DE COMPOSTO, COMPOSTO DERIVADO DE NITROFENILÉTER, COMPOSTO DERIVADO DE AMINOFENILÉTER, MÉTODO DE CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE SAFRAS E MÉTODO DE CONTROLE DE INSETOS DANINHOS"

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a derivados de fenil-amidina 4-fenilóxi-substituídos 2,5-di-substituídos, notadamente derivados de fenil-amidina 2,5-dialquil-4-fenilóxi-substituídos, seu processo de preparação, seu uso como agentes ativos inseticidas ou fungicidas, particularmente na forma de composições fungicidas ou inseticidas, e métodos de controle de fungos fitopatogênicos ou insetos daninhos, notadamente de plantas, utilizando estes compostos ou composições.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

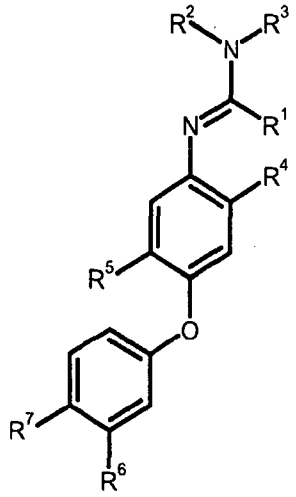
No Pedido de Patente Internacional WO 00/46184, são descritos certos derivados de fenil-amidina. Esse documento, entretanto, não descreve especificamente nem sugere a seleção dos compostos em que o anel fenila é substituído de acordo com a presente invenção, de forma a permitir atividade inseticida ou fungicida inesperada e significativamente mais alta.

É sempre de alto interesse na agricultura o uso de compostos pesticidas inovadores, a fim de evitar ou controlar o desenvolvimento de linhagens resistentes aos ingredientes ativos. Também é de alto interesse o uso de compostos inovadores que sejam mais ativos que os já conhecidos, com o propósito de reduzir as quantidades de composto ativo a serem utilizadas, mantendo ao mesmo tempo eficácia ao menos equivalente aos compostos já conhecidos. Da mesma forma, sempre é também de alto

interesse o uso de agentes inseticidas, nematicidas ou acaricidas inovadores para controlar insetos ou outros organismos daninhos. Revelamos agora nova família de compostos que possuem os efeitos ou vantagens mencionados acima.

DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

Conseqüentemente, a presente invenção fornece derivados de fenil-amidina 4-fenilóxi-substituídos 2,5-di-substituídos da fórmula (I):



(I)

em que:

- R^1 representa H, alquila C_1-C_{12} substituída ou não substituída, alquenila C_2-C_{12} substituída ou não substituída, alquinila C_2-C_{12} substituída ou não substituída, SH ou S-alquila C_1-C_{12} substituída ou não substituída;
- R^2 representa alquila C_1-C_{12} substituída ou não substituída;
- R^3 representa alquila C_2-C_{12} substituída ou não substituída, cicloalquila C_3-C_6 substituída ou não substituída, alquenila C_2-C_{12} substituída ou não substituída, alquinila C_2-C_{12} substituída ou não substituída, halogênio-alquila C_1-C_{12}; ou
- R^1 e R^2, R^1 e R^3 ou R^2 e R^3 podem juntos formar heterociclo de 5 a 7 membros substituído ou não substituído;
- R^4 representa alquila C_1-C_{12} substituída ou não substituída, átomo

de halogênio, halogênio-alquila C_1-C_{12}, O-alquila C_1-C_{12} substituíd a ou não substituída ou ciano;

- R^5 representa H, alquila C_1-C_{12} substituída ou não substituída, átomo de halogênio, halogênio-alquila C_1-C_{12}, O-alquila C_1-C_{12} substituída ou não substituída ou ciano;

- R^6 representa alquila C_1-C_6 linear ou ramificada que pode ser não substituída ou substituída por substituinte selecionado a partir da lista que consiste de alcóxi, haloalcóxi, alquiltio e dialquilamino; e

- R^7 representa halogênio ou ciano;

bem como seus sais, N-óxidos, complexos metálicos, complexos metalóidicos e isômeros opticamente ativos ou geométricos.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

Qualquer dos compostos de acordo com a presente invenção pode existir em uma ou mais formas de isômeros óticos ou quirais, dependendo da quantidade de centros assimétricos no composto. A presente invenção refere-se igualmente, portanto, a todos os isômeros óticos e a suas misturas racêmicas ou escalêmicas (o termo "escalêmicas" indica mistura de enantiômeros em diferentes proporções) e às misturas de todos os estereoisômeros possíveis, em todas as proporções. Os diaestereoisômeros e/ou os isômeros óticos podem ser separados de acordo com os métodos intrinsecamente conhecidos pelos técnicos comuns no assunto.

Qualquer dos compostos de acordo com a presente invenção pode também existir em uma ou mais formas de isômeros geométricos, dependendo da quantidade de ligações duplas no composto. A presente invenção refere-se igualmente, portanto, a todos os isômeros geométricos e a todas as misturas possíveis, em todas as proporções. Os isômeros geométricos podem ser separados de acordo com métodos gerais, que são intrinsecamente conhecidos pelos técnicos comuns no assunto.

Para os compostos de acordo com a presente invenção, halogênio indica um dentre flúor, bromo, cloro ou iodo e heteroátomo pode ser nitrogênio, oxigênio ou enxofre.

Os compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^1 representa H; alquila C_1-C_{12}, preferencialmente alquila C_1-C_{12} como metila e etila; ou SH.

Outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^2 representa metila ou etila.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^3 representa alquila C_2-C_{12}, preferencialmente alquila C_2-C_4 não substituída como etila, n-propila, i-propila, alquenila C_2-C_{12}, preferencialmente alquenila C_3-C_4 como propenila ou alila; cicloalquila C_3-C_6 como ciclopropila.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^2 e R^3 podem juntos formar heterociclo de 5 a 7 membros substituído ou não substituído, preferencialmente heterociclo de 6 membros, de maior preferência pipiridinila ou pirrolidinila, de preferência ainda maior pirrolidinila bis-alquilado como bis-metil-pirrolidinila.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^4 representa alquila C_1-C_{12}, preferencialmente alquila C_1-C_{12} não substituída como metila e etila; átomo de halogênio como átomo de cloro.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^5 representa alquila C_1-C_{12}, preferencialmente alquila C_1-C_{12} não substituída como metila e etila; átomo de halogênio como átomo de cloro.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a

presente invenção são aqueles em que R^6 representa alquila C_1-C_6 linear ou ramificada, preferencialmente R^6 é selecionado a partir da lista que consiste de metila, etila, n-propila, i-propila, t-butila, n-butila, i-butila, s-butila.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^7 representa halogênio, preferencialmente F, Cl ou Br.

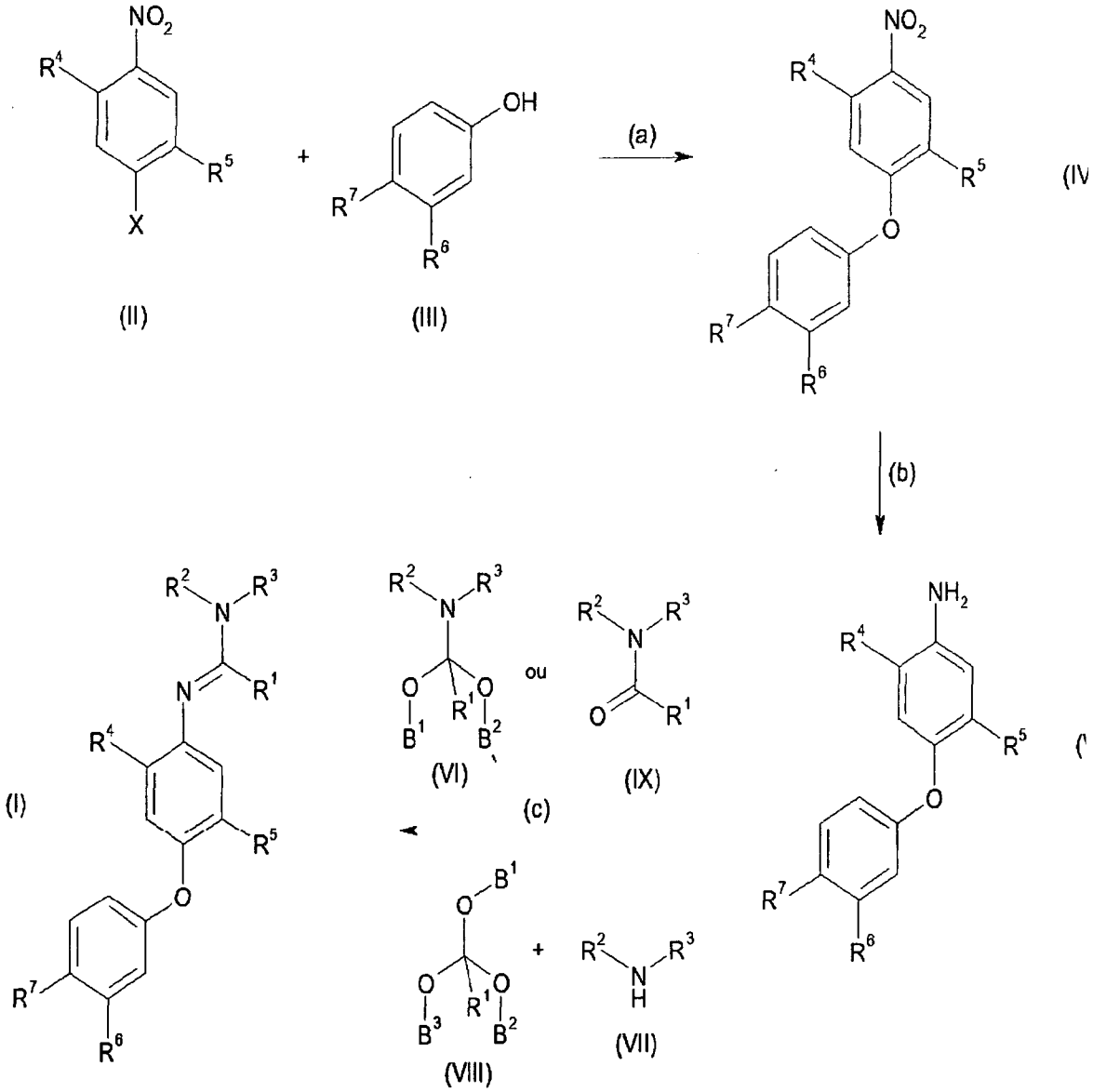
As preferências mencionadas acima com relação aos substituintes dos compostos de acordo com a presente invenção podem ser combinadas de várias formas. Estas combinações de características preferidas fornecem, desta forma, subclasses de compostos de acordo com a presente invenção. Exemplos dessas subclasses de compostos preferidos de acordo com a presente invenção podem combinar:

- características preferidas de R^1 com características preferidas de R^2 a R^7;
- características preferidas de R^2 com características preferidas de R^1 a R^7;
- características preferidas de R^3 com características preferidas de R^1 a R^7;
- características preferidas de R^4 com características preferidas de R^1 a R^7;
- características preferidas de R^5 com características preferidas de R^1 a R^7;
- características preferidas de R^6 com características preferidas de R^1 a R^7.

Nestas combinações de características preferidas dos substituintes dos compostos de acordo com a presente invenção, as mencionadas características preferidas podem também ser selecionadas dentre as características de maior preferência de cada um dentre R^1 a R^7 e A,

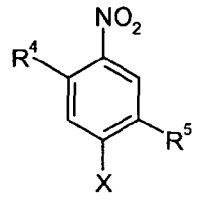
de maneira a formar as subclasses de maior preferência de compostos de acordo com a presente invenção.

A presente invenção também se refere a processo de preparação de compostos da fórmula (I). Geralmente, a preparação de composto da fórmula (I) de acordo com a presente invenção pode ser conduzida conforme ilustrado pelo Esquema 1.



ESQUEMA 1

Derivados de nitrofeniléter da fórmula (IV) podem ser obtidos de acordo com o processo (a) por meio de reação de derivados de nitrobenzeno da fórmula (II):

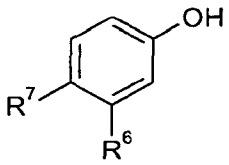


(II)

em que:

- R^4 e R^5 são conforme definidos no presente;
- X representa halogênio, triflato, SOMe, mesilato ou tosilato;

com derivados de fenol da fórmula (III):



(III)

em que:

- R^6 e R^7 são conforme definidos no presente.

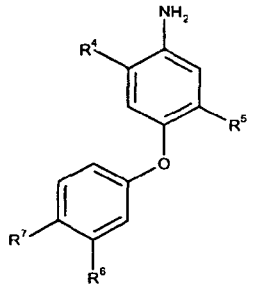
O processo (a) de acordo com a presente invenção pode compreender adicionalmente uma ou mais das características a seguir:

- presença de base;
- presença de diluente orgânico inerte;
- presença de catalisador.

Derivados de fenol da fórmula (III) são conhecidos e podem ser preparados por meio de processos conhecidos.

Derivados de anilina da fórmula (V) podem ser obtidos de acordo com o processo (b) por meio de redução de derivados de nitrofeniléter da fórmula (IV). Preferencialmente, a reação de redução é conduzida na presença de cloreto de estanho em ácido clorídrico concentrado.

Os derivados de amidina da fórmula (I) podem ser obtidos de acordo com o processo (c) por meio de reação de derivados de anilina da fórmula (V):



(V)

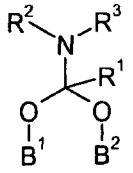
em que:

- R^4, R^5, R^6 e R^7 são conforme definidos no presente.

Várias alternativas de processo (c) de preparação de derivados de amidina da fórmula (I) de acordo com a presente invenção podem ser consideradas. Elas são definidas como processo (c1), processo (c2) e processo (c3) de acordo com a presente invenção.

O processo (c) de acordo com a presente invenção compreende a reação de derivados de anilina da fórmula (V) com diferentes reagentes, de forma a definir os processos (c1), (c2) e (c3), respectivamente.

O processo (c1) é conduzido utilizando adicionalmente derivados aminoacetais da fórmula (VI):



(VI)

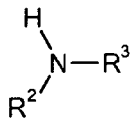
em que:

- R^1, R^2 e R^3 são conforme definidos no presente;
- B^1 e B^2 representam independentemente alquila ou, juntos, cicloalquila.

O processo (c1) de acordo com a presente invenção pode compreender ainda uma ou mais das características a seguir:

- presença de ácido ou base;
- presença de diluente.

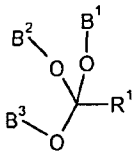
O processo (c2) é conduzido utilizando adicionalmente derivados de amina da fórmula (VII):



(VII)

em que:

- R^2 e R^3 são conforme definidos no presente; na presença de derivados de ortoéster da fórmula (VIII):

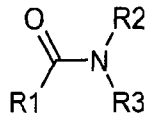


(VIII)

em que:

- R^1 é conforme definido no presente; e
- B^1, B^2 e B^3 representam independentemente alquila.

O processo (c3) é conduzido utilizando adicionalmente derivados de amida da fórmula (IX):



(IX)

em que:

- R^1, R^2 e R^3 são conforme definidos no presente.

O processo (c3) de acordo com a presente invenção pode compreender adicionalmente uma ou mais das características a seguir:

- presença de agente de halogenação, como PCl_5, PCl_3, $POCl_3$ e $SOCl_2$;
- presença de diluente.

Os diluentes apropriados para condução dos processos (a) e (b) de

acordo com a presente invenção são todos solventes orgânicos inertes costumeiros. Dá-se preferência ao uso de hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalin; hidrocarbonetos halogenados, tais como clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como dietil éter, diisopropil éter, metil terc-butil éter, metil terc-amil éter, dioxano, tetraidrofuran, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; suas misturas com água ou água pura.

Diluentes apropriados para condução dos processos (c1), (c2) e (c3) de acordo com a presente invenção são, em cada caso, todos solventes orgânicos inertes costumeiros. Dá-se preferência ao uso de hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalin; éteres, tais como dietil éter, diisopropil éter, metil terc-butil éter, metil terc-amil éter, dioxano, tetraidrofuran, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; ésteres, tais como acetato de metila ou acetato de etila; sulfóxidos, tais como sulfóxido de dimetila; ou sulfonas, tais como sulfolano; álcoois, tais como metanol, etanol, n ou iso-propanol, n, iso, sec ou terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, dietileno-glicolmonometiléter, dietilenoglicolmonoetiléter; suas misturas com água ou água pura.

Aglutinantes ácidos apropriados para condução dos processos (a) e (b) de acordo com a presente invenção são todas bases orgânicas e

inorgânicas costumeiras para estas reações. Dá-se preferência ao uso de hidretos de metais alcalino-terrosos ou metais álcali, hidróxidos, amidas, alcoolatos, acetatos, carbonatos ou carbonatos de hidrogênio, tais como hidreto de sódio, amida de sódio, diisopropilamida de lítio, metanolato de sódio, etanolato de sódio, terc-butanolato de potássio, acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio ou carbonato de amônio; e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N, N-dimetilanilina, N, N-dimetil-benzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N, N-dimetilamino-piridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) ou di-azabiciclоundeceno (DBU).

Aglutinantes ácidos apropriados para a condução dos processos (b) e (c) de acordo com a presente invenção são, em cada caso, todas bases orgânicas e inorgânicas costumeiras para estas reações. Dá-se preferência ao uso de hidretos de metais alcalino-terrosos ou metais álcali, hidróxidos, amidas, alcoolatos, acetatos, fluoretos, fosfatos, carbonatos ou carbonatos de hidrogênio, tais como hidreto de sódio, amida de sódio, diisopropilamida de lítio, metanolato de sódio, etanolato de sódio, terc-butanolato de potássio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, acetato de sódio, fosfato de sódio, fosfato de potássio, fluoreto de potássio, fluoreto de césio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogeniocarbonato de potássio, hidrogeniocarbonato de sódio ou carbonato de césio; e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N, N-dimetilanilina, N, N-dimetil-benzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N, N-dimetilamino-piridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiciclononeno (DBN) ou di-azabiciclоundeceno (DBU).

Ácidos apropriados para a condução do processo (c1) de acordo

com a presente invenção são todos ácidos orgânicos e inorgânicos costumeiros para estas reações. Dá-se preferência ao uso de ácido para-tolueno sulfônico, ácido metano sulfônico, ácido clorídrico (solução de gás, aquosa ou orgânica) ou ácido sulfúrico.

Agentes de condensação apropriados para a condução do processo (c3) de acordo com a presente invenção são todos agentes de condensação costumeiros para essas reações de amidação. Dá-se preferência ao uso de formador de haletos ácidos, tal como fosgênio, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, tricloreto óxido de fósforo ou cloreto de tionila; formador de anidrido, tal como cloroformato de etila, cloroformato de metila, cloroformato de isopropila, cloroformato de isobutila ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidas, tais como N, N'-diciclo-hexilcarbodiimida (DCC) ou outros agentes de condensação costumeiros, tais como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N, N'-carbonildiimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonil-1,2-di-hidroquinolina (EDDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano ou hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfônio.

Os compostos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção podem ser preparados de acordo com os processos descritos no presente. Compreender-se-á, entretanto, que, com base no seu conhecimento geral e em publicações disponíveis, os técnicos no assunto serão capazes de adaptar estes processos de acordo com as especificidades de cada um dos compostos que se deseja sintetizar.

Em aspecto adicional, a presente invenção também se refere à composição fungicida ou inseticida que compreende quantidade eficaz e não fitotóxica de composto ativo da fórmula (I). A expressão "quantidade eficaz e não fitotóxica" indica quantidade de composição de acordo com a presente invenção que é suficiente para controlar ou destruir os fungos presentes ou propensos a aparecer sobre as safras e que não apresenta nenhum sintoma

apreciável de fitotoxicidade para as mencionadas safras. Essa quantidade pode variar dentro de ampla faixa, dependendo do fungo a ser controlado, do tipo de safra, das condições climáticas e dos compostos incluídos na composição fungicida de acordo com a presente invenção. Esta quantidade pode ser determinada por meio de testes de campo sistemáticos, que se encontram dentro das capacidades dos técnicos no assunto.

Desta forma, de acordo com a presente invenção, é fornecida composição fungicida ou inseticida que compreende, como ingrediente ativo, quantidade eficaz de composto da fórmula (I) conforme definido no presente e suporte, veículo ou carga aceitável para uso agrícola.

Segundo a presente invenção, o termo "suporte" indica composto orgânico ou inorgânico, natural ou sintético, com o qual o composto ativo da fórmula (I) é combinado ou associado para facilitar a aplicação, notadamente às partes da planta. Este suporte é, desta forma, geralmente inerte e deverá ser aceitável para uso agrícola. O suporte pode ser sólido ou líquido. Exemplos de suportes apropriados incluem argilas, silicatos naturais ou sintéticos, sílica, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, água, álcoois, particularmente butanol, solventes orgânicos, óleos vegetais e minerais e seus derivados. Misturas destes suportes podem também ser utilizadas.

A composição de acordo com a presente invenção pode também compreender componentes adicionais. Particularmente, a composição pode compreender adicionalmente tensoativo. O tensoativo pode ser emulsificante, agente dispersante ou agente umectante do tipo iônico ou não iônico ou mistura desses tensoativos. Pode-se fazer menção, por exemplo, de sais de ácido poliacrílico, sais de ácido lignossulfônico, sais de ácido fenolsulfônico ou naftalenossulfônico, policondensados de óxido de etileno com álcoois graxos ou com ácidos graxos ou com aminas graxas, fenóis substituídos (particularmente alquilfenóis ou arilfenóis), sais de ésteres de ácido

sulfossuccínico, derivados de taurina (particularmente tauratos de alquila), ésteres fosfóricos de fenóis ou álcoois polioxietilados, ésteres de ácidos graxos de polióis e derivados dos compostos do presente que contêm funções sulfato, sulfonato e fosfato. A presença de pelo menos um tensoativo geralmente é essencial quando o composto ativo e/ou o suporte inerte são insolúveis em água e quando o agente de vetor para a aplicação for água. Preferencialmente, o teor de tensoativo pode estar compreendido de 5% a 40% em peso da composição.

Opcionalmente, podem também ser incluídos componentes adicionais, tais como colóides protetores, adesivos, espessantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetração, estabilizantes e agentes seqüestrantes. Mais geralmente, os compostos ativos podem ser combinados com qualquer aditivo sólido ou líquido que atenda aos métodos de formulação habituais.

Geralmente, a composição de acordo com a presente invenção pode conter de 0,05 a 99% em peso de composto ativo, preferencialmente de 10 a 70% em peso.

As composições de acordo com a presente invenção podem ser utilizadas em várias formas, tais como aplicador de aerossol, isca (pronta para uso), concentrado de isca, isca em blocos, suspensão de cápsulas, concentrado de nebulização fria, pó polvilhável, concentrado emulsionável, emulsão de óleo em água, emulsão de água em óleo, grânulos encapsulados, grânulos finos, concentrado fluido para tratamento de sementes, gás (sob pressão), produto gerador de gás, grãos de isca, isca granular, grânulos, concentrado de termonebulização, macrogrânulos, microgrânulos, pó dispersível em óleo, concentrado fluido miscível em óleo, líquido miscível em óleo, pasta, radículas de plantas, isca em placas, pó para tratamento de sementes secas, isca raspada, sementes revestidas com pesticida, vela de fumaça, cartucho de fumaça, gerador de fumaça, pelota de fumaça, vara de

fumaça, pastilha de fumaça, lata de fumaça, concentrado solúvel, pó solúvel, solução para tratamento de sementes, concentrado em suspensão (= concentrado fluido), pó de rastreamento, líquido com ultra baixo volume (ulv), suspensão com ultra baixo volume (ulv), produto de liberação de vapor, pastilhas ou grânulos dispersíveis em água, pó dispersível em água para tratamento de calda, pastilhas ou grânulos hidrossolúveis, pó hidrossolúvel para tratamento de sementes e pó molhável.

Estas composições incluem não apenas composições que são prontas para aplicação à planta ou semente a ser tratada por meio de dispositivo apropriado, tal como dispositivo de pulverização ou de polvilhamento, mas também composições comerciais concentradas que devem ser diluídas antes da aplicação à safra.

Os compostos de acordo com a presente invenção podem também ser misturados com uma ou mais substâncias ativas inseticidas, fungicidas, bactericidas, atrativas, acaricidas ou feromônios, ou outros compostos com atividade biológica. As misturas obtidas desta forma possuem espectro de atividade ampliado.

As misturas com outros compostos fungicidas são particularmente vantajosas. Exemplos de parceiros de mistura de fungicidas apropriados podem ser selecionados a partir das relações a seguir:

b1. composto capaz de inibir a síntese de ácidos nucléicos tais como benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, quiralaxil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico;

b2. composto capaz de inibir a mitose e a divisão celular tal como benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metil, zoxamida;

b3. composto capaz de inibir a respiração, tal como:

- inibidor da respiração CI, como diflumetorim;

- inibidor da respiração CII, como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida;

- inibidor da respiração CIII, como azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, cresoxim-metil, metominostrobin, orisastrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin;

b4. composto capaz de agir como desacoplador, como dinocap, fluaxinam;

b5. composto capaz de inibir a produção de ATP, como acetato de fentin, cloreto de fentin, hidróxido de fentin, siltiofam;

b6. composto capaz de inibir AA e a biossíntese de proteínas, como andoprim, blasticidin-S, ciprodinil, casugamicin, hidrato cloridrato de casugamicin, mepanipirim, pirimetanil;

b7. composto capaz de inibir a transdução de sinais como fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen;

b8. composto capaz de inibir a síntese de membranas e lipídios, como clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofós, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotiolano, tolclofós-metil, bifenila, iodocarb, propamocarb, cloridrato de propamocarb;

b9. composto capaz de inibir a biossíntese de ergosterol, como fenhexamid, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin,

espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

b10. composto capaz de inibir a síntese de paredes celulares como bentiavalicarb, bialafós, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicin A;

b11. composto capaz de inibir a biossíntese de melamina como carpropamid, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilon, triciclazol;

b12. composto capaz de induzir defesa de hospedeiros, como acibenzolar-S-metil, probenazol, tiadinil;

b13. composto capaz de ter ação em múltiplos locais, como captafol, captan, clorotalonil, preparações de cobre tais como hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxicloreto de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre e mistura de Bordéus, diclofluanid, ditianon, dodina, base livre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram-zinco, propineb, enxofre e preparações de enxofre, que incluem polissulfeto de cálcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram;

b14. composto selecionado a partir da lista a seguir: amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicin, carvona, chinometionat, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofen, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetil-alumínio, fosetil-cálcio, fosetil-sódio, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicin, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metila, mildiomicin, natamicin, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotalisopropila, octilinona, oxamocarb, oxifentiin, pentaclorofenol e seus sais, 2-fenilfenol e seus sais, ácido fosforoso e seus sais, piperalin, propanosina-sódio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozene, tecloftalam, tecnazene, triazóxido, triclamida, zarilamid e 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-

nitrofenil)-N-etil-4-metil-benzenossulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolocarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-di-hidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridinocarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 1-(2,3-di-hidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazolo-5-carboxilato de metila, 3,4,5-trimetil-2,6-piridinocarbonitrila, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetileno)-benzenoacetato de metila, 4-cloro-alfa-propinilóxi-N-[2-[3-metóxi-4-(2-propinilóxi)fenil]etil]-benzenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]óxi]-3-metilfenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butóxi-6-iodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-{(Z)-[(cicloropilmetóxi)imino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidróxi-benzamida, 2-[[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)óxi]fenil]etilideno]amino]óxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-benzenoacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, 2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenóxi)-5-fluoropirimidin-4-il]óxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazolo-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazolo-1-carbotióico.

A composição de acordo com a presente invenção que compreende mistura de composto da fórmula (I) com composto bactericida pode também ser particularmente vantajosa. Exemplos de parceiros de mistura

bactericidas apropriados podem ser selecionados a partir da relação a seguir: bronopol, diclorofen, nitrapirin, dimetilditiocarbamato de níquel, casugamicin, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicin, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

O composto da fórmula (I) e a composição fungicida de acordo com a presente invenção podem ser utilizados para controlar curativa ou preventivamente os fungos fitopatogênicos de plantas ou safras. Desta forma, segundo aspecto adicional da presente invenção, é fornecido método de controle curativo ou preventivo dos fungos fitopatogênicos de plantas ou safras, caracterizado pelo fato de que composto da fórmula (I) ou composição fungicida de acordo com a presente invenção é aplicada à semente, planta ou fruta da planta ou ao solo em que a planta está crescendo ou onde se deseja que ela cresça.

Da mesma forma, o composto da fórmula (I) e a composição inseticida de acordo com a presente invenção podem ser utilizados para controlar curativa ou preventivamente insetos daninhos, notadamente de plantas ou safras. Desta forma, de acordo com aspecto adicional da presente invenção, é fornecido método de controle curativo ou preventivo de insetos daninhos, notadamente de plantas ou safras, caracterizado pelo fato de que composto da fórmula (I) ou composição inseticida de acordo com a presente invenção é aplicada à semente, planta ou fruto da planta ou ao solo em que a planta está crescendo ou onde se deseja que ela cresça.

Os métodos de tratamento de acordo com a presente invenção podem também ser úteis para tratar material de propagação tais como tubérculos ou rizomas, mas também sementes, mudas ou mudas emergentes e plantas ou plantas emergentes. Estes métodos de tratamento podem também ser úteis para o tratamento de raízes. Os métodos de tratamento de acordo com a presente invenção podem também ser úteis para tratar as partes aéreas

das plantas, tais como troncos, hastes ou caules, folhas, flores e frutas da planta em questão. Dentre as plantas que podem ser protegidas por meio do método de acordo com a presente invenção, pode-se fazer menção de: algodão; linho; uva; safras de frutas ou legumes tais como *Rosaceae sp* (tais como frutas com sementes, como maçãs e pêras, mas também drupas, tais como damascos, amêndoas e pêssegos), *Ribesioidae sp*, *Juglandaceae sp*, *Betulaceae sp*, *Anacardiaceae sp*, *Fagaceae sp*, *Moraceae sp*, *Oleaceae sp*, *Actinidaceae sp*, *Lauraceae sp*, *Musaceae sp* (tais como bananeiras e plantações de bananas), *Rubiaceae sp*, *Theaceae sp*, *Sterculiceae sp*, *Rutaceae sp* (tais como limões, laranjas e toronjas), *Solanaceae sp* (tais como tomaes), *Liliaceae sp*, *Asteraceae sp* (tais como alface), *Umbelliferae sp*, *Cruciferae sp*, *Chenopodiaceae sp*, *Cucurbitaceae sp*, *Papillionaceae sp* (tais como ervilhas), *Rosaceae sp* (tais como morangos), safras importantes, como *Graminae sp* (tais como milho, grama ou cereais como trigo, arroz, cevada e triticale), *Asteraceae sp* (tais como girassol), *Cruciferae sp* (tais como colza), *Fabacae sp* (tais como amendoins), *Papilionaceae sp* (tais como soja), *Solanaceae sp* (tais como batatas), *Chenopodiaceae sp* (tais como beterraba), safras de hortas e florestas, bem como homólogos geneticamente modificados destas safras.

Dentre as doenças de plantas ou safras que podem ser controladas por meio do método fungicida de acordo com a presente invenção, pode-se fazer menção de:

doenças de míldeo do pó, tais como:

- doenças de Blumeria, causadas, por exemplo, por *Blumeria graminis*;
- doenças de Podosphaera, causadas, por exemplo, por *Podosphaera leucotricha*;
- doenças de Sphaerotheca, causadas, por exemplo, por

Sphaerotheca fuliginea;

- doenças de Uncinula, causadas, por exemplo, por *Uncinula necator*;
- doenças da ferrugem, tais como:
- doenças de Gymnosporangium, causadas, por exemplo, por *Gymnosporangium sabinae*;
- doenças de Hemileia, causadas, por exemplo, por *Hemileia vastatrix*;
- doenças de Phakopsora, causadas, por exemplo, por *Phakopsora pachyrhizi* ou *Phakopsora meibomiae*;
- doenças de Puccinia, causadas, por exemplo, por *Puccinia recondita*;
- doenças de Uromyces, causadas, por exemplo, por *Uromyces appendiculatus*;
- doenças de Oomycete, tais como:
- doenças de Bremia, causadas, por exemplo, por *Bremia lactucae*;
- doenças de Peronospora, causadas, por exemplo, por *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*;
- doenças de Phytophthora, causadas, por exemplo, por *Phytophthora infestans*;
- doenças de Plasmopara, causadas, por exemplo, por *Plasmopara viticola*;
- doenças de Pseudoperonospora, causadas, por exemplo, por *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*;
- doenças de Pythium, causadas, por exemplo, por *Pythium ultimum*;
- doenças de manchas das folhas, ferrugem das folhas e manchas

das folhas, tais como:

- doenças de Alternaria, causadas, por exemplo, por *Altemaria solani*;
- doenças de Cercospora, causadas, por exemplo, por *Cercospora beticola*;
- doenças de Cladiosporum, causadas, por exemplo, por *Cladiosporium cucumerinum*;
- doenças de Cochliobolus, causadas, por exemplo, por *Cochliobolus sativus*;
- doenças de Colletotrichum, causadas, por exemplo, por *Colletotrichum lindemuthanium*;
- doenças de Cycloconium, causadas, por exemplo, por *Cycloconium oleaginum*;
- doenças de Diaporthe, causadas, por exemplo, por *Diaporthe citri*;
- doenças de Elsinoe, causadas, por exemplo, por *Elsinoe fawcettii*;
- doenças de Gloeosporium, causadas, por exemplo, por *Gloeosporium laeticolor*;
- doenças de Glomerella, causadas, por exemplo, por *Glomerella cingulata*;
- doenças de Guignardia, causadas, por exemplo, por *Guignardia bidwelli*;
- doenças de Leptosphaeria, causadas, por exemplo, por *Leptosphaeria maculans*, *Leptosphaeria nodorum*;
- doenças de Magnaporthe, causadas, por exemplo, por *Magnaporthe grisea*;
- doenças de Mycosphaerella, causadas, por exemplo, por

Mycosphaerella graminicola, *Mycosphaerella arachidicola*, *Mycosphaerella fijiensis*;

- doenças de Phaeosphaeria, causadas, por exemplo, por *Phaeosphaeria nodorum*;
- doenças de Pyrenophora, causadas, por exemplo, por *Pyrenophora teres*;
- doenças de Ramularia, causadas, por exemplo, por *Ramularia collo-cygni*;
- doenças de Rhynchosporium, causadas, por exemplo, por *Rhyncosporium secalis*;
- doenças de Septoria, causadas, por exemplo, por *Septoria apii* ou *Septoria lycopercisi*;
- doenças de Typhula, causadas, por exemplo, por *Typhula incarnata*;
- doenças de Venturia, causadas, por exemplo, por *Venturia inaequalis*;
- doenças das hastes e raízes, tais como:
  - doenças de Corticium, causadas, por exemplo, por *Corticium graminaerum*;
  - doenças de Fusarium, causadas, por exemplo, por *Fusarium oxysporum*;
  - doenças de Gaeumannomyces, causadas, por exemplo, por *Gaeumannomyces graminis*;
  - doenças de Rhizoctonia, causadas, por exemplo, por *Rhizoctonia solani*;
  - doenças de Tapesia, causadas, por exemplo, por *Tapesia acuformis*;
  - doenças de Thielaviopsis, causadas, por exemplo, por

Thielaviopsis basicola;

- doenças das espigas e panículos, tais como:
  - doenças de Alternaria, causadas, por exemplo, por *Alternaria spp*;
  - doenças de Aspergillus, causadas, por exemplo, por *Aspergillus flavus*;
  - doenças de Cladosporium, causadas, por exemplo, por *Cladosporium spp*;
  - doenças de Claviceps, causadas, por exemplo, por *Claviceps purpurea*;
  - doenças de Fusarium, causadas, por exemplo, por *Fusarium culmorum*;
  - doenças de Gibberella, causadas, por exemplo, por *Gibberella zeae*;
  - doenças de Monographella, causadas, por exemplo, por *Monographella nivalis*;
- doenças da fuligem e fungos, tais como:
  - doenças de Sphacelotheca, causadas, por exemplo, por *Sphacelotheca reiliana*;
  - doenças de Tilletia, causadas, por exemplo, por *Tilletia caries*;
  - doenças de Urocystis, causadas, por exemplo, por *Urocystis occulta*;
  - doenças de Ustilago, causadas, por exemplo, por *Ustilago nuda*;
- doenças dos fungos e podridão das frutas, tais como:
  - doenças de Aspergillus, causadas, por exemplo, por *Aspergillus flavus*;
  - doenças de Botrytis, causadas, por exemplo, por *Botrytis cinerea*;

- doenças de Penicillium, causadas, por exemplo, por *Penicillium expansum*;
- doenças de Sclerotinia, causadas, por exemplo, por *Sclerotinia sclerotiorum*;
- doenças de Verticilium, causadas, por exemplo, por *Verticilium alboatrum*;
- doenças de deterioração, fungos, murchar, podridão e apodrecimento de sementes e com base em solo:
- doenças de Fusarium, causadas, por exemplo, por *Fusarium culmorum*;
- doenças de Phytophthora, causadas, por exemplo, por *Phytophthora cactorum*;
- doenças de Pythium, causadas, por exemplo, por *Pythium ultimum*;
- doenças de Rhizoctonia, causadas, por exemplo, por *Rhizoctonia solani*;
- doenças de Sclerotium, causadas, por exemplo, por *Sclerotium rolfsii*;
- doenças de Microdochium, causadas, por exemplo, por *Microdochium nivale*;
- doenças de cancro, vassoura e queda, tais como:
- doenças de Nectria, causadas, por exemplo, por *Nectria galligena*;
- doenças da ferrugem, tais como:
- doenças de Monilinia, causadas, por exemplo, por *Monilinia laxa*;
- doenças de ondulação das folhas ou inchaço das folhas, tais como:
- doenças de Taphrina, causadas, por exemplo, por *Taphrina*

deformans;

- doenças de declínio de plantas lenhosas, tais como:
  - doenças de Esca, causadas, por exemplo, por *Phaemoniella clamydospora*;
  - queda de Eutypa, causada, por exemplo, por *Eutypa lata*;
  - doença do elmo holandês, causada, por exemplo, por *Ceratocystis ulmi*;
- doenças das flores e sementes, tais como:
  - doenças de Botrytis, causadas, por exemplo, por *Botrytis cinerea*;
- doenças dos tubérculos, tais como:
  - doenças de Rhizoctonia, causadas, por exemplo, por *Rhizoctonia solani*.

Dentre as pragas ou insetos daninhos que podem ser controlados em qualquer estágio de desenvolvimento segundo o método inseticida de acordo com a presente invenção, pode-se fazer menção de:

- ordem de *Anoplura* (*Phthiraptera*), tais como *Damalinia spp*, *Haematopinus spp*, *Linognathus spp*, *Pediculus spp*, *Trichodectes spp*;
- classe de *Arachnida*, tais como *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops spp*, *Aculus spp*, *Amblyomma spp*, *Argas spp*, *Boophilus spp*, *Brevipalpus spp*, *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes spp*, *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus spp*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus spp*, *Eriophyes spp*, *Hemitarsonemus spp*, *Hyalomma spp*, *Ixodes spp*, *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus spp*, *Oligonychus spp*, *Ornithodoros spp*, *Panonychus spp*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psorotes spp*, *Rhipicephalus spp*, *Rhizoglyphus spp*, *Sarcoptes spp*, *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus spp*, *Tarsonemus spp*, *Tetranychus spp*, *Vasates lycopersici*;
- classe de *Bivalva*, tal como *Dreissena spp*;

- ordem de *Chilopoda*, tal como *Geophilus spp*, *Scutigera spp*;

- ordem de *Coleoptera*, tal como *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus spp*, *Agelastica alni*, *Agriotes spp*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora spp*, *Anthonomus spp*, *Anthrenus spp*, *Apogonia spp*, *Atomaria spp*, *Attagenus spp*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus spp*, *Ceuthorhynchus spp*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus spp*, *Cosmopolites spp*, *Costelytra zealandica*, *Curculio spp*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes spp*, *Diabrotica spp*, *Epilachna spp*, *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus aratos*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus spp*, *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus spp*, *Lyctus spp*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus spp*, *Monochamus spp*, *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga spp*, *Popillia japonica*, *Premnotrypes spp*, *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus spp*, *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus spp*, *Sphenophorus spp*, *Sternechus spp*, *Symphyletes spp*, *Tenebrio molitor*, *Tribolium spp*, *Trogoderma spp*, *Tychius spp*, *Xylotrechus spp*, *Zabrus spp*.

- ordem de *Collembola*, tal como *Onychiurus armatus*;

- ordem de *Dermaptera*, tal como *Forficula auricularia*;

- ordem de *Diplopoda*, tal como *Blaniulus guttulatus*;

- ordem de *Diptera*, tal como *Aedes spp*, *Anopheles spp*, *Bibo hortulanus*, *Calliph ora erytrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrys omyia spp*, *Chochliomyia spp*, *Cordylobia antropophaga*, *Culex spp*, *Cuterebra spp*, *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila spp*, *Fannia spp*, *Gastrophilus spp*, *Hylemyia spp*, *Hyppobosca spp*, *Hypoderma spp*, *Liriomyza spp*, *Lucilia spp*, *Musca spp*, *Nezara spp*, *Oestrus spp*, *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia spp*, *Stomoxys spp*, *Tabanus spp*, *Tannia spp*, *Tipula paludosa*,

Wohlfahrtia spp;

- classe de *Gastrodopa*, tal como *Arion spp*, *Biomphalaria spp*, *Bulinus spp*, *Deroceras spp*, *Galba spp*, *Lymnaea spp*, *Oncomelania spp*, *Succinea spp*;

- classe dos helmíntios, tais como *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Acylostoma braziliensis*, *Ancylostoma spp*, *Ascaris lubricoides*, *Ascaris spp*, *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum spp*, *Chabertia spp*, *Clonorchis spp*, *Cooperia spp*, *Dicrocoelium spp*, *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multiocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Faciola spp*, *Haemonchus spp*, *Heterakis spp*, *Hymenolepsis nana*, *Hyostrongulus spp*, *Loa Loa*, *Nematodirus spp*, *Oesophagostomum spp*, *Opisthorchis spp*, *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia spp*, *Paragonimus spp*, *Schistosomen spp*, *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Stronyloides spp*, *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongulus spp*, *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*;

- protozoários, tais como *Eimeria*;

- ordem de *Hepteroptera*, tal como *Anasa tristis*, *Antestiopsis spp*, *Blissus spp*, *Calocoris spp*, *Campylomma livida*, *Cavelerius spp*, *Cimex spp*, *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus spp*, *Euschistus spp*, *Eurygaster spp*, *Heliopeltis spp*, *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa spp*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus spp*, *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara spp*, *Oebalus spp*, *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus spp*, *Psallus seriatus*, *Pseudacysta persea*, *Rhodnius spp*, *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora spp*, *Stephanitis nashi*, *Tibraca spp*, *Triatoma spp*;

- ordem de *Homoptera*, tal como *Acyrthosipon spp*, *Aeneolamia*

spp, *Agonoscena spp*, *Aleurodes spp*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus spp*, *Amrasca spp*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella spp*, *Aphanostigma piri*, *Aphis spp*, *Arboridia apicalis*, *Aspidiella spp*, *Aspidiotus spp*, *Atanus spp*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia spp*, *Brachycaudus helichrysii*, *Brachycolus spp*, *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes spp*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus spp*, *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus spp*, *Dialeurodes spp*, *Diaphorina spp*, *Diaspis spp*, *Doralis spp*, *Drosicha spp*, *Dysaphis spp*, *Dysmicoccus spp*, *Empoasca spp*, *Eriosoma spp*, *Erythroneura spp*, *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya spp*, *Idiocerus spp*, *Idioscopus spp*, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium spp*, *Lepidosaphes spp*, *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum spp*, *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella spp*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus spp*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix spp*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia spp*, *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza spp*, *Parlatoria spp*, *Pemphigus spp*, *Peregriuns maidis*, *Phenacoccus spp*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera spp*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus spp*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus spp*, *Psylla spp*, *Pteromalus spp*, *Pyrilla spp*, *Quadraspidiotus spp*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus spp*, *Rhopalosiphum spp*, *Saissetia spp*, *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata spp*, *Sogatella furcifera*, *Sogatodes spp*, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis spp*, *Toxoptera spp*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza spp*, *Typhlocyba spp*, *Unaspis spp*, *Viteus vitifolii*;

- ordem de *Hymenoptera*, tal como *Diprion spp*, *Hoplocampa spp*, *Lasius spp*, *Monomorium pharaonis*, *Vespa spp*;

- ordem de *Isopoda*, tal como *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;

- ordem de *Isoptera*, tal como *Reticulitermes spp*, *Odontotermes spp*;

- ordem de *Lepidoptera*, tal como *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis spp*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia spp*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carbocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo spp*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus spp*, *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa spp*, *Feltia spp*, *Galleria mellonella*, *Helicoverpa spp*, *Heliothis spp*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma spp*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria spp*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria spp*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris spp*, *Plutella xylostella*, *Prodenia spp*, *Pseudaletia spp*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera spp*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia spp*;

- ordem de Orthoptera, tal como *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blatella germanica*, *Gryllotalpa spp*, *Leucophaea maderae*, *Locusta spp*, *Melanoplus spp*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*;

- ordem de *Siphonaptera*, tal como *Ceratophyllus spp*, *Xenopsylla cheopis*.

- ordem de *Symphyla*, tal como *Scutigerella immaculate*;

- ordem de *Thysanoptera*, tal como *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella spp*, *Heliothrips spp*, *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips spp*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips spp*, *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips spp*;

- ordem de *Thysanura*, tal como *Lepisma saccharina*;

- nematóides fitoparasíticos, incluindo, por exemplo, *Anguina spp*, *Aphelenchoides spp*, *Belonoaimus spp*, *Bursaphelenchus spp*, *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera spp*, *Heliocotylenchus spp*, *Heterodera spp*, *Longidorus spp*, *Meloidogyne spp*, *Pratylenchus spp*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus spp*, *Trichodorus spp*, *Tylenchorhynchus spp*, *Tylenchulus spp*, *Thylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema spp*;

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

- *Hymenopteron*, tal como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

- cupins, tais como *Kalotermes flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulermes santonensis*, *Reticullitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

- traças, tais como *Lepisma saccharina*;

- ordem de *Acarina*, tal como *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia spp*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodorus moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*;

- ordem de *Araneae*, tal como *Aviculariidae*, *Araneidae*;

- ordem de *Opiliones*, tal como *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;

- ordem de *Isopoda*, tal como *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- ordem de *Diplopoda*, tal como *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp*;
- ordem de *Chilopoda*, tal como *Geophilus spp*;
- ordem de *Zygentoma*, tal como *Ctenolepisma spp*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*;
- ordem de *Blattaria*, tal como *Blatta orientalies*, *Blatella germanica*, *Blatella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp*, *Parcoblatta spp*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*;
- ordem de *Saltatoria*, tal como *Acheta domesticus*;
- ordem de *Dermaptera*, tal como *Forficula auricularia*;
- ordem de *Isoptera*, tal como *Kalotermes spp*, *Reticulitermes spp*;
- ordem de *Psocoptera*, tal como *Lepinatus spp*, *Liposcelis spp*;
- ordem de *Coleoptera*, tal como *Anthrenus spp*, *Attagenus spp*, *Dermestes spp*, *Letheticus oryzae*, *Necrobia spp*, *Ptinus spp*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*;
- ordem de *Diptera*, tal como *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles spp*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila spp*, *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus spp*, *Sarcophaga carnaria*, *Simulium spp*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;
- ordem de *Lepidoptera*, tal como *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*;
- ordem de *Siphonaptera*, tal como *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopsis*;

- ordem de *Hymenoptera*, tal como *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula spp*, *Tetramorium caespitum*;

- ordem de *Anoplura*, tal como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus spp*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*;

- ordem de *Heteroptera*, tal como *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

A composição inseticida ou fungicida de acordo com a presente invenção pode também ser utilizada contra doenças fúngicas ou insetos daninhos propensos a crescimento ou ataque sobre ou no interior do lenho. O termo "lenho" indica todos os tipos de espécies de madeira e todos os tipos de trabalho dessa madeira destinados a construção, tais como madeira sólida, madeira de alta densidade, madeira laminada e compensado. O método de tratamento de lenho de acordo com a presente invenção consiste principalmente no contato de um ou mais compostos de acordo com a presente invenção, ou composição de acordo com a presente invenção; isso inclui, por exemplo, aplicação direta, pulverização, mergulhamento, injeção ou qualquer outro meio apropriado.

A dose de composto ativo normalmente aplicada no método de tratamento de acordo com a presente invenção é geral e convenientemente de 10 a 800 g/ha, preferencialmente de 50 a 300 g/ha para aplicações em tratamento foliar. A dose de substância ativa aplicada é geral e convenientemente de 2 a 200 g por 100 kg de semente, preferencialmente de 3 a 150 g por 100 kg de semente no caso de tratamento de sementes.

Compreende-se claramente que as doses indicadas no presente são fornecidas como exemplos ilustrativos do método de acordo com a presente invenção. Os técnicos no assunto saberão como adaptar as doses de aplicação, notadamente de acordo com a natureza da planta ou safra a ser tratada.

A composição fungicida ou inseticida de acordo com a presente invenção pode também ser utilizada no tratamento de organismos geneticamente modificados com os compostos de acordo com a presente invenção ou as composições agroquímicas de acordo com a presente invenção. Plantas geneticamente modificadas são plantas em cujo genoma gene heterólogo que codifica proteína de interesse foi integrado de forma estável. A expressão "gene heterólogo que codifica proteína de interesse" indica essencialmente genes que fornecem as novas propriedades agronômicas da planta transformada, ou genes para melhorar a qualidade agronômica da planta modificada.

Os compostos ou misturas de acordo com a presente invenção podem também ser utilizados para a preparação de composição útil para o tratamento curativo ou preventivo de doenças fúngicas humanas ou animais, tais como micoses, dermatoses, doenças de tricofiton e candidíases ou doenças causadas por *Aspergillus spp*, tais como *Aspergillus fumigatus*.

Os vários aspectos da presente invenção serão agora ilustrados com referência às tabelas de exemplos de compostos a seguir. As tabelas a seguir ilustram, de forma não limitadora, exemplos de compostos de acordo com a presente invenção.

Nos exemplos a seguir, M+1 (ou M-1) indica o pico de íon molecular, mais ou menos 1 a. m. u. (unidade de massa atômica), respectivamente, conforme observado em espectroscopia de massa, e M (ApcI+) indica o pico de íon molecular conforme encontrado por meio de ionização química sob pressão atmosférica positiva em espectroscopia de massa.

Nos exemplos a seguir os valores de logP foram determinados de acordo com a Diretiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por meio de HPLC (Cromatografia de Líquidos sob Alto Desempenho) sobre coluna de fase reversa (C18), utilizando o método descrito abaixo:

Temperatura: 40 °C; fases móveis: 0,1% ácido fórmico aquoso e acetonitrila; gradiente linear de 10% acetonitrila a 90% acetonitrila.

Conduziu-se calibragem utilizando alcan-2-onas não ramificadas (que compreendem de três a dezesseis átomos de carbono) com valores logP conhecidos (determinação dos valores logP pelos tempos de retenção utilizando interpolação linear entre duas alcanonas sucessivas).

Os valor máximos lambda foram determinados no máximo dos sinais cromatográficos utilizando espectro de UV de 190 nm a 400 nm.

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 1

N-ETIL-N-METIL-N'-[4-(3-T-BUTIL-4-CLORFENÓXI)-5-CLORO-2-METILFENIL]FORMAMIDINA - COMPOSTO DA FÓRMULA (I)

0,37 g (1,16 mmol) de 4-(3-t-butil-4-clorfenóxi)-5-cloro-2-metilanilina foram dissolvidos em 2,5 ml de tolueno e tratados com 0,28 g de solução de N-etil-N-metilformamidadimetilacetatl em metanol (60%). A mistura de reação foi agitada a 45 °C por doze horas antes da filtragem da mistura de reação e o solvente foi removido a vácuo para gerar 444 mg (rendimento de 87%, pureza de 89%) de produto; log P (pH 2,3) = 2,80.

PREPARAÇÃO DO MATERIAL DE PARTIDA

4-(3-T-BUTIL-4-CLOROFENÓXI)-5-CLORO-2-METILANILINA - COMPOSTO DA FÓRMULA (V)

Solução de 3,00 g (8,47 mmol) de 4-(3-t-butil-4-clorofenóxi)-5-cloro-2-metilnitrobenzeno em 40 ml de dioxano e 40 ml de ácido clorídrico foi tratada com 5,73 g (25,4 mmol) de cloreto de estanho à temperatura ambiente. A mistura de reação foi aquecida até refluxo por duas horas, resfriada à temperatura ambiente, neutralizada com $NaHCO_3$ aquoso, extraído por várias vezes com diclorometano, seca sobre Na_2SO_4, filtrada e evaporada. Rendimento: 2,34 g (pureza de 90,5%, rendimento de 77,1%); log P (pH 2,3) = 5,68.

4-(3-T-BUTIL-4-CLOROFENÓXI)-5-CLORO-2-METILNITROBENZENO - COMPOSTO DA FÓRMULA (IV)

Mistura de 3,65 g (19,8 mmol) de 3-t-butil-4-clorofenol, 3,41 g (18,0 mmol) de 4-cloro-2-fluoro-5-nitrolueno e 3,73 g (27,0 mmol) de carbonato de potássio em 20 ml de dimetil formamida foi agitada a 100 °C por seis horas, tratada com 50 nl de água a 0 °C e a mistura resultante foi agitada por quinze minutos. O precipitado foi separado, lavado com hexano e seco a vácuo para gerar 5,49 g (91,1% de pureza, 78,4% de rendimento) de produto; log P (pH 2,3) = 6,32.

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 2:

N-ETIL-N-METIL-N'-[4-(3-T-BUTIL-4-CLOROFENÓXI)-2,5-XILIL]FORMAMIDINA - COMPOSTO DA FÓRMULA (I)

15,20 g (50 mmol) de 4-(3-t-butil-4-clorofenóxi)-2,5-xilideno foram colocados em refluxo em 50 ml de trimetilformiato por quatro horas. A mistura de reação foi resfriada à temperatura ambiente e o solvente foi removido a vácuo. O resíduo foi dissolvido em 200 ml de diclorometano e tratado em seguida com 4,73 g (80 mmol) de N-etil-N-metilamina. Após agitação à temperatura ambiente por dezesseis horas, o solvente e amina não reagida foi removido a vácuo para gerar o produto bruto que foi purificado por meio de HPLC para gerar 13,00 g (rendimento de 68,5%, pureza de 98,3%) de produto; log P (pH 2,3) = 3,04.

PREPARAÇÃO DE MATERIAL DE PARTIDA

4-(3-T-BUTIL-4-CLOROFENÓXI)-2,5-XILIDINA - COMPOSTO DA FÓRMULA (V)

Solução de 40 g (119 mmol) de 4-(3-t-butil-4-clorofenóxi)-2,5-dimetilnitrobenzeno em 30 ml de n-propanol foi tratada em gotas com hidrato de hidrazina (17,3 ml, 356 mmol), adicionou-se em seguida Pd/C (5% sobre carvão, 400 mg, 0,2 mmol de Pd) e a mistura foi aquecida até refluxo por dez horas. Após resfriamento à temperatura ambiente, a mistura foi filtrada, o resíduo foi lavado com metanol e os filtrados combinados foram evaporados. O resíduo foi dissolvido em

diclorometano e a solução foi extraída por várias vezes com água para remover n-propanol remanescente. A fase orgânica foi seca sobre Na_2SO_4, filtrada e evaporada. Rendimento: 32 g (87%); log P (pH 2,3) = 4,38.

4-(3-T-BUTIL-4-CLOROFENÓXI)-2,5-DIMETILNITROBENZENO - COMPOSTO DA FÓRMULA (IV)

A solução de 27,4 g (148 mmol) de 3-tBu-4-Cl-fenol e 25 g (135 mmol) de 2,5-dimetil-4-cloro-nitrobenzeno em 250 ml de DMF, adicionou-se 24,2 g (175 mmol) de K_2CO_3 e a mistura de reação foi aquecida até refluxo por três horas. Oito gramas adicionais (58 mmol) de K_2CO_3 foram adicionados e o aquecimento prosseguiu por outras duas horas. Após resfriamento à temperatura ambiente, a mistura de reação foi despejada sobre 500 ml de água com gelo e o produto oleoso começou a cristalizar-se mediante agitação. O produto precipitado foi recolhido por meio de filtragem e mais duas bateladas foram obtidas do líquido original. Rendimento: 40 g (89%); log P (pH 2,3) = 6,32.

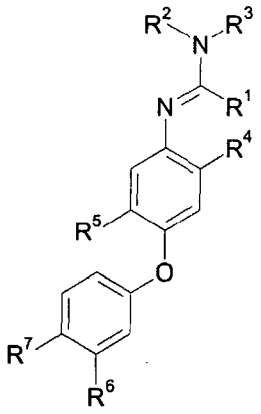


TABELA 1

Exemplo	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	$logP_a$
3	H	Me	Et	Me	Me	iPr	Cl	2,75
4	H	Me	Et	Me	Me	Me	Cl	2,31
5	H	Me	Et	Me	Me	Et	Cl	2,56
6	H	Me	Et	Me	Me	Me	F	M+1: 315
7	H	Me	cicloPr	Me	Me	tBu	Cl	2,21
8	H	Me	nPr	Me	Me	tBu	Cl	3,30

Exemplo	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	$logP_a$
9	H	Me	iPr	Me	Me	tBu	Cl	3,42
10	SH	Me	Et	Me	Me	tBu	Cl	5,12
11	H	Me	nPr	Me	Cl	Et	Cl	2,84
12	H	Me	cicloPr	Me	Cl	Et	Cl	2,89
13	H	Me	Et	Me	Cl	Et	Cl	2,78
14	H	Me	nPr	Me	Me	Et	Cl	2,76
15	H	Me	cicloPr	Me	Me	Et	Cl	2,71
16	H	Me	iPr	Me	Me	Me	Cl	2,40
17	H	Me	nPr	Me	Me	iPr	Br	2,91
18	H	Me	iPr	Me	Me	iPr	Br	3,34
19	H	Me	Et	Me	Me	iPr	Br	3,04
20	H	Me	Et	Me	Cl	iPr	Cl	2,95
21	H	Me	nPr	Me	Cl	iPr	Cl	3,03
22	H	Me	iPr	Me	Cl	iPr	Cl	3,17
23	H	Me	cicloPr	Me	Cl	iPr	Cl	2,96
24	H	Me	cicloPr	Me	Cl	tBu	Cl	3,24
25	H	Me	nPr	Me	Cl	tBu	Cl	3,27
26	H	Me	Et	Me	Cl	tBu	Cl	3,02
27	H	Me	nPr	Me	Me	iPr	Cl	3,00
28	H	Me	iPr	Me	Me	iPr	Cl	2,74
29	SH	Me	Et	Me	Me	iPr	Cl	4,81
30	H	Me	Et	Me	Cl	iPr	Br	2,84
31	H	Me	cicloPr	Me	Cl	iPr	Br	3,98
32	H	Me	iPr	Me	Me	Et	Cl	2,75
33	H	Me	nPr	Me	Cl	iPr	Br	3,21
34	H	Me	nPr	Me	Cl	iPr	Br	2,91
35	SH	Me	Et	Me	Me	tBu	Cl	5,44
36	H	$-(CH_2)_5-$		Me	Cl	tBu	Cl	3,11

Exemplo	R^1	R^2	R^3	R^4	R^5	R^6	R^7	$logP_a$
37	H	-$(CH_2)_5$-		Me	Cl	Et	Cl	2,74
38	H	Me	Et	Me	CN	iPr	Cl	2,45
39	H	Me	iPr	Cl	Me	tBu	Cl	3,01
40	H	Me	sBu	Me	Me	tBu	Cl	3,20
41	H	Me	sBu	Me	Me	iPr	Cl	2,98
42	H	Me	sBu	Me	Cl	iPr	Cl	2,90
43	H	Me	sBu	M3	Cl	tBu	Cl	3,19
44	H	Me	iPr	Me	Me	Me	F	2,29
45	H	-$(CH_2)_5$-		Me	Me	tBu	Cl	3,02
46	H	Me	Et	Me	Me	tBu-CH_2	Cl	3,11
47	H	Me	Et	Me	Me	Me_3Si-CH_2	Cl	3,01
48	H	Me	Et	Me	Me	cicloHex	Cl	3,18
49	H	Me	Et	Cl	Me	Me	Cl	2,39
50	H	Me	iPr	Cl	Me	Me	Cl	2,48
51	H	-$(CH_2)_5$-		Cl	Me	Me	Cl	2,58
52	H	-$(CH_2)_4$(CHMe)-		Cl	Me	Me	Cl	2,80
53	H	-$(CH_2)_5$-		Cl	Me	tBu	Cl	3,25
54	H	-$(CH_2)_4$(CHMe)-		Cl	Me	tBu	Cl	3,33
55	H	Me	Et	Me	Me	nBu	Cl	2,95
56	H	Me	Et	Me	Me	iBu	Cl	2,92
57	H	Me	Et	Me	Me	Me_2(MeO)C	Cl	2,26
58	H	-$(CH_2)_5$-		Cl	Me	iPr	Cl	3,00
59	H	Me	iPr	Cl	Me	iPr	Cl	2,92
60	H	Me	Et	Cl	Me	iPr	Cl	2,78
61	H	-$(CH_2)_2CF_2(CH_2)_2$-		Me	Me	tBu	Cl	3,25
62	H	-$(CH_2)_4$(CHMe)-		Cl	Me	iPr	Cl	3,07
63	H	Me	Et	Me	Br	tBu	Cl	2,67
64	H	Me	Et	Me	Me	cicloPen	Cl	3,28
65	H	-$(CH_2)_5$-		Me	Me	tBu-CH_2	Cl	3,19

EXEMPLO DE EFICÁCIA 2

TESTE PREVENTIVO *IN VIVO* SOBRE *PUCCINIA RECONDITA F. SP. TRITICI* (FERRUGEM MARROM DO TRIGO)

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

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter.

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

Para testar a atividade preventiva, plantas jovens são inoculadas com suspensão de esporos de *Puccinia recondita* em solução de ágar aquosa com resistência de 0,1%. Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são pulverizadas com a preparação de composto ativo na taxa de aplicação indicada. As plantas permanecem por 24 horas em gabinete de incubação a 20 °C e sob umidade relativa do ar de 100%. As plantas são colocadas em estufa sob temperatura de cerca de 20 °C e umidade relativa do ar de cerca de 80% para promover o desenvolvimento de pústulas de ferrugem.

O teste é avaliado dez dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada.

Neste teste, os compostos a seguir de acordo com a presente invenção exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 1000 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30; 32, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 44, 45, 46, 47, 48, 55, 56, 57.

EXEMPLO DE EFICÁCIA B

TESTE PREVENTIVO *IN VIVO* SOBRE *ERYSIPHE GRAMINI* (MÍLDEO DO PÓ SOBRE CEVADA)

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

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter.

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo ou combinação de compostos ativos é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

Para testar a atividade preventiva, plantas jovens são pulverizadas com a preparação de composto ativo ou combinação de compostos ativos à taxa de aplicação indicada.

Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são polvilhadas com esporos de *Erysiphe graminis f. sp. hordei.*

As plantas são colocadas em estufa sob temperatura de cerca de 20 °C e umidade relativa do ar de cerca de 80% para promover o desenvolvimento de pústulas de míldeo.

O teste é avaliado sete dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada.

Neste teste, os compostos a seguir de acordo com a presente invenção exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 1000 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20; 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 30, 32, 34, 36, 37, 38, 39.

EXEMPLO DE EFICÁCIA C

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *ALTERNARIA SOLANI* (MANCHA DAS FOLHAS DE TOMATE)

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

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicol éter.

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

Para testar a atividade protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação de composto ativo à taxa de aplicação indicada. Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são inoculadas com suspensão de esporos aquosa de *Alternaria solani*. As plantas permanecem por um dia em gabinete de incubação a cerca de 20 °C e umidade relativa do ar de 100%. Em seguida, as plantas são colocadas em gabinete de incubação a cerca de 20 °C e umidade relativa do ar de 96%.

O teste é avaliado por sete dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada. Neste teste, os compostos relativos à presente invenção da fórmula a seguir revelaram eficácia de 70% ou mais sob concentração de 500 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 5, 7, 8, 9, 10, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 28, 30, 32.

EXEMPLO DE EFICÁCIA D

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *PODOSPHAERA LEUCOTRICHA* (MAÇÃS)

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

Para testar a atividade protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação de composto ativo à taxa de aplicação indicada. Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são inoculadas com suspensão de esporos aquosa do agente causador do míldeo da maçã (*Podosphaera leucotricha*). As plantas são colocadas em seguida em estufa a cerca de 23 °C e umidade relativa do ar de cerca de 70%.

O teste é avaliado por dez dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada. Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 2, 3, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20; 21, 22, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 34, 37, 45, 57.

EXEMPLO DE EFICÁCIA E

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *SPHAEROTHECA FULIGINEA* (PEPINOS)

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

Para testar a atividade protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação de composto ativo à taxa de aplicação indicada. Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são inoculadas com suspensão de esporos aquosa de *Sphaerotheca fuliginea*. As plantas são colocadas em seguida em estufa a cerca de 23 °C e umidade relativa do ar de cerca de 70%.

O teste é avaliado sete dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada.

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 17, 18, 19, 20; 21, 22, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 34, 37, 39, 40, 41, 44, 45.

EXEMPLO DE EFICÁCIA F

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *UROMYCES APPENDICULATUS* (FEIJÃO)

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

Para testar a atividade protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação de composto ativo à taxa de aplicação indicada. Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são inoculadas com suspensão de esporos aquosa do agente causador de ferrugem do feijão (*Uromyces appendiculatus*) e permanecem em seguida por um dia em gabinete de incubação a cerca de 20 °C e umidade relativa do ar de 100%.

As plantas são colocadas em seguida em estufa a cerca de 21 °C e umidade relativa do ar de cerca de 90%.

O teste é avaliado dez dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada.

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 2, 3, 7, 16, 20, 26, 28, 44, 57.

EXEMPLO DE EFICÁCIA G

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *AEDES AEGYPTI* (AEDSAE U)

Solvente: 1% N-metilpirrolidona (NMP)

1% diacetona álcool

Tintura: sulfoflavin brilhante para água para manchar

Para produzir preparação apropriada do composto ativo, o composto ativo é misturado com a quantidade indicada de solvente e o concentrado é diluído com água para manchar até a concentração desejada.

Larvas de *Aedes aegypti* são colocadas com pipeta com preparação de ingrediente ativo com a concentração desejada.

Após o período de tempo especificado, é determinada a mortalidade em percentual. Cem por cento indica que todas as larvas foram mortas e 0% indica que nenhuma das larvas foi morta.

Neste teste, o composto a seguir do exemplo de preparação exibe boa atividade: 3.

EXEMPLO DE EFICÁCIA H

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *HELIOTHIS VIRESCENS* (HELIVI U)

Solvente: 78 partes em peso de acetona

1,5 partes em peso de dimetilformamida

Agente umectante: 0,5 partes em peso de alquilarilpoliglicol éter

Para produzir preparação apropriada do composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com a quantidade indicada de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água que contém emulsificante até a concentração desejada.

Seções de folhas de soja (*Glycine max*) são pulverizadas com preparação do ingrediente ativo com a concentração desejada. Uma vez secas, as seções de folhas são infestadas com ovos de lagarta do algodão (*Heliotis virescens*).

Após o período de tempo especificado, é determinada a mortalidade em percentual. Cem por cento indica que todos os ovos foram mortos e 0% indica que nenhum dos ovos foi morto.

Neste teste, por exemplo, o composto a seguir dos exemplos de preparação exibiu boa atividade: 18.

EXEMPLO DE EFICÁCIA I

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *AEDES AEGYPTI* (AEDSAE MO)

Solvente: 1000 partes em peso de sulfóxido de dimetila

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma parte em peso de composto ativo é misturada com a quantidade indicada de solvente e o concentrado é diluído com água até a concentração desejada.

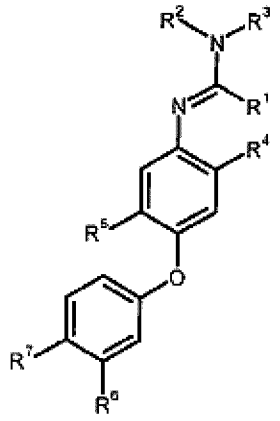
Dez a vinte larvas de mosquitos (*Aedes aegypti*) são adicionadas à cavidade e incubadas.

Após o período de tempo especificado, é determinada a mortalidade em percentual. Cem por cento indica que todas as larvas foram mortas; 0% indica que nenhuma das larvas foi morta.

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir dos exemplos de preparação exibiram boa atividade: 18.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (I):



(I)

em que:

- R^1 representa H, alquila C_1-C_{12} ou SH;
- R^2 representa metila ou etila;
- R^3 representa alquila C_2-C_{12}, cicloalquila C_3-C_6, alquenila C_2-C_{12}; ou
- R^2 e R^3 podem juntos formar heterociclo de 5 a 7 membros;
- R^4 representa metila, Cl;
- R^5 representa metila, CN, Cl, Br;
- R^6 representa t-butila, i-butila, n-butila, etila, metila, isoproprila, t-Bu-CH_2, Me_3Si-CH_2, ciclohexila, ciclopentila, $Me_2(MeO)C$; e
- R^7 representa Cl, F, Br;

bem como seus sais, N-óxidos, complexos metálicos, complexos metalóidicos e isômeros opticamente ativos ou geométricos.

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que:

- R^1 representa metila ou etila; ou
- R^3 representa etila, n-propila, i-propila, propenila, alila ou

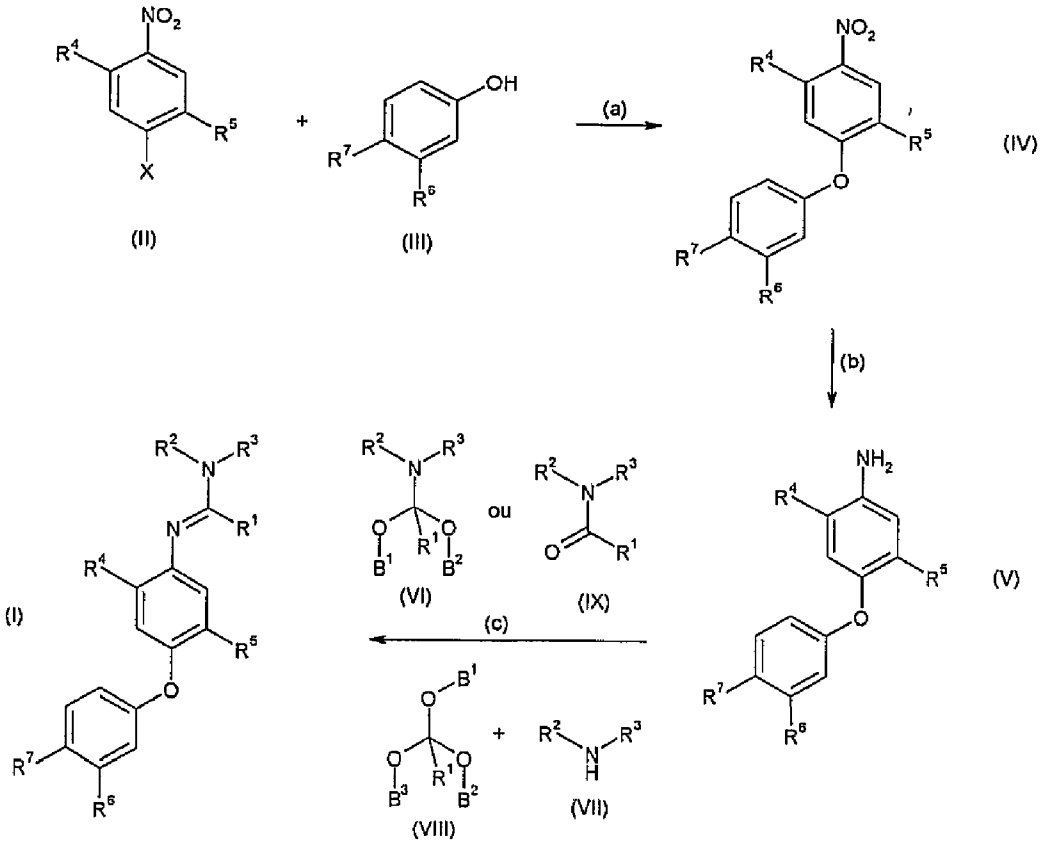
ciclopropila; ou

- R^2 e R^3 podem juntos formar pipiridinila ou pirrolidinila; ou
- R^4 representa metila; ou
- R^5 representa metila.

3. COMPOSTO, de acordo com uma das reivindicações 1 a 2, caracterizado pelo fato de que R^2 e R^3 juntos formam pirrolidinila bis-alquilada.

4. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que R^2 e R^3 formam juntos bis-metil-pirrolidinila.

5. PROCESSO DE PREPARAÇÃO DE COMPOSTO, de fórmula (I), conforme definido em uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que compreende pelo menos uma das etapas a seguir:



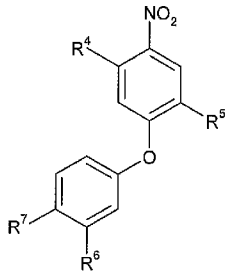
em que:

- R^1 a R^7 são conforme definidos em uma das reivindicações 1 a 4;

- B^1 e B^2 na fórmula (VI) representam alquila ou, juntos, cicloalquila;

- B^1, B^2 e B^3 na fórmula (VIII) representam alquila.

6. COMPOSTO DERIVADO DE NITROFENILÉTER, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (IV):



(IV)

em que:

- R^4 representa alquila C_1-C_{12}, átomo de halogênio, halogênio-alquila C_1-C_{12}, O-alquila C_1-C_{12} ou ciano;

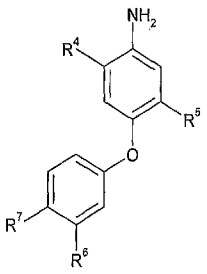
- R^5 representa H, alquila C_1-C_{12}, átomo de halogênio, halogênio-alquila C_1-C_{12}, O-alquila C_1-C_{12} ou ciano;

- R^6 representa alquila C_1-C_6 linear ou ramificada que pode ser não substituída ou substituída por substituinte selecionado a partir da lista que consiste de alcóxi, haloalcóxi, alquiltio e dialquilamino;

- R^7 representa halogênio ou ciano;

bem como seus sais, N-óxidos, complexos metálicos, complexos metalóidicos e isômeros opticamente ativos ou geométricos.

7. COMPOSTO DERIVADO DE AMINOFENILÉTER, caracterizado pelo fato de ser de fórmula (V):



(V)

em que:

- R^4 representa alquila C_1-C_{12}, átomo de halogênio, halogênio-alquila C_1-C_{12}, O-alquila C_1-C_{12} ou ciano;
- R^5 representa H, alquila C_1-C_{12}, átomo de halogênio, halogênio-alquila C_1-C_{12}, O-alquila C_1-C_{12} ou ciano;
- R^6 representa alquila C_1-C_6 linear ou ramificada que pode ser não substituída ou substituída por substituinte selecionado a partir da lista que consiste de alcóxi, haloalcóxi, alquiltio e dialquilamino;
- R^7 representa halogênio ou ciano;

bem como seus sais, N-óxidos, complexos metálicos, complexos metalóidicos e isômeros opticamente ativos ou geométricos.

8. MÉTODO DE CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE SAFRAS, caracterizado pelo fato de que uma quantidade agronomicamente eficaz e substancialmente não fitotóxica de composto conforme definido em uma das reivindicações 1 a 4 é aplicada ao solo onde as plantas crescem ou são capazes de crescer, às folhas ou ao fruto das plantas ou às sementes das plantas.

9. MÉTODO DE CONTROLE DE INSETOS DANINHOS, caracterizado pelo fato de que o composto da fórmula (I) conforme definido em uma das reivindicações 1 a 4 é aplicado à semente, à planta ou ao fruto da planta ou ao solo onde a planta está crescendo ou onde se deseja que ela cresça.

RESUMO

"COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, PROCESSO DE PREPARAÇÃO DE COMPOSTO, COMPOSTO DERIVADO DE NITROFENILÉTER, COMPOSTO DERIVADO DE AMINOFENILÉTER, MÉTODO DE CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE SAFRAS E MÉTODO DE CONTROLE DE INSETOS DANINHOS"

A presente invenção refere-se a derivados de fenil-amidina 4-fenilóxi-substituídos 2,5-di-substituídos da fórmula (I), em que os substituintes são conforme definidos no relatório descritivo, seu processo de preparação, seu uso como agentes ativos fungicidas ou inseticidas, particularmente na forma de composições fungicidas ou inseticidas, e métodos de controle de fungos fitopatogênicos ou insetos daninhos, notadamente de plantas, utilizando estes compostos ou composições.