



INPI
INSTITUTO
NACIONAL
DA PROPRIEDADE
INDUSTRIAL
Assinado
Digitalmente

REPÚBLICA FEDERATIVA DO BRASIL
MINISTÉRIO DA ECONOMIA
INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL

CARTA PATENTE Nº PI 0808730-0

O INSTITUTO NACIONAL DA PROPRIEDADE INDUSTRIAL concede a presente PATENTE DE INVENÇÃO, que outorga ao seu titular a propriedade da invenção caracterizada neste título, em todo o território nacional, garantindo os direitos dela decorrentes, previstos na legislação em vigor.

(21) Número do Depósito: PI 0808730-0

(22) Data do Depósito: 08/03/2008

(43) Data da Publicação do Pedido: 18/09/2008

(51) Classificação Internacional: A01N 37/52; C07C 205/38; C07C 217/90; C07C 257/12.

(30) Prioridade Unionista: EP 07005002.6 de 12/03/2007.

(54) Título: FLUORALQUILFENILAMIDINAS, SEUS USOS E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, COMPOSIÇÃO E PROCESSO PARA COMBATER MICROORGANISMOS INDESEJADOS, SEMENTE RESISTENTE A MICROORGANISMOS INDESEJADOS, E PROCESSO PARA SUA PROTEÇÃO

(73) Titular: BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH. Endereço: ALFRED-NOBEL-STR. 10, 40789 MONHEIM, ALEMANHA(DE)

(72) Inventor: KLAUS KUNZ; JÖRG NICO GREUL; ULRICH HEINEMANN; DARREN JAMES MANSFIELD; AMOS MATTES; OSWALD ORT; THOMAS SEITZ; AHMED WAHED MORADI; ULRIKE WACHENDORFF-NEUMANN; PETER DAHMEN; ARND VOERSTE.

Prazo de Validade: 10 (dez) anos contados a partir de 05/02/2019, observadas as condições legais

Expedida em: 05/02/2019

Assinado digitalmente por:

Liane Elizabeth Caldeira Lage

Diretora de Patentes, Programas de Computador e Topografias de Circuitos Integrados

**Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "FLUORAL-
QUILFENILAMIDINAS, SEUS USOS E SEU PROCESSO DE PREPA-
RAÇÃO, COMPOSIÇÃO E PROCESSO PARA COMBATER MICRO-
ORGANISMOS INDESEJADOS, SEMENTE RESISTENTE A MICRO-
ORGANISMOS INDESEJADOS, E PROCESSO PARA SUA PROTE-
ÇÃO".**

[001] A presente invenção se refere a fluoralquilfenilamidinas da fórmula geral (I), um processo para a sua preparação, o uso das amidinas de acordo com a invenção, para combater micro-organismos indesejados, bem como uma composição para esse fim, compreendendo as fenoxiamidinas de acordo com a invenção. Além disso, a invenção se refere a um processo para combater micro-organismos indesejados através da aplicação dos compostos de acordo com a invenção, sobre os micro-organismos e/ou em seu habitat.

[002] A WO-A-00/046.184 publica o uso de amidinas, especialmente de N-etil-N-metil-N'-[4-(3-tercbutililfenóxi)-2,5-dimetilfenil]formamidina, como fungicidas.

[003] A WO-A-03/093.224 publica o uso de derivados de arilamidina como fungicidas.

[004] A WO-A-03/024.219 publica composições fungicidas compreendendo pelo menos um derivado de N²-fenilamidina em combinação com uma outra substância ativa conhecida selecionada.

[005] A WO-A-04/037239 publica medicamentos antifungicidas à base de derivados de N²-fenilamidina.

[006] A WO-A-05/089.547 publica misturas fungicidas, compreendendo pelo menos um derivado de arilamidina em combinação com uma outra substância ativa fungicida conhecida.

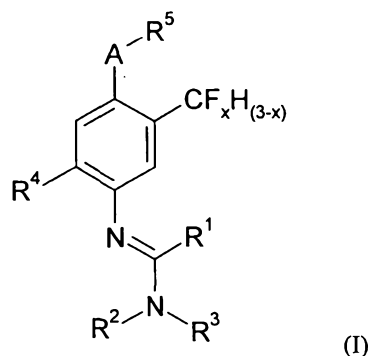
[007] A WO-A-05/120.234 publica misturas fungicidas, compreendendo pelo menos um derivado de fenilamidina e um outro fungicida

conhecido selecionado.

[008] A eficácia das amidinas descritas no estado da técnica é boa, contudo, em alguns casos deixa a desejar.

[009] Por conseguinte, o objetivo da presente invenção baseia-se em pôr amidinas à disposição com uma eficácia fungicida aperfeiçoada.

[0010] O objetivo foi surpreendentemente resolvido por



[0011] fluoralquilfenilamidinas da fórmula (I)

[0012] na qual

[0013] x é um número inteiro, selecionado de 1, 2 e 3;

[0014] A é selecionado de O, NH, CH₂, CHR⁸ e de uma ligação simples;

[0015] R¹ é selecionado de hidrogênio; grupos C₁₋₁₂-alquila, C₂₋₁₂-alquenila, C₂₋₁₂-alquinila lineares ou ramificados, grupos C₃₋₈-alquila, C₄₋₈-alquenila, C₄₋₈-alquinila cíclicos, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados de -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN e -CONR'₂, em que R' pode ser hidrogênio ou um grupo C₁₋₁₂-alquila; -SH; -SR'', em que R'' pode ser um grupo C₁₋₁₂-alquila linear ou ramificado, que pode ser substituído com um ou mais grupos, que são selecionados de -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN e -CONR'₂, em que R' tem os significados acima;

[0016] R^2 é selecionado de grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila lineares ou ramificados, grupos C_{3-8} -alquila, C_{4-8} -alquenila, C_{4-8} -alquinila cíclicos ou grupos C_{5-18} -arila, C_{7-19} -aralquila ou C_{7-19} -alcarila, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados, de $-R'$, $-X$, $-OR'$, $-SR'$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-CN$ e $-CONR'_2$, em que R' tem os significados acima;

[0017] R^3 é selecionado de $-CN$, $-SH$, $-SR''$, $-OR''$, $-(C=O)-R''$, grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila lineares ou ramificados, grupos C_{3-8} -alquila, C_{4-8} -alquenila, C_{4-8} -alquinila cíclicos, grupos C_{5-18} -arila, C_{7-19} -aralquila ou C_{7-19} -alcarila, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados, de $-R'$, $-X$, $-OR'$, $-SR'$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-CN$ e $-CONR'_2$, em que R' e R'' têm os significados acima;

[0018] ou na qual

[0019] R^2 e R^3 ,

[0020] R^2 e R^1 ou

[0021] R^1 e R^3 juntos com os átomos, aos quais estão ligados ou com outros átomos, selecionados de N, O, P e S, podem formar um anel com quatro a sete membros, que pode ser novamente substituído com um ou mais grupos $X-$, $R'-$, $OR'-$, $SR'-$, $-NR'_2$, $-SiR'_3$, $-COOR'$, $-CN$ e $-CONR'_2$, em que R' tem os significados acima;

[0022] R^4 é selecionado de grupos que consistem em $-X$, $-CN$, $-SH$, $-SR''$, $-OR''$, $-(C=O)-R''$, grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila lineares ou ramificados, grupos C_{3-8} -alquila, C_{4-8} -alquenila, C_{4-8} -

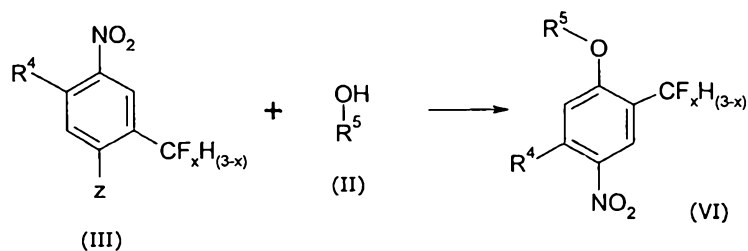
alquinila cíclicos, grupos C₅₋₁₈-arila, C₇₋₁₉-aralquila ou C₇₋₁₉-alcarila, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados, de -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN e -CONR'₂, em que R' e R'' têm os significados acima;

[0023] R⁵ é selecionado de grupos C₅₋₁₈-arila, C₇₋₁₉-aralquila ou C₇₋₁₉-alcarila, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados, de -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN e -CONR'₂, em que R' tem os significados acima;

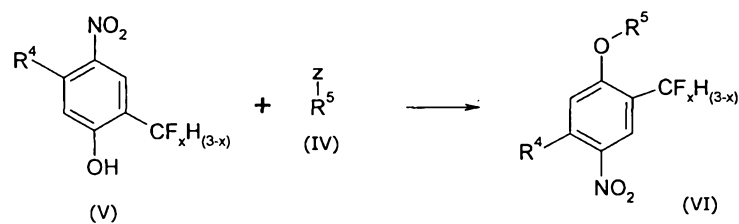
[0024] e seus sais.

[0025] Um outro objeto da presente invenção refere-se a um processo para preparar as fluoralquilfenilamidinas de acordo com a invenção, compreendendo pelo menos um dos seguintes estágios (a) até (n):

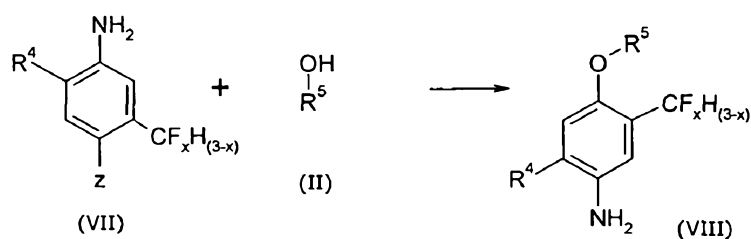
(a) reação de derivados de nitrobenzeno da fórmula (III) com álcoois ou fenóis da fórmula (II) de acordo com o seguinte esquema de reação:



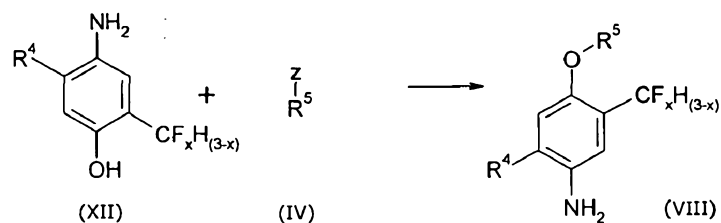
(b) reação de derivados de nitrofenol da fórmula (V) com derivados de fenila da fórmula (IV) de acordo com o seguinte esquema de reação:



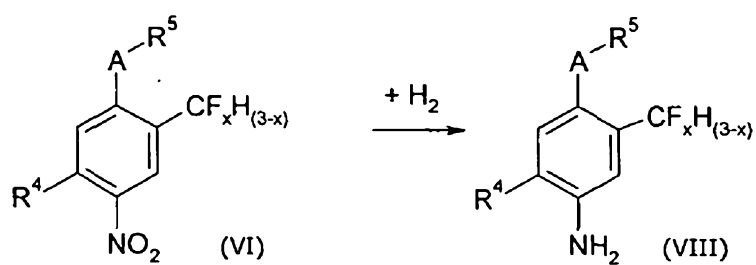
(c) reação de anilinas da fórmula (VII) com álcoois ou fenóis da fórmula (II) de acordo com o seguinte esquema de reação:



(d) reação de aminofenóis da fórmula (XII) com derivados de fenila da fórmula (IV) de acordo com o seguinte esquema de reação:

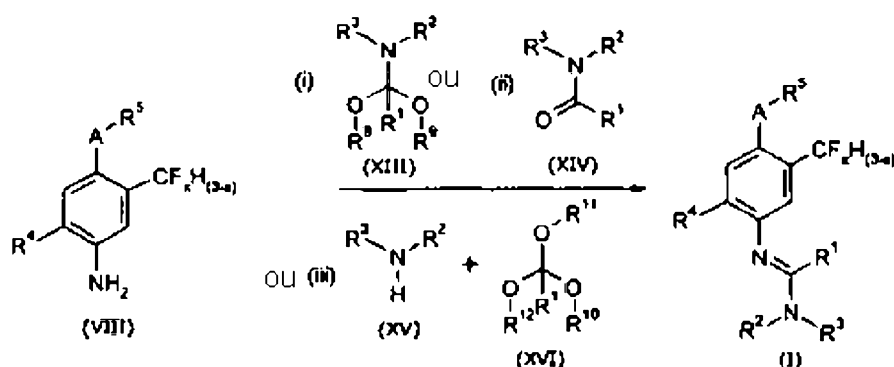


(e) redução dos fluoralquilnitrofenóis da fórmula (VI) para fluoralquilanilinas da fórmula (VIII) de acordo com o seguinte esquema de reação:

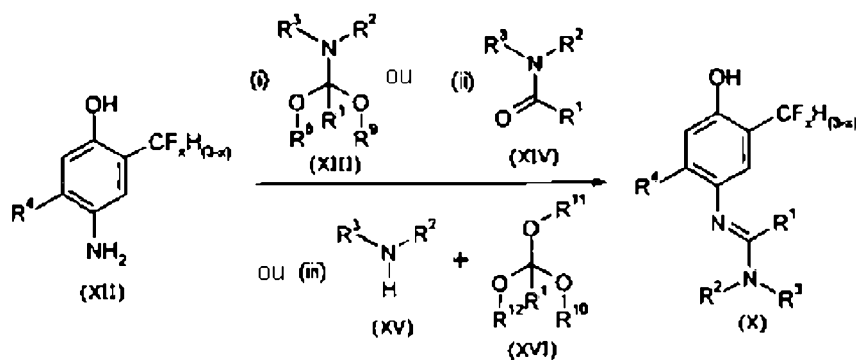


(f) reação dos éteres anilínicos da fórmula (VIII) com
(i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou

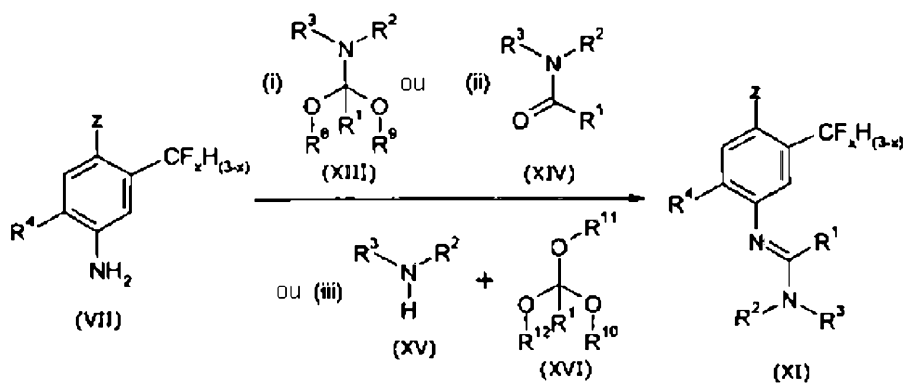
- (ii) com amidas da fórmula (XIV) ou
 (iii) com aminas da fórmula (XV) na presença de ortoésteres da fórmula (XVI) de acordo com o seguinte esquema de reação:



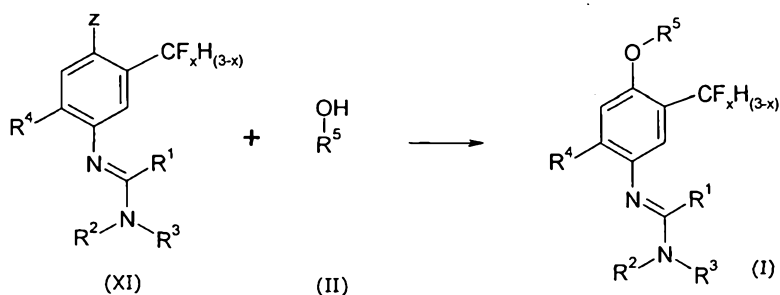
- (g) reação dos aminofenóis da fórmula (XII) com
 (i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou
 (ii) com amidas da fórmula (XIV) ou
 (iii) com aminas da fórmula (XV) na presença de ortoésteres da fórmula (XVI) de acordo com o seguinte esquema de reação:



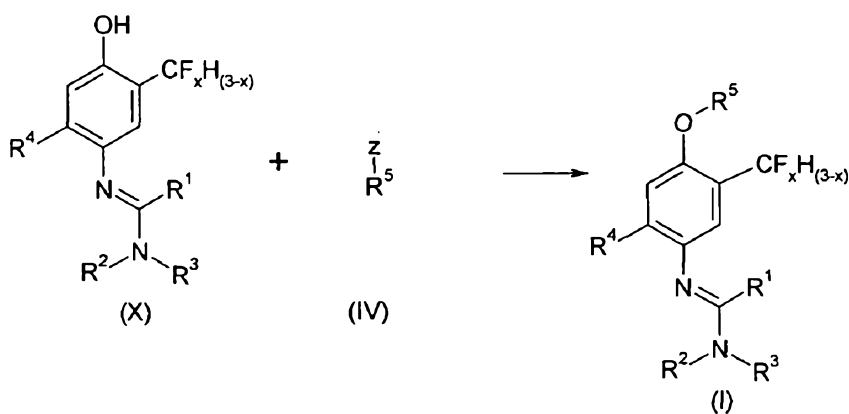
- (h) reação dos aminofenóis da fórmula (VII) com
 (i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou
 (ii) com amidas da fórmula (XIV) ou
 (iii) com aminas da fórmula (XV) na presença de ortoésteres da fórmula (XVI) de acordo com o seguinte esquema de reação:



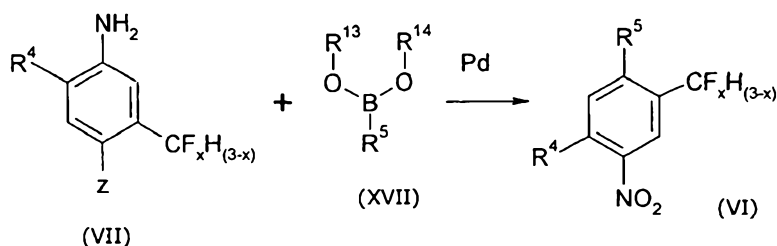
(i) reação de amidinas da fórmula (XI) com álcoois ou fenóis da fórmula (II) de acordo com o seguinte esquema de reação:



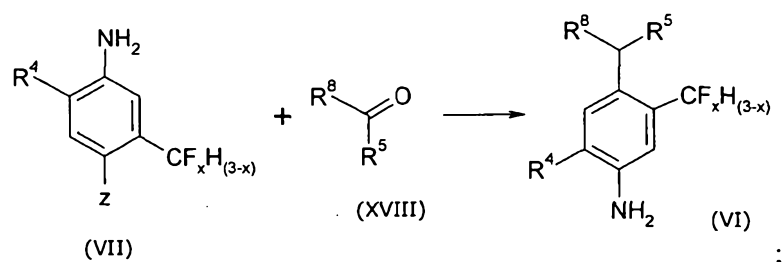
(j) reação de amidinas da fórmula (XI) com derivados de fenila da fórmula (IV) de acordo com o seguinte esquema de reação:



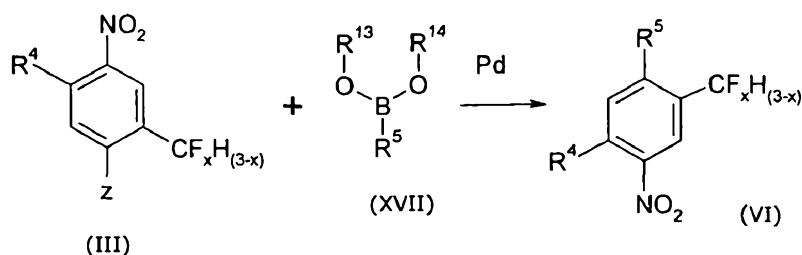
(k) reação de fluoralquilanilinas da fórmula (VII) com derivados de ácido borônico da fórmula (XVII) de acordo com o seguinte esquema de reação:



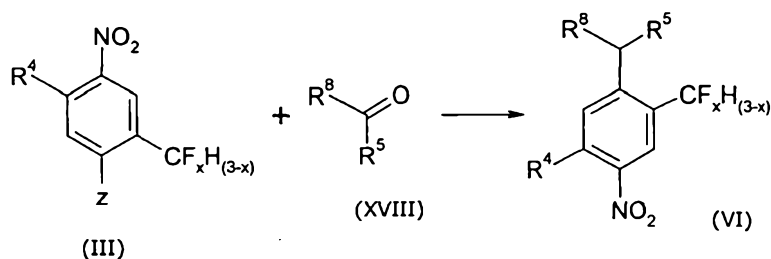
(l) reação de fluoralquilanilinas da fórmula (VII) com aldeídos ou cetonas da fórmula (XVIII) de acordo com o seguinte esquema de reação:



(m) reação de fluoralquinitrobenzenos da fórmula (III) com derivados de ácido borônico da fórmula (XVII) de acordo com o seguinte esquema de reação:



(n) reação de fluoralquinitrobenzenos da fórmula (III) com aldeídos ou cetonas da fórmula (XVIII) de acordo com o seguinte esquema de reação:

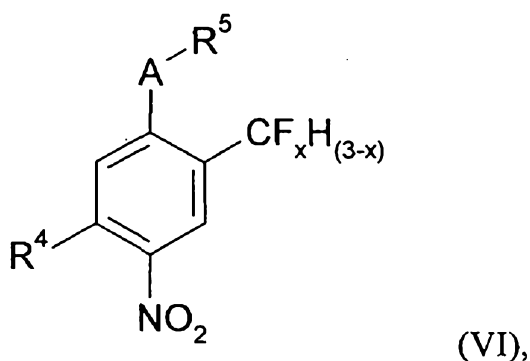


[0026] em que nas fórmulas descritas acima,

[0027] x , Z , R^1 a R^8 têm os significados acima;

[0028] R^{13} e R^{14} , independentes uns dos outros, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila ou grupos C_{5-18} -arila ou C_{7-19} -arilalquila e que, juntos com os átomos de oxigênio, aos quais estão ligados, podem formar um anel com cinco, seis ou sete membros.

[0029] Um terceiro objeto da invenção refere-se a fluoralquilnitro-benzenos da fórmula (VI)

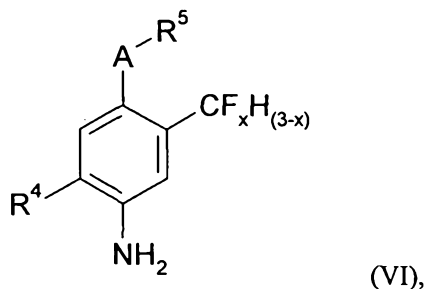


[0030] na qual

[0031] A , x e

[0032] R^4 a R^7 têm os significados acima.

[0033] Um quarto objeto da invenção refere-se a fluoralquilanilinas da fórmula (VIII)



[0034] na qual

[0035] A , x e

[0036] R^4 a R^7 têm os significados acima.

[0037] Um quinto objeto da invenção é o uso das fluoralquilfenila-

midinas de acordo com a invenção ou misturas dessas para combater micro-organismos indesejados. Um sexto objeto da presente invenção é uma composição para combater micro-organismos indesejados, compreendendo pelo menos uma fluoralquilfenilamidina de acordo com a presente invenção.

[0038] Um outro objeto da invenção refere-se a um processo para combater micro-organismos indesejados, caracterizado pelo fato de que as fenoxiamidinas de acordo com a invenção, são aplicadas sobre os micro-organismos e/ou em seu habitat.

[0039] Além disso, a invenção refere-se a uma semente, a qual foi tratada com pelo menos uma das fluoralquilfenilamidinas de acordo com a invenção.

[0040] Um último objeto da invenção refere-se a um processo para a proteção da semente contra micro-organismos indesejados através do uso de uma semente tratada com pelo menos uma fluoralquilfenilamidina da presente invenção.

Definições gerais

[0041] No contexto com a presente invenção, o termo halogênios (X), desde que não seja definido de outro modo, compreende aqueles elementos, que são selecionados do grupo que consiste em flúor, cloro, bromo e iodo, em que flúor, cloro e bromo são preferivelmente usados e flúor e cloro são usados de modo particularmente preferido.

[0042] Grupos eventualmente substituídos podem ser substituídos uma ou mais vezes, sendo que, no caso das substituições múltiplas, os substituintes podem ser iguais ou diferentes.

[0043] No contexto com a presente invenção, o grupo –X designa um átomo de halogênio, que é selecionado de flúor, cloro, bromo e iodo, preferivelmente flúor, cloro e bromo, de modo particularmente preferido, de flúor e cloro.

[0044] Grupos alquila substituídos com um ou mais átomos de ha-

logênio (-X) são selecionados, por exemplo, de trifluormetila (CF_3), difluormetila (CHF_2), CF_3CH_2 , ClCH_2 , CF_3CCl_2 .

[0045] No contexto com a presente invenção, grupos alquila, desde que não sejam definidos de forma divergente, são grupos de hidrocarbonetos lineares, ramificados ou anelares, que podem apresentar opcionalmente uma, duas ou mais insaturações simples ou duplas ou um, dois ou mais heteroátomos, que são selecionados de O, N, P e S. Além disso, os grupos alquila de acordo com a invenção, podem ser opcionalmente substituídos por outros grupos, que são selecionados de grupos $-\text{R}'$, halogênio (-X), alcóxi ($-\text{OR}'$), tioéter ou mercapto ($-\text{SR}'$), amino ($-\text{NR}'_2$), silila ($-\text{SiR}'_3$), carboxila ($-\text{COOR}'$), ciano ($-\text{CN}$), acila ($-(\text{C}=\text{O})\text{R}'$) e amida ($-\text{CONR}'_2$), em que R' é hidrogênio ou um grupo C_{1-12} -alquila, preferivelmente um grupo C_{2-10} -alquila, de modo particularmente preferido, um grupo C_{3-8} -alquila, que pode apresentar um ou mais heteroátomos, selecionados de N, O, P e S.

[0046] A definição $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -alquila compreende o maior âmbito aqui definido para um grupo alquila. Individualmente, essa definição compreende, por exemplo, os significados metila, etila, n-, iso-propila, n-, iso-, sec- e t-butila, n-pentila, n-hexila, 1,3-dimetilbutila, 3,3-dimetilbutila, n-heptila, n-nonila, n-decila, n-undecila, n-dodecila.

[0047] No contexto com a presente invenção, grupos alquenila, desde que não sejam definidos de forma divergente, são grupos de hidrocarbonetos lineares, ramificados ou anelares, que contêm pelo menos uma insaturação simples (ligação dupla) e opcionalmente podem apresentar uma, duas ou mais insaturações simples ou duplas ou um, dois ou mais heteroátomos, que são selecionados de O, N, P e S. Além disso, os grupos alquenila de acordo com a invenção, podem ser opcionalmente substituídos por outros grupos, que são selecionados de grupos $-\text{R}'$, halogênio (-X), alcóxi ($-\text{OR}'$), tioéter ou mercapto ($-\text{SR}'$), amino ($-\text{NR}'_2$), silila ($-\text{SiR}'_3$), carboxila ($-\text{COOR}'$), ciano ($-\text{CN}$), acila (-

(C=O)R') e amida (-CONR₂'), em que R' é hidrogênio ou um grupo C₁₋₁₂-alquila, preferivelmente um grupo C₂₋₁₀-alquila, de modo particularmente preferido, um grupo C₃₋₈-alquila, que pode apresentar um ou mais heteroátomos, selecionados de N, O, P e S.

[0048] A definição C₂-C₁₂-alquenila compreende o maior âmbito aqui definido para um grupo alquenila. Individualmente, essa definição compreende, por exemplo, os significados vinila; alila (2-propenila), isopropenila (1-metiletenila); but-1-enila (crotila), but-2-enila, but-3-enila; hex-1-enila, hex-2-enila, hex-3-enila, hex-4-enila, hex-5-enila; hept-1-enila, hept-2-enila, hept-3-enila, hept-4-enila, hept-5-enila, hept-6-enila; oct-1-enila, oct-2-enila, oct-3-enila, oct-4-enila, oct-5-enila, oct-6-enila, oct-7-enila; non-1-enila, non-2-enila, non-3-enila, non-4-enila, non-5-enila, non-6-enila, non-7-enila, non-8-enila; dec-1-enila, dec-2-enila, dec-3-enila, dec-4-enila, dec-5-enila, dec-6-enila, dec-7-enila, dec-8-enila, dec-9-enila; undec-1-enila, undec-2-enila, undec-3-enila, undec-4-enila, undec-5-enila, undec-6-enila, undec-7-enila, undec-8-enila, undec-9-enila, undec-10-enila; dodec-1-enila, dodec-2-enila, dodec-3-enila, dodec-4-enila, dodec-5-enila, dodec-6-enila, dodec-7-enila, dodec-8-enila, dodec-9-enila, dodec-10-enila, dodec-11-enila; buta-1,3-dienila, penta-1,3-dienila.

[0049] No contexto com a presente invenção, grupos alquinila, desde que não sejam definidos de forma divergente, são grupos de hidrocarbonetos lineares, ramificados ou anelares, que contêm pelo menos uma insaturação dupla (ligação tripla) e opcionalmente podem apresentar uma, duas ou mais insaturações simples ou duplas ou um, dois ou mais heteroátomos, que são selecionados de O, N, P e S. Além disso, os grupos alquinila de acordo com a invenção, podem ser opcionalmente substituídos por outros grupos, que são selecionados de grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN), acila (-

(C=O)R') e amida (-CONR₂'), em que R' é hidrogênio ou um grupo C₁₋₁₂-alquila linear, ramificado ou cíclico, que pode apresentar um ou mais heteroátomos, selecionados de N, O, P e S.

[0050] A definição C₂-C₁₂-alquinila compreende o maior âmbito aqui definido para um grupo alquinila. Individualmente, essa definição compreende, por exemplo, os significados etinila (acetilenila); prop-1-inila e prop-2-inila.

[0051] No contexto com a presente invenção, grupos arila, desde que não sejam definidos de forma divergente, são grupos de hidrocarbonetos aromáticos, que podem apresentar um, dois ou mais heteroátomos, que são selecionados de O, N, P e S e opcionalmente podem ser substituídos por outros grupos, que são selecionados de grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN), acila (-(C=O)R') e amida (-CONR₂'), em que R' é hidrogênio ou um grupo C₁₋₁₂-alquila, preferivelmente um grupo C₂-C₁₀-alquila, de modo particularmente preferido, grupo C₃-C₈-alquila, que pode apresentar um ou mais heteroátomos, selecionados de N, O, P e S.

[0052] A definição C₅₋₁₈-arila compreende o maior âmbito aqui definido para um grupo arila com 5 a 18 átomos de carbono. Individualmente, essa definição compreende, por exemplo, os significados ciclo-pentadienila, fenila, ciclo-heptatrienila, ciclo-octatetraenila, naftila e antracenila.

[0053] No contexto com a presente invenção, grupos arilalquila (grupos aralquila), desde que não sejam definidos de forma divergente, são grupos alquila substituídos por grupos arila, que podem apresentar uma cadeia C₁₋₈-alquileno e que na estrutura arila ou na cadeia alquileno podem ser substituídos por um ou mais heteroátomos, que são selecionados de O, N, P e S e opcionalmente por outros grupos, que são selecionados de grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou

mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN), acila (-(C=O)R') e amida (-CONR'₂), em que R' é hidrogênio ou um grupo C₁₋₁₂-alquila, preferivelmente um grupo C₂-C₁₀-alquila, de modo particularmente preferido, grupo C₃-C₈-alquila, que pode apresentar um ou mais heteroátomos, selecionados de N, O, P e S.

[0054] A definição grupo C₇₋₁₉-aralquila compreende o maior âmbito aqui definido para um grupo arilalquila com um total de 7 a 19 átomos na estrutura e cadeia alquilenos. Individualmente, essa definição compreende, por exemplo, os significados benzila e feniletila.

[0055] No contexto com a presente invenção, grupos alquilarila (grupos alcarila), desde que não sejam definidos de forma divergente, são grupos arila substituídos por grupos alquila, que podem apresentar uma cadeia C₁₋₈-alquilenos e na estrutura arila ou na cadeia alquilenos podem ser substituídos por um ou mais heteroátomos, que são selecionados de O, N, P e S e opcionalmente por outros grupos, que são selecionados de grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN), acila (-(C=O)R') e amida (-CONR'₂), em que R' é hidrogênio ou um grupo C₁₋₁₂-alquila, preferivelmente um grupo C₂-C₁₀-alquila, de modo particularmente preferido, grupo C₃-C₈-alquila, que pode apresentar um ou mais heteroátomos, selecionados de N, O, P e S.

[0056] A definição grupo C₇₋₁₉-alquilarila compreende o maior âmbito aqui definido para um grupo alquilarila com um total de 7 a 19 átomos na estrutura e cadeia alquilenos. Individualmente, essa definição compreende, por exemplo, os significados tolila, 2,3-, 2,4-, 2,5-, 2,6-, 3,4- ou 3,5-dimetilfenila.

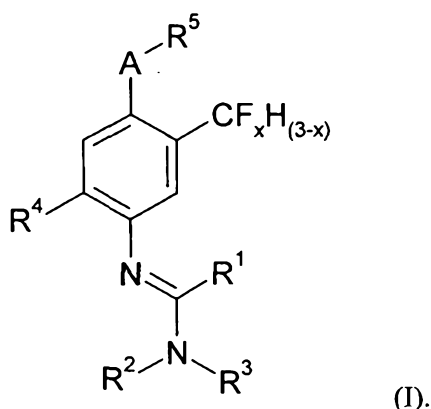
[0057] Os grupos alquila, alquenila, alquinila, arila, alcarila e aralquila podem apresentar, além disso, um ou mais heteroátomos, que – desde que não sejam definidos de modo divergente – são selecionados de N, O, P e S. Nesse caso, os heteroátomos substituem os áto-

mos de carbono numerados.

[0058] Não compreendidas são combinações, que contradizem as leis naturais e que, por isso, o técnico teria excluído com base em seu conhecimento. Por exemplo, estruturas anelares com três ou mais átomos de oxigênio adjacentes, são excluídas.

[0059] Os compostos de acordo com a invenção, podem estar eventualmente presentes como misturas de diferentes formas isoméricas possíveis, especialmente de estereoisômeros, tais como, por exemplo, isômeros E e Z, treo e eritro, bem como de isômeros ópticos, mas eventualmente também de tautômeros. São publicados e reivindicados tanto os isômeros E, como também os Z, como também os isômeros treo e eritro, bem como os isômeros ópticos, misturas desejadas desses isômeros, bem como as possíveis formas tautoméricas.

[0060] As fluoralquilfenilamidinas de acordo com a invenção, são compostos da fórmula (I)



[0061] ou seus sais, N-óxidos, complexos metálicos e seus estereoisômeros.

[0062] Na fórmula (I), os grupos têm os significados definidos a seguir. As respectivas definições valem do mesmo modo para todos os produtos intermediários:

[0063] x é um número inteiro, selecionado de 1, 2 e 3;

[0064] A é selecionado de O, NH, CH₂, CHR⁸ e uma ligação simples;

[0065] R^1 é selecionado de:

- hidrogênio;
- grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila lineares ou ramificados ou grupos C_{3-8} -alquila, C_{4-8} -alquenila, C_{4-8} -alquinila cíclicos, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados de grupos $-R'$, halogênio ($-X$), alcóxi ($-OR'$), tioéter ou mercapto ($-SR'$), amino ($-NR'_2$), silila ($-SiR'_3$), carboxila ($-COOR'$), ciano ($-CN$) e grupos amida ($-CONR'_2$), em que R' pode ser hidrogênio ou um grupo C_{1-12} -alquila, preferivelmente um grupo C_{2-10} -alquila, de modo particularmente preferido, grupo C_{3-8} -alquila;

- grupos mercapto ($-SH$) e tioéter ($-SR''$), em que R'' é um grupo C_{1-12} -alquila linear ou ramificado, preferivelmente um grupo C_{2-10} -alquila, de modo particularmente preferido, um grupo C_{3-8} -alquila, que pode ser substituído com grupos, que são selecionados de grupos $-R'$, halogênio ($-X$), alcóxi ($-OR'$), tioéter ou mercapto ($-SR'$), amino ($-NR'_2$), silila ($-SiR'_3$), carboxila ($-COOR'$), ciano ($-CN$) e grupos amida ($-CONR'_2$), em que R' tem os significados acima.

[0066] R^2 é selecionado de:

- grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila lineares ou ramificados;
- grupos C_{3-8} -alquila, C_{4-8} -alquenila, C_{4-8} -alquinila cíclicos;
- grupos C_{5-18} -arila, C_{7-19} -aralquila ou C_{7-19} -alcarila,

[0067] sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados de grupos $-R'$, halogênio ($-X$), alcóxi ($-$

OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN) e grupos amida (-CONR'₂), em que R' tem os significados acima.

[0068] R³ é selecionado de:

- grupos ciano (-CN), mercapto (-SH), tioéter (-SR"), alcóxi (-OR") e acila (-C(=O)-R"), em que R" tem os significados acima;

- grupos C₁₋₁₂-alquila, C₂₋₁₂-alquenila, C₂₋₁₂-alquinila lineares ou ramificados, grupos C₃₋₈-alquila, C₄₋₈-alquenila, C₄₋₈-alquinila cíclicos, grupos C₅₋₁₈-arila, C₇₋₁₉-aralquila ou C₇₋₁₉-alcarila, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados de grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN) e grupos amida (-CONR'₂), em que R' tem os significados acima.

[0069] Em uma forma de concretização alternativa da presente invenção, R² e R³, R² e R¹ ou R¹ e R³ juntos com o átomo de nitrogênio, ao qual estão ligados ou com outros átomos, selecionados de N, O, P e S, podem formar um anel com quatro a sete membros, que pode ser novamente substituído com um ou mais grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN) e grupos amida (-CONR'₂), em que R' tem os significados acima.

[0070] R⁴ é selecionado de:

- átomos de halogênio (X-);
- grupos ciano (-CN), mercapto (-SH), tioéter (-SR"), alcóxi (-OR") e acila (-C(=O)-R"), em que R" tem os significados acima;

- grupos C₁₋₁₂-alquila, C₂₋₁₂-alquenila, C₂₋₁₂-alquinila lineares ou ramificados, grupos C₃₋₈-alquila, C₄₋₈-alquenila, C₄₋₈-alquinila cíclicos,

cos ou grupos C₅₋₁₈-arila, C₇₋₁₉-aralquila ou C₇₋₁₉-alcarila, sendo que no sistema de anel de todos os grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados de grupos -R', halogênio (-X), alcóxi (-OR'), tioéter ou mercapto (-SR'), amino (-NR'₂), silila (-SiR'₃), carboxila (-COOR'), ciano (-CN) e grupos amida (-CONR'₂), em que R' tem os significados acima.

[0071] R⁵ é selecionado de:

[0072] grupos C₅₋₁₈-arila, C₇₋₁₉-aralquila ou C₇₋₁₉-alcarila, sendo que no sistema de anel dos grupos cíclicos mencionados acima, um ou mais átomos de carbono podem ser substituídos por heteroátomos, selecionados de N, O, P e S e todos os grupos mencionados acima podem ser substituídos com um ou mais grupos, que são selecionados de grupos -R', -X, -OR', -SR', -NR'₂, -SiR'₃, -COOR', -CN e -CONR'₂, em que R' tem os significados acima.

[0073] Na fórmula (I), os radicais têm os significados *preferidos* definidos a seguir. As definições referidas como *preferidas* valem para todos os produtos intermediários do mesmo modo:

[0074] A é selecionado de O, CH₂ e de uma ligação simples

[0075] x é preferivelmente um número inteiro, selecionado de 2 ou 3;

[0076] R¹ é *preferivelmente* selecionado do grupo que consiste em hidrogênio, um grupo mercapto (-SH) ou grupos C₁₋₈-alquila.

[0077] R² é *preferivelmente* selecionado de grupos C₁₋₈-alquila lineares ou ramificados;

[0078] R³ é *preferivelmente* selecionado de grupos C₁₋₈-alquila lineares, ramificados e grupos C₃₋₈-alquila cíclicos.

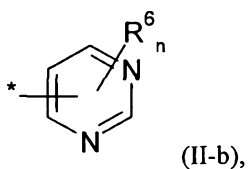
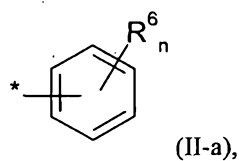
[0079] De forma alternativa, *preferivelmente* R² e R³ juntos com o átomo de nitrogênio, ao qual estão ligados ou com outros átomos, po-

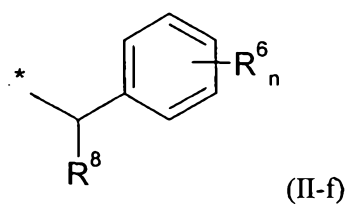
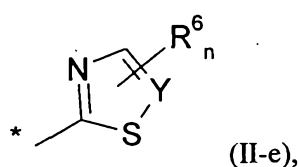
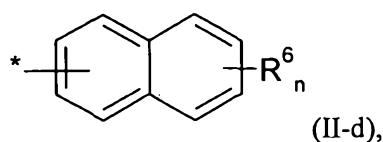
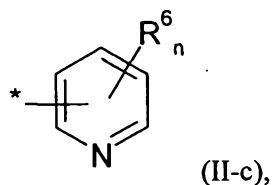
dem formar um anel com cinco a seis membros, que pode ser substituído com grupos R'-, X-, OR'-, SR'-, NR'₂, SiR'₃, em que R' tem os significados acima.

[0080] R⁴ é *preferivelmente* selecionado de:

- átomos de halogênio (-X);
- grupos C₁₋₈-alquila lineares ou ramificados ou
- grupos C₁₋₅-halogenoalquila lineares ou ramificados.

[0081] R⁵ é *preferivelmente* selecionado de grupos das fórmulas (II-a) a (II-f)





nas quais

[0082] caracteriza a ligação ao átomo A ou a ligação simples.

[0083] n é um número inteiro de 0, 1, 2 ou 3;

[0084] Y é N ou CH,

[0085] R⁶ é selecionado de hidrogênio, grupos C₁₋₁₂-alquila lineares, grupos C₃₋₈-alquila ramificados ou cíclicos, átomos de halogênio, grupos C₁₋₅-haloalquila;

[0086] R⁸ é selecionado de grupos C₁₋₁₂-alquila.

[0087] Em uma forma de concretização preferida de acordo com a invenção, A é O e no grupo (II-a) n é 0.

[0088] Em uma outra forma de concretização preferida da invenção, A é O e no grupo (II-a) n é 2.

[0089] Em uma outra forma de concretização preferida da invenção, A é O e no grupo (II-b) n é 1 ou 2.

[0090] Em uma outra forma de concretização preferida da inven-

ção, A é O e no grupo (II-c) n é 1 ou 2.

[0091] Em uma outra forma de concretização preferida da invenção, A é O e no grupo (II-d) n é 1 ou 2.

[0092] Em uma outra forma de concretização preferida da invenção, A é O e no grupo (II-e) n é 1, Y é N e R⁶ é t-butila ou iso-propila.

[0093] Em uma outra forma de concretização preferida da invenção, A é CH₂ e no grupo (II-f) n é 1 ou 2 e R⁸ é metila ou etila.

[0094] Na fórmula (I), os radicais têm os significados *particularmente preferidos* definidos a seguir. As definições referidas como *particularmente preferidas* valem para todos os produtos intermediários do mesmo modo:

[0095] A é oxigênio.

[0096] x é de modo *particularmente* preferido um número inteiro, selecionado de 2 ou 3;

[0097] R¹ é de modo *particularmente* preferido selecionado de
- hidrogênio,
- metila e etila.

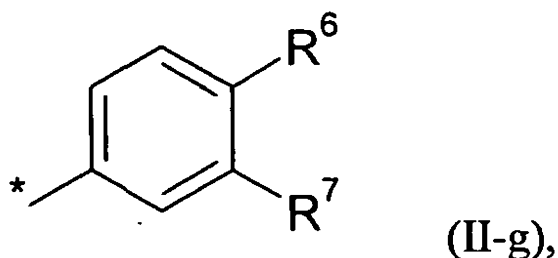
[0098] R² é selecionado de modo *particularmente* preferido de metila e etila.

[0099] R³ é selecionado de modo *particularmente* preferido de metila, etila e ciclopropila.

[00100] Alternativamente, R² e R³ formam, de modo particularmente preferido, juntos com o átomo de nitrogênio, ao qual estão ligados, um anel piperidila ou pirrolidila.

[00101] R⁴ é selecionado de modo *particularmente* preferido de átomos de Cl e F e grupos -CF₃, -CF₂H e metila e R⁵ é selecionado dos grupos (i) a (iii)

(i) grupos da fórmula (II-g)

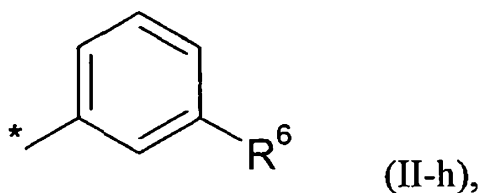


[00102] na qual

[00103] R^6 é halogênio, um grupo C_{1-8} -alquila, um grupo C_{1-5} -halogenoalquila e

[00104] R^7 é hidrogênio, halogênio, cloro ou flúor, um grupo C_{1-8} -alquila ou um grupo C_{1-5} -halogenoalquila, ou R^6 e R^7 juntos com os átomos do anel, aos quais estão ligados ou com outros átomos, selecionados de N, O, P e S, podem formar um anel com quatro a sete membros, que pode ser substituído com um ou mais grupos X-, R' -, OR' -, SR' -, NR'_2 -, SiR'_3 -, em que R' tem os significados acima;

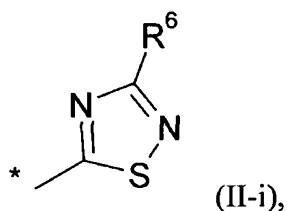
(ii) grupos da fórmula (II-h)



[00105] na qual

[00106] R^6 pode ser halogênio, um grupo C_{1-8} -alquila linear ou ramificado, um grupo C_{3-12} -cicloalquila, grupos C_{5-18} -arila, C_{7-19} -aralquila ou C_{7-19} -alcarila, em que os grupos mencionados acima podem ser substituídos com SiR'_3 -, $-OR'$ e $-CN$, em que R' tem os significados acima,

(iii) grupos da fórmula (II-i)



[00107] na qual

[00108] R^6 pode ser um grupo C_{1-8} -alquila.

[00109] *Particularmente preferida* é a forma de concretização de acordo com a invenção, na qual A é O e no grupo (II-g), R^6 é Cl ou F e R^7 é um grupo C_{1-8} -alquila, preferivelmente terc-butila ou iso-propila.

[00110] Além disso, o grupo (II-h) em conexão com A=O é preferido.

[00111] Dependendo da natureza dos substituintes definidos acima, as amidinas de acordo com a invenção, apresentam propriedades ácidas ou básicas e podem formar sais, eventualmente também sais internos ou produtos de adição com ácidos inorgânicos ou orgânicos ou com bases ou com íons de metais.

[00112] Como íons de metais interessam especialmente os íons dos elementos do segundo grupo principal, especialmente cálcio e magnésio, do terceiro e quarto grupo principal, especialmente alumínio, estanho e chumbo, bem como do primeiro até o oitavo subgrupo, especialmente cromo, manganês, ferro, cobalto, níquel, cobre, zinco e outros. Os íons de metais dos elementos do quarto período são particularmente preferidos. Nesse caso, os metais podem estar presentes nas várias valências que eles podem assumir.

[00113] Se os compostos da fórmula (I) portam hidróxi, carbóxi ou outros grupos indutores de propriedades ácidas, então esses compostos podem ser reagidos com bases para formar sais.

[00114] Bases adequadas são, por exemplo, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos dos metais alcalinos e alcalino-terrosos, especialmente os de sódio, potássio, magnésio e cálcio, além disso, amoníaco, aminas primárias, secundárias e terciárias com grupos (C_1 - C_4)-alquila, mono-, di- e trialcanolaminas de (C_1 - C_4)-alcanóis, colina bem como clorocolina.

[00115] Se os compostos da fórmula (I) portam amino, alquilamino

ou outros grupos indutores de propriedades básicas, então esses compostos podem ser reagidos com ácidos para formar sais.

[00116] Exemplos de ácidos inorgânicos são ácidos halogenídricos, tais como ácido fluorídrico, ácido clorídrico, ácido bromídrico e ácido iodídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico e ácido nítrico e sais ácidos, tais como NaHSO_4 e KHSO_4 .

[00117] Como ácidos orgânicos interessam, por exemplo, ácido fórmico, ácido carbônico e ácidos alcanoicos, tais como ácido acético, ácido trifluoracético, ácido tricloroacético e ácido propiônico, bem como ácido glicólico, ácido tiociânico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinâmico, ácido oxálico, ácidos alquilsulfônicos (ácidos sulfônicos com grupos alquila em cadeia linear ou ramificada com 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfônicos e ácidos arildissulfônicos (radicais aromáticos, tais como fenila e naftila, os quais portam um ou dois grupos de ácido sulfônico), ácidos alquilsulfônicos (ácidos sulfônicos com grupos alquila em cadeia linear ou ramificada com 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfônicos ou ácidos arildissulfônicos (radicais aromáticos, tais como fenila e naftila, os quais portam um ou dois radicais de ácido sulfônico), sendo que os grupos alquila ou arila podem portar outros substituintes, por exemplo, ácido p-toluenossulfônico, ácido salicílico, ácido p-aminossalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico e outros.

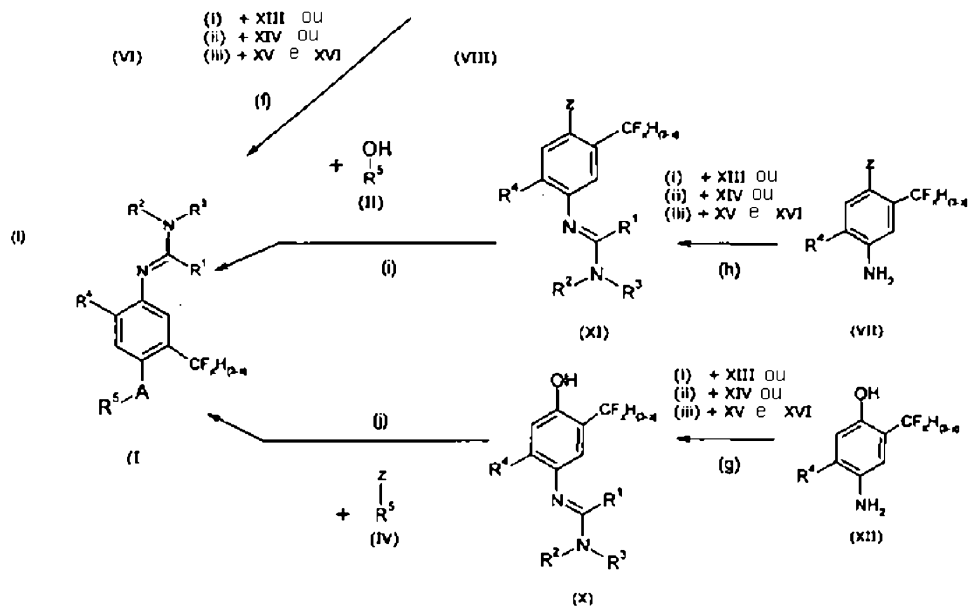
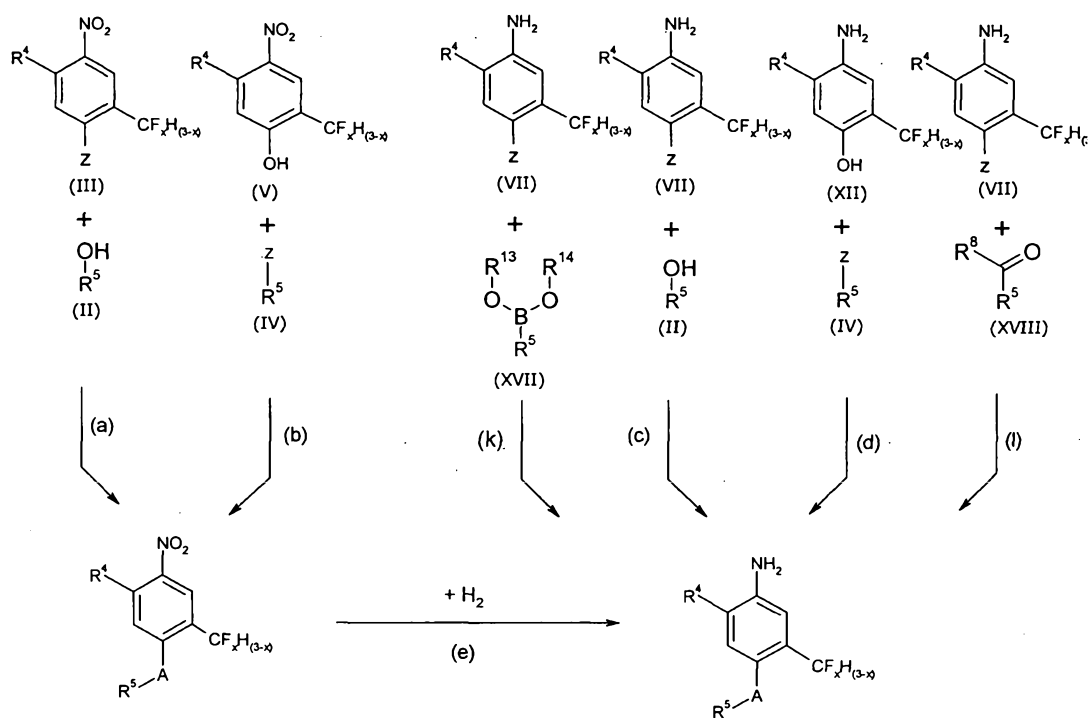
[00118] Os sais obteníveis dessa maneira também apresentam propriedades fungicidas.

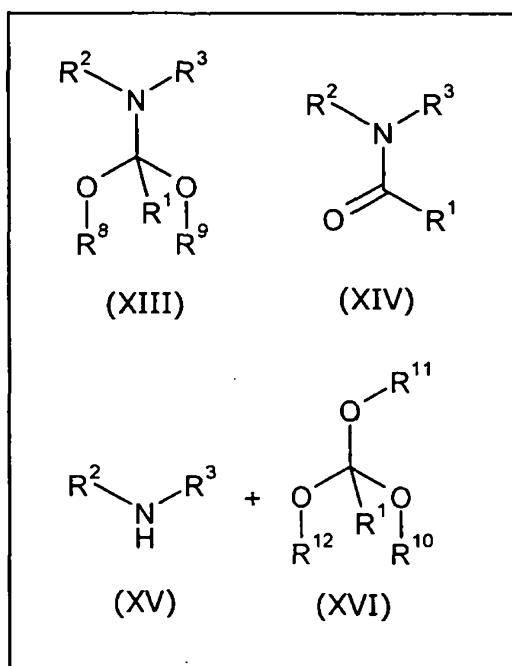
[00119] Amidinas particularmente preferidas no contexto com a presente invenção, são selecionadas de grupos que consistem em (1) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*terc*-butil-4-clorofenóxi)-5-fluormetil-2-metilfenil]formamidina, (2) N-etil-N-metil-N'-[4-(4-*terc*-butilfenil)-5-fluormetil-2-metilfenil]formamidina, (3) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*terc*-butil-4-clorofenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (4) N-etil-N-metil-

N'-[4-(3-*iso*-propil-fenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (5) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-trifluormetil-4-clorofenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (6) N-propil-N-metil-N'-[4-(3-trifluormetil-4-clorofenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (7) N-piperidinil-N'-[4-(3-trifluormetil-4-clorofenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (8) N,N-dimetil-N'-[4-(3-*terc*-butil-4-clorofenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (9) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*terc*-butil-4-clorofenóxi)-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (10) N-etil-N-metil-N'-[4-(3,4-diclorofenóxi)-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (11) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*terc*-butil-fenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina, (12) N-etil-N-metil-N'-[4-(4-*terc*-butilfenil)-5-trifluormetil-2-etilfenil]formamidina, (13) N-etil-N-metil-N'-[4-fenóxi-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (14) N-piperidinil-N'-[4-(3-*iso*-propil-fenóxi)-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (15) N-etil-N-metil-N'-[4-[3-(1-hidroxietil)-fenóxi]-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (16) N-etil-N-metil-N'-[4-[3-(1-fluoretíl)-fenóxi]-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (17) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*iso*-propil-4-clorofenóxi)-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina, (18) N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*iso*-propil-fenóxi)-5-difluormetil-2-metilfenil]formamidina.

Preparação das amidinas de acordo com a invenção

[00120] As amidinas de acordo com a invenção, podem ser obtidas através do processo apresentado no seguinte esquema (I):

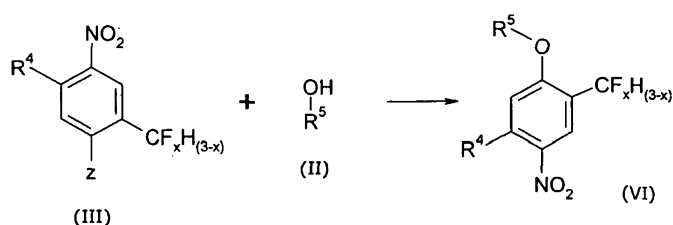




Esquema (I)

Estágio (a)

[00121] Em uma forma de concretização de acordo com a invenção, os derivados de nitrobenzeno da fórmula (III) são reagidos com álcoois ou fenóis da fórmula (II) ou com os alcoolatos ou fenolatos formados destes, de acordo com o seguinte esquema de reação para formar éteres nitrofenílicos da fórmula (VI):



[00122] Como grupo de partida (Z) são adequados todos os substituintes, que apresentam uma nucleofugicidade suficiente nas condições de reação predominantes. Por exemplo, como grupos de partida adequados sejam mencionados halogênios, triflato, mesilato, tosilato ou SO₂Me.

[00123] A reação é eventualmente efetuada na presença de uma

base.

[00124] Bases adequadas são bases orgânicas e inorgânicas, que são normalmente usadas em tais reações. Preferivelmente, são usadas bases, que são selecionadas, por exemplo, do grupo que consiste em hidretos, hidróxidos, amidas, alcoolatos, acetatos, fluoretos, fosfatos, carbonatos e bicarbonatos de metais alcalinos ou alcalino-terrosos. Nesse caso, preferem-se particularmente amida de sódio, hidreto de sódio, di-isopropilamida de lítio, metanolato 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 cézio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio e carbonato de cézio. Além disso, são aminas terciárias, tais como por exemplo, trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbenzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilpirrolidona, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclo-octano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) e diazabicycloundeceno (DBU).

[00125] Eventualmente pode ser usado um catalisador, que é selecionado do grupo que consiste em paládio, cobre e seus sais ou complexos.

[00126] A reação do derivado de nitrobenzeno com o fenol pode ser efetuada em substância ou em um solvente, preferivelmente a reação é efetuada em um solvente, o qual é selecionado a partir de solventes convencionais, inertes nas condições de reação predominantes.

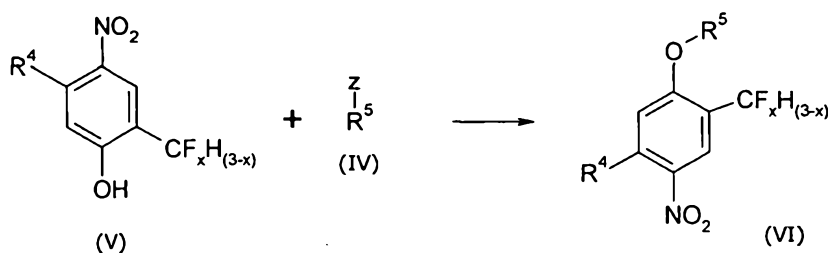
[00127] São preferidos hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como, por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclo-hexano, metilciclo-hexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbonetos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloreto ou tricloreto; éteres, tais como, por exemplo, éter

dietílico, éter di-isopropílico, éter metil-terc-butílico (MTBE), éter metil-terc-amílico, dioxano, tetra-hidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como, por exemplo, acetonitrila, propionitrila, n- ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como, por exemplo, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona (NMP) ou triamida de ácido hexametenofosfórico; ou misturas desses com água, bem como água pura.

[00128] A reação pode ser efetuada no vácuo, a pressão normal ou sob sobrepressão e a temperaturas de -20 a 200°C, preferivelmente a reação é efetuada a pressão normal e temperaturas de 50 a 150°C.

Estágio (b)

[00129] Em uma forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, os derivados de nitrofenol da fórmula (V) ou os fenolatos formados destes são reagidos com derivados de fenila da fórmula (IV) de acordo com o seguinte esquema de reação, para formar os éteres nitrofenílicos da fórmula (VI):

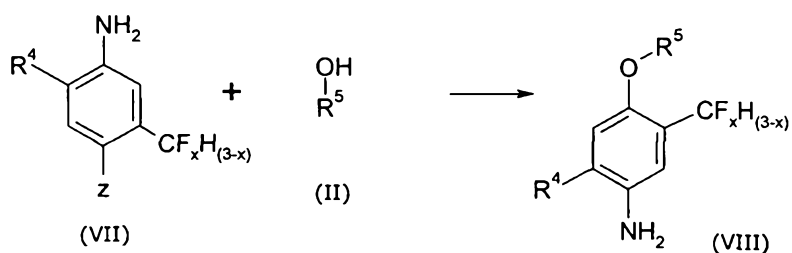


[00130] Com respeito às condições de reação, solventes, catalisadores e grupos de partida adequados, deve ser feita referência ao estágio (a).

Estágio (c)

[00131] Em uma outra forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, as anilinas da fórmula (VII) são reagidas com álcoois ou fenóis da fórmula (II) ou com os alcoolatos ou fenolatos formados destes, de acordo com o seguinte esquema de reação, para formar os

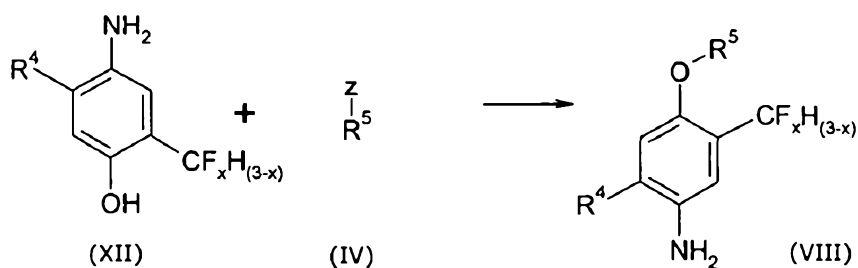
éteres aminofenílicos da fórmula (VIII):



[00132] Com respeito às condições de reação, solventes, catalisadores e grupos de partida adequados, deve ser feita referência ao estágio (a).

Estágio (d)

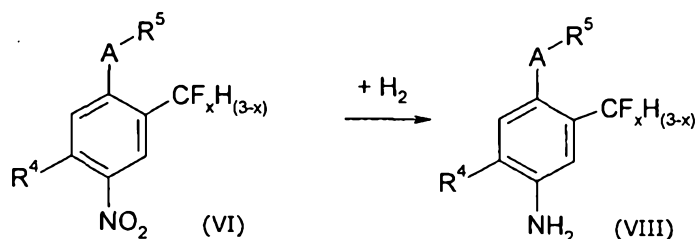
[00133] Em uma outra forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, os aminofenóis da fórmula (XII) são reagidos com derivados de fenila da fórmula (IV) de acordo com o seguinte esquema de reação, para formar os éteres aminofenílicos da fórmula (VIII):



[00134] Com respeito às condições de reação, solventes, catalisadores e grupos de partida adequados, deve ser feita referência ao estágio (c).

Estágio (e)

[00135] Os fluoralquilnitrofenóis da fórmula (VI) obtidos nos estágios (a), (b) e (n) podem ser reduzidos de acordo com o seguinte esquema de reação para formar as fluoralquilanilinas da fórmula (VIII):



[00136] A redução de acordo com o estágio (e) pode ser efetuada por todos os métodos descritos no estado da técnica para a redução de grupos nitro.

[00137] Eventualmente, a redução é efetuada com cloreto de estanho em ácido clorídrico concentrado, tal como descrito na WO 0046184. Alternativamente, contudo, a redução também pode ser efetuada com gás de hidrogênio, preferivelmente na presença de catalisadores de hidrogenação, tais como, por exemplo, níquel de Raney ou Pd/C. As condições de reação são descritas no estado da técnica e conhecidas pelo técnico.

[00138] Se a redução é efetuada na fase líquida, então a reação deveria ser efetuada em um solvente inerte em relação às condições de reação predominantes. Um desses é, por exemplo, tolueno.

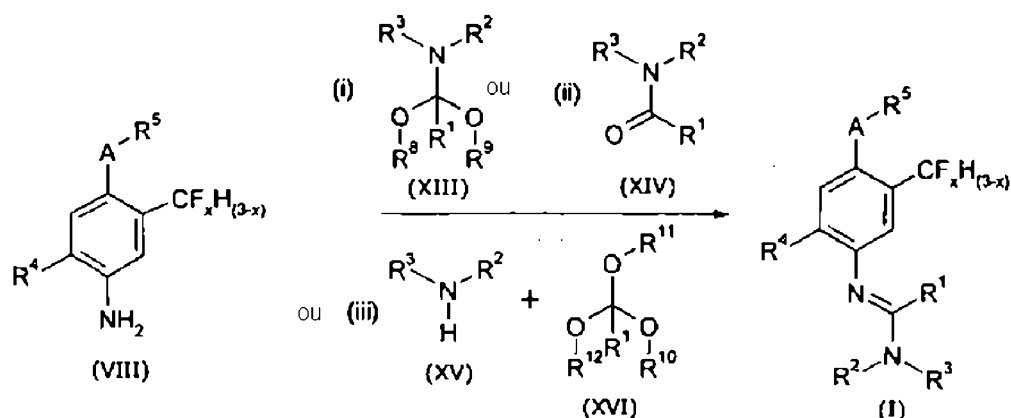
Estágio (f)

[00139] A reação dos éteres anilínicos da fórmula (VIII) para formar as amidinas da fórmula (I) de acordo com a invenção, de acordo com o estágio (f) pode, tal como mostrado acima no esquema (I), ser efetuada por vários métodos alternativos com o uso de

(i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou

(ii) amidas da fórmula (XIV) ou

(iii) aminas da fórmula (XV) na presença de ortoésteres da fórmula (XVI) de acordo com o seguinte esquema de reação:



[00140] Em consequência disto, as formas de concretização alternativas (i) a (iii) individuais do processo de acordo com a invenção, devem ser brevemente elucidadas:

(i) conforme uma forma de concretização de acordo com a invenção, que é mostrada no esquema (I) como estágio (i), os éteres anilínicos da fórmula (VIII) são reagidos com aminoacetais da fórmula (XIII), na qual R^2 e R^3 são definidos tal como descrito acima e R^8 e R^9 são selecionados dos grupos C_{1-8} -alquila, preferivelmente de grupos C_{2-6} -alquila, de modo particularmente preferido de grupos C_{3-5} -alquila e que juntos com os átomos de oxigênio, aos quais estão ligados, podem formar um anel carbocíclico com cinco ou seis membros, para formar as fenoxifenilamidinas da fórmula (I) de acordo com a invenção.

[00141] Os aminoacetais da fórmula (XIII) são obteníveis das formamidinas descritas em JACS, 65, 1566 (1943), através da reação com reagentes de alquilação, tal como, por exemplo, sulfato de dimetila.

[00142] A reação de acordo com o estágio (i) é eventualmente efetuada na presença de um ácido.

[00143] Ácidos adequados são, por exemplo, selecionados do grupo que consiste em ácidos orgânicos e inorgânicos, entre eles, ácido p-toluenossulfônico, ácido metanossulfônico, ácido clorídrico (gasoso, aquoso ou em solução orgânica) ou ácido sulfúrico.

(ii) Em uma forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, que é mostrada no esquema (I) como estágio (ii), os éteres anilínicos da fórmula (VIII) são reagidos com amidas da fórmula (XIV), na qual os grupos R^1 a R^3 são definidos tal como acima, para formar as fenoxifenilamidinas de acordo com a invenção.

[00144] A reação de acordo com o esquema (ii) é eventualmente efetuada na presença de um agente de halogenação. Agentes de halogenação adequados são selecionados, por exemplo, do grupo que consiste em PCl_5 , PCl_3 , $POCl_3$ ou $SOCl_2$.

[00145] Além disso, a reação pode ser efetuada alternativamente na presença de um agente de condensação.

[00146] Agentes de condensação adequados são aqueles, que normalmente são usados para a ligação de ligações amida, por exemplo, sejam mencionados formadores de halogeneto de ácido, tais como, por exemplo, fosgênio, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, óxido de tricloreto de fósforo ou cloreto de tionila; formadores de anidrido, tais como, por exemplo, cloroformiato, cloroformiato de metila, cloroformiato de isopropila, cloroformiato de isobutila ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidas, tais como, por exemplo, N,N'-diciclo-hexilcarbodiimida (DCC) ou outros agentes de condensação convencionais, tais como, por exemplo, pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbodiimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonil-1,2-di-hidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano ou hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfônio.

[00147] A reação de acordo com o estágio (ii) é preferivelmente efetuada em um solvente, o qual é selecionado dos solventes convencionais, inertes nas condições de reação predominantes. É dada preferência aos hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclo-hexano, metilciclo-hexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbône-

tos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloreto ou tricloreto; éteres, tais como, por exemplo, éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-terc-butílico (MTBE), éter metil-terc-amílico, dioxano, tetra-hidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como, por exemplo, acetonitrila, propionitrila, n- ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como, por exemplo, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona (NMP) ou triamida de ácido hexametileno-fosfórico; ésteres, tais como, por exemplo, acetato de metila ou acetato de etila; sulfóxidos, tal como, por exemplo, dimetilsulfóxido (DMSO); sulfonas, tal como, por exemplo, sulfolano; álcoois, tais como, por exemplo, metanol, etanol, n- ou iso-propanol, n-, iso-, sec- ou terc-butanol, etanodiol, propan-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, éter dietilenoglicolmono-metílico, éter dietilenoglicolmonoetílico ou misturas destes.

(iii) Conforme uma outra forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, que é mostrada no esquema (I) como estágio (iii), os éteres anilínicos da fórmula (VIII) são reagidos com aminas da fórmula (XV), na qual os grupos R^2 e R^3 são definidos como acima, na presença de ortoésteres da fórmula (XVI), na qual R^1 é definido como acima e R^{10} a R^{12} independentes uns dos outros, são selecionados de grupos C_{1-8} -alquila, preferivelmente de grupos C_{2-6} -alquila, de modo particularmente preferido, de grupos C_{3-5} -alquila, para formar as fenoxifenilamidinas 4-substituídas.

[00148] A reação de acordo com o estágio (iii) é preferivelmente efetuada em um solvente, o qual é selecionado dos solventes convencionais, inertes nas condições de reação predominantes. É dada preferência aos hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclo-hexano, metilciclo-hexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; hidrocarbône-

tos halogenados, tais como, por exemplo, clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloreto ou tricloreto; éteres, tais como, por exemplo, éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-terc-butílico (MTBE), éter metil-terc-amílico, dioxano, tetra-hidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como, por exemplo, acetonitrila, propionitrila, n- ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como, por exemplo, N,N-dimetilformamida (DMF), N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona (NMP) ou triamida de ácido hexametenofosfórico; ésteres, tais como, por exemplo, acetato de metila ou acetato de etila; sulfóxidos, tal como, por exemplo, dimetilsulfóxido (DMSO); sulfonas, tal como, por exemplo, sulfolano; álcoois, tais como, por exemplo, metanol, etanol, n- ou iso-propanol, n-, iso-, sec- ou terc-butanol, etanodiol, propan-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, éter dietilenoglicolmonometílico, éter dietilenoglicolmonoetílico ou misturas destes com água bem como água pura.

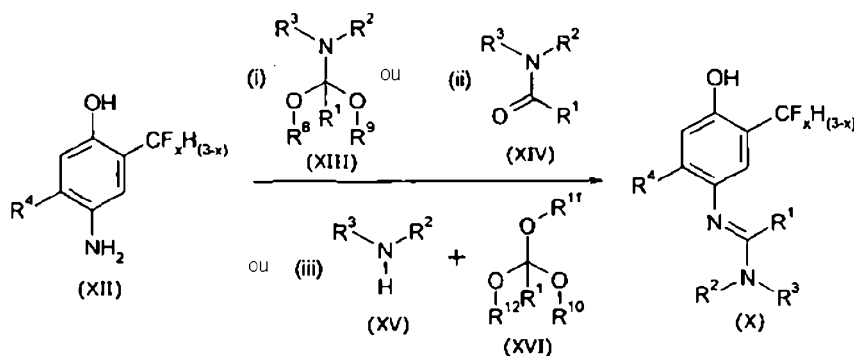
Estágio (g)

[00149] Em uma forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, os aminofenóis da fórmula (XII) já podem ser reagidos

(i) com aminoacetais da fórmula (XIII) ou

(ii) com amidas da fórmula (XIV) ou

(iii) com aminas da fórmula (XV) na presença de ortoésteres da fórmula (XVI) de acordo com o seguinte esquema de reação, para formar amidinas da fórmula (X):



[00150] Com respeito às condições de reação, solventes, catalisadores deve ser feita referência ao estágio (f).

[00151] A outra reação das amidinas da fórmula (X) para formar as moléculas-alvo da fórmula (I) de acordo com a invenção, pode ser efetuada, por exemplo, tal como descrito no estágio (j).

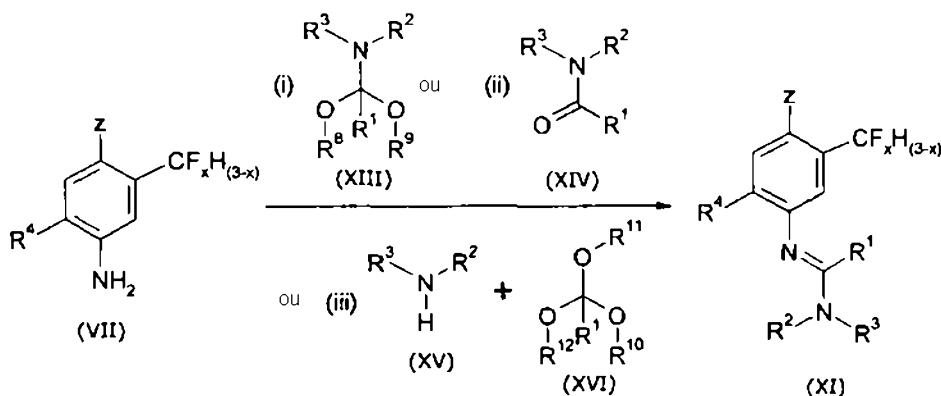
Estágio (h)

[00152] Em uma forma de concretização alternativa de acordo com a invenção, os derivados de aminofenila da fórmula (VII) podem ser reagidos

(i) com aminoacetais da fórmula (XIII) ou

(ii) com amidas da fórmula (XIV) ou

(iii) com aminas da fórmula (XV) na presença de ortoésteres da fórmula (XVI) de acordo com o seguinte esquema de reação, para formar amidinas da fórmula (XI):



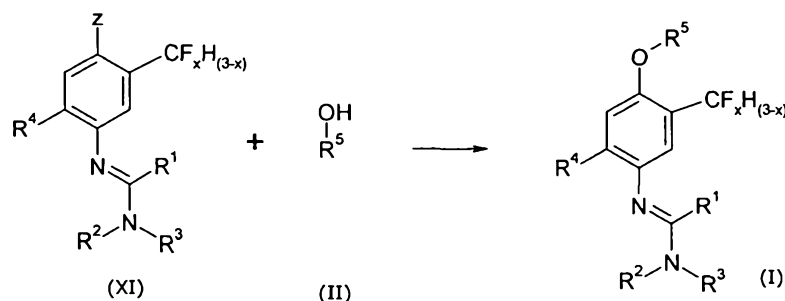
[00153] Com respeito às condições de reação, solventes, catalisadores deve ser feita referência ao estágio (f).

[00154] A outra reação das amidinas da fórmula (XI) para formar as moléculas-alvo da fórmula (I) de acordo com a invenção, pode ser efetuada, por exemplo, tal como descrito no estágio (i).

Estágio (i)

[00155] Conforme uma outra forma de concretização de acordo com a invenção, as amidinas da fórmula (XI) obteníveis do estágio (h) podem ser reagidas com álcoois ou fenolatos da fórmula (II) ou com os

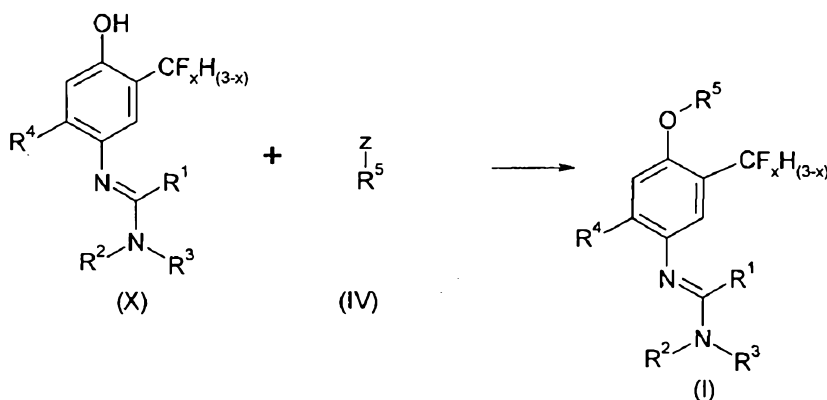
alcooolatos ou fenolatos formados destes para formar as moléculas-alvo da fórmula (I) de acordo com a invenção, de acordo com o seguinte esquema de reação:



[00156] Com respeito às condições de reação, solventes e catalisadores deve ser feita referência ao estágio (a).

Estágio (j)

[00157] Conforme uma outra forma de concretização de acordo com a invenção, as amidinas da fórmula (X) obteníveis do estágio (g) podem ser reagidas com derivados de fenila 4-substituídos da fórmula (IV) para formar as moléculas-alvo da fórmula (I) de acordo com a invenção, de acordo com o seguinte esquema de reação:

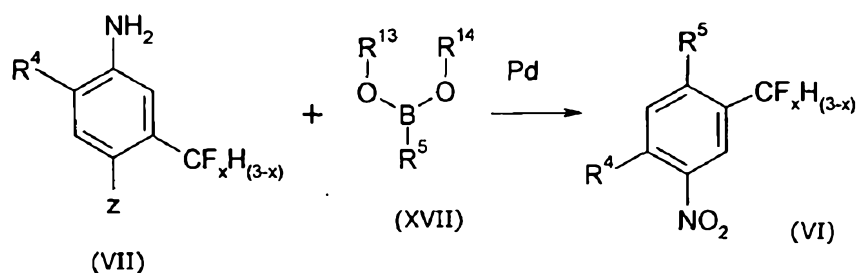


[00158] Com respeito às condições de reação, solventes e catalisadores, deve ser feita referência ao estágio (b).

Estágio (k)

[00159] A reação de fluoralquilanilinas da fórmula (VII) com derivados de ácido borônico da fórmula (XVII) de acordo com o seguinte es-

quema de reação:



[00160] Nas fórmulas descritas acima,

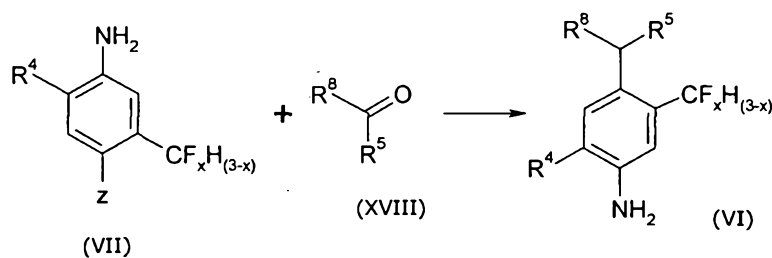
x, Z, R¹ a R⁵ têm os significados acima

R¹³ e R¹⁴ são, independentes uns dos outros, selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, C₁₋₁₂-alquila, C₂₋₁₂-alquenila, C₂₋₁₂-alquinila ou C₅₋₁₈-arila ou C₇₋₁₉-arilalquila e juntos com os átomos de oxigênio, aos quais estão ligados, podem formar um anel com cinco, seis ou sete membros.

[00161] A reação é efetuada de acordo com o método de Suzuki, que é detalhadamente esclarecida na PCT/EP2006/066271.

Estágio (I)

[00162] Reação de fluoralkuilanilinas da fórmula (VII) com aldeídos ou cetonas da fórmula (XVIII) de acordo com o seguinte esquema de reação:

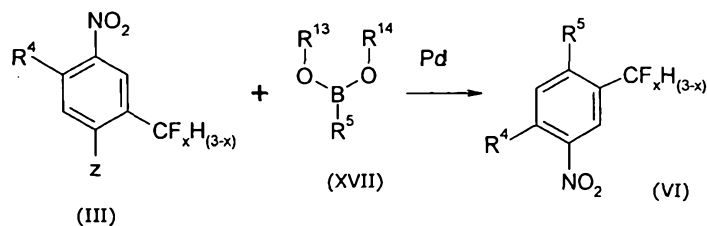


[00163] Com respeito às condições do processo, deve ser feita referência à publicação da PCT/EP2006/066295.

Estágio (m)

[00164] Reação de fluoralkuilnitrobenzenos da fórmula (III) com derivados de ácido borônico da fórmula (XVII) de acordo com o seguinte

esquema de reação:



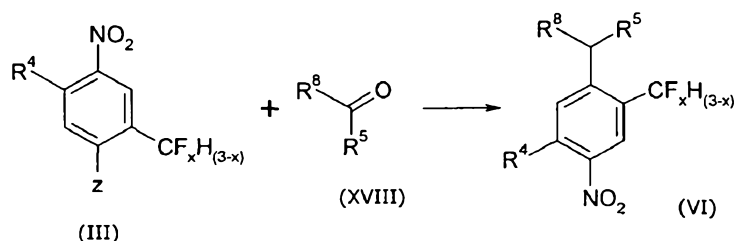
[00165] em que nas fórmulas descritas acima,

[00166] x , Z , R^1 a R^5 , R^{13} e R^{14} apresentam o significado acima.

[00167] Com respeito às condições do processo, deve ser feita referência à publicação da PCT/EP2006/066295.

Estágio (n)

[00168] Reação de fluoralkilnitrobenzenos da fórmula (III) com aldeídos ou cetonas da fórmula (XVIII) de acordo com o seguinte esquema de reação:



[00169] A reação é efetuada de acordo com o método de Suzuki, que é detalhadamente esclarecida na PCT/EP2006/066271.

[00170] No contexto com os processos de acordo com a invenção, para a preparação das amidinas da fórmula (I), as seguintes combinações de estágios de reação devem ser consideradas como vantajosas: estágios (a), (e) e (f); estágios (k), (e) e (f); estágios (m), (e) e (f); estágios (b), (e) e (f); estágios (c) e (f); estágios (d) e (f); estágios (l) e (f); estágios (n) e (f); estágios (h) e (i) e/ou estágios (g) e (j).

[00171] A preparação das amidinas de acordo com a invenção, é preferivelmente efetuada sem isolamento intermediário dos produtos intermediários.

[00172] A purificação final das amidinas pode ser efetuada através de processos de purificação convencionais. Preferivelmente, a purificação é efetuada através de cristalização.

Combate de micro-organismos indesejados

[00173] As amidinas de acordo com a invenção, apresentam um forte efeito microbicida e podem ser aplicadas para o combate de micro-organismos indesejados, tais como fungos e bactérias, na proteção de plantas e na proteção de material.

Proteção de plantas

[00174] As substâncias de acordo com a invenção, apresentam um forte efeito microbicida e podem ser aplicadas para o combate de micro-organismos indesejados, tais como fungos e bactérias, na proteção de plantas e na proteção de material.

[00175] Fungicidas podem ser usados na proteção de plantas para combater Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes e Deuteromycetes.

[00176] Bactericidas podem ser usados na proteção de plantas para combater Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae e Streptomycetaceae.

[00177] Por exemplo, mas não restringindo, sejam mencionados alguns patógenos de doenças fúngicas e bacterianas, que recaem sob os termos gerais mencionados acima:

[00178] doenças causadas por patógenos do oídio, tais como, por exemplo,

[00179] espécies de Blumeria, tais como, por exemplo, Blumeria graminis;

[00180] espécies de Podosphaera, tal como, por exemplo, Podosphaera leucotricha;

[00181] espécies de Sphaerotheca, tal como, por exemplo, Sphaerotheca fuliginea;

- [00182] espécies de *Uncinula*, tal como, por exemplo, *Uncinula necator*;
- [00183] doenças causadas por patógenos de doenças da ferrugem, tais como, por exemplo,
- [00184] espécies de *Gymnosporangium*, tal como, por exemplo, *Gymnosporangium sabinae*;
- [00185] espécies de *Hemileia*, tal como, por exemplo, *Hemileia vastatrix*;
- [00186] espécies de *Phakopsora*, tal como, por exemplo, *Phakopsora pachyrhizi* e *Phakopsora meibomia*;
- [00187] espécies de *Puccinia*, tal como, por exemplo, *Puccinia recondita*;
- [00188] espécies de *Uromyces*, tal como, por exemplo, *Uromyces appendiculatus*;
- [00189] doenças causadas por patógenos do grupo dos Oomycetes, tais como, por exemplo,
- [00190] espécies de *Bremia*, tal como, por exemplo, *Bremia lactucae*;
- [00191] espécies de *Peronospora*, tal como, por exemplo, *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*;
- [00192] espécies de *Phytophthora*, tal como, por exemplo, *Phytophthora infestans*; espécies de *Plasmopara*, tal como, por exemplo, *Plasmopara viticola*;
- [00193] espécies de *Pseudoperonospora*, tais como, por exemplo, *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*;
- [00194] espécies de *Pythium*, tal como, por exemplo, *Pythium ultimum*;
- [00195] doenças de manchas nas folhas e murchamentos das folhas causadas, por exemplo, por
- [00196] espécies de *Alternaria*, tal como, por exemplo, *Alternaria*

solani;

[00197] espécies de *Cercospora*, tal como, por exemplo, *Cercospora beticola*;

[00198] espécies de *Cladosporium*, tal como, por exemplo, *Cladosporium cucumerinum*; espécies de *Cochliobolus*, tal como, por exemplo, *Cochliobolus sativus* (forma de conídias: *Drechslera*, sinônimo: *Helminthosporium*);

[00199] espécies de *Colletotrichum*, tal como, por exemplo, *Colletotrichum lindemuthianum*;

[00200] espécies de *Cycloconium*, tal como, por exemplo, *Cycloconium oleaginum*;

[00201] espécies de *Diaporthe*, tal como, por exemplo, *Diaporthe citri*;

[00202] espécies de *Elsinoe*, tal como, por exemplo, *Elsinoe fawcettii*;

[00203] espécies de *Gloeosporium*, tal como, por exemplo, *Gloeosporium laeticolor*; espécies de *Glomerella*, tal como, por exemplo, *Glomerella cingulata*;

[00204] espécies de *Guignardia*, tal como, por exemplo, *Guignardia bidwelli*;

[00205] espécies de *Leptosphaeria*, tal como, por exemplo, *Leptosphaeria maculans*; espécies de *Magnaporthe*, tal como, por exemplo, *Magnaporthe grisea*;

[00206] espécies de *Mycosphaerella*, tal como, por exemplo, *Mycosphaerella graminicola* e *Mycosphaerella fijiensis*;

[00207] espécies de *Phaeosphaeria*, tal como, por exemplo, *Phaeosphaeria nodorum*;

[00208] espécies de *Pyrenophora*, tal como, por exemplo, *Pyrenophora teres*;

[00209] espécies de *Ramularia*, tal como, por exemplo, *Ramularia*

collo-cygni;

[00210] espécies de *Rhynchosporium*, tal como, por exemplo, *Rhynchosporium secalis*;

[00211] espécies de *Septoria*, tal como, por exemplo, *Septoria apii*;

[00212] espécies de *Typhula*, tal como, por exemplo, *Typhula incarnata*;

[00213] espécies de *Venturia*, tal como, por exemplo, *Venturia inaequalis*;

[00214] doenças da raiz e caule, causadas, por exemplo, por

[00215] espécies de *Corticium*, tal como, por exemplo, *Corticium graminearum*;

[00216] espécies de *Fusarium*, tal como, por exemplo, *Fusarium oxysporum*;

[00217] espécies de *Gaeumannomyces*, tal como, por exemplo, *Gaeumannomyces graminis*;

[00218] espécies de *Rhizoctonia*, tal como, por exemplo, *Rhizoctonia solani*;

[00219] espécies de *Tapesia*, tal como, por exemplo, *Tapesia aciformis*;

[00220] espécies de *Thielaviopsis*, tal como, por exemplo, *Thielaviopsis basicola*;

[00221] doenças da espiga e panícula (inclusive espigas de milho) causadas, por exemplo, por

[00222] espécies de *Alternaria*, tal como, por exemplo, *Alternaria* spp.;

[00223] espécies de *Aspergillus*, tal como, por exemplo, *Aspergillus flavus*;

[00224] espécies de *Cladosporium*, tal como, por exemplo, *Cladosporium cladosporioides*;

[00225] espécies de *Claviceps*, tal como, por exemplo, *Claviceps*

purpurea;

[00226] espécies de *Fusarium*, tal como, por exemplo, *Fusarium culmorum*;

[00227] espécies de *Gibberella*, tal como, por exemplo, *Gibberella zeae*;

[00228] espécies de *Monographella*, tal como, por exemplo, *Monographella nivalis*;

[00229] doenças causadas por ustilaginos, tais como, por exemplo,

[00230] espécies de *Sphacelotheca*, tal como, por exemplo, *Sphacelotheca reiliana*; espécies de *Tilletia*, tal como, por exemplo, *Tilletia caries*;

[00231] espécies de *Urocystis*, tal como, por exemplo, *Urocystis occulta*;

[00232] espécies de *Ustilago*, tal como, por exemplo, *Ustilago nuda*;

[00233] podridão dos frutos causada, por exemplo, por

[00234] espécies de *Aspergillus*, tal como, por exemplo, *Aspergillus flavus*;

[00235] espécies de *Botrytis*, tal como, por exemplo, *Botrytis cinerea*;

[00236] espécies de *Penicillium*, tal como, por exemplo, *Penicillium expansum* e *Penicillium purpurogenum*;

[00237] espécies de *Sclerotinia*, tal como, por exemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*;

[00238] espécies de *Verticillium*, tal como, por exemplo, *Verticillium alboatrum*;

[00239] podridões e murchamentos das sementes e as próprias do solo, bem como doenças das plântulas, causadas, por exemplo, por

[00240] espécies de *Alternaria*, tal como, por exemplo, *Alternaria brassicicola*

[00241] espécies de *Aphanomyces*, tal como, por exemplo, *Apha-*

nomycetes euteiches

[00242] espécies de Ascochyta, tal como, por exemplo, Ascochyta lentis

[00243] espécies de Aspergillus, tal como, por exemplo, Aspergillus flavus

[00244] espécies de Cladosporium, tal como, por exemplo, Cladosporium herbarum

[00245] espécies de Cochliobolus, tal como, por exemplo, Cochliobolus sativus

[00246] (forma de conídias: Drechslera, Bipolaris, sinônimo: Helminthosporium);

[00247] espécies de Colletotrichum, tal como, por exemplo, Colletotrichum coccodes;

[00248] espécies de Fusarium, tal como, por exemplo, Fusarium culmorum;

[00249] espécies de Gibberella, tal como, por exemplo, Gibberella zeae;

[00250] espécies de Macrophomina, tal como, por exemplo, Macrophomina phaseolina

[00251] espécies de Monographella, tal como, por exemplo, Monographella nivalis;

[00252] espécies de Penicillium, tal como, por exemplo, Penicillium expansum

[00253] espécies de Phoma, tal como, por exemplo, Phoma lingam

[00254] espécies de Phomopsis, tal como, por exemplo, Phomopsis sojae;

[00255] espécies de Phytophthora, tal como, por exemplo, Phytophthora cactorum;

[00256] espécies de Pyrenophora, tal como, por exemplo, Pyrenophora graminea

- [00257] espécies de *Pyricularia*, tal como por exemplo, *Pyricularia oryzae*;
- [00258] espécies de *Pythium*, tal como, por exemplo, *Pythium ultimum*;
- [00259] espécies de *Rhizoctonia*, tal como, por exemplo, *Rhizoctonia solani*;
- [00260] espécies de *Rhizopus*, tal como, por exemplo, *Rhizopus oryzae*
- [00261] espécies de *Sclerotium*, tal como, por exemplo, *Sclerotium rolfsii*;
- [00262] espécies de *Septoria*, tal como, por exemplo, *Septoria nodorum*;
- [00263] espécies de *Typhula*, tal como, por exemplo, *Typhula incarnata*;
- [00264] espécies de *Verticillium*, tal como, por exemplo, *Verticillium dahliae*;
- [00265] doenças do câncer, vesículas e vassoura de bruxa, causadas, por exemplo, por espécies de *Nectria*, tal como, por exemplo, *Nectria galligena*;
- [00266] doenças de murchamentos causadas, por exemplo, por
- [00267] espécies de *Monilinia*, tal como, por exemplo, *Monilinia laxa*;
- [00268] deformações de folhas, flores e frutos, causadas, por exemplo, por
- [00269] espécies de *Taphrina*, tal como por exemplo, *Taphrina deformans*;
- [00270] doenças degenerativas de plantas lenhosas causadas, por exemplo, por espécies de *Esca*, tais como, por exemplo, *Phaeomonilia chlamydospora* e *Phaeoacremonium aleophilum* e *Fomitiporia mediterranea*;

- [00271] doenças de flores e sementes causadas, por exemplo, por
- [00272] espécies de *Botrytis*, tal como, por exemplo, *Botrytis cinerea*;
- [00273] doenças de tubérculos de plantas, causadas, por exemplo, por
- [00274] espécies de *Rhizoctonia*, tal como, por exemplo, *Rhizoctonia solani*;
- [00275] espécies de *Helminthosporium*, tal como, por exemplo, *Helminthosporium solani*;
- [00276] doenças, causadas por patógenos bacterianos, tais como, por exemplo,
- [00277] espécies de *Xanthomonas*, tal como, por exemplo, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
- [00278] espécies de *Pseudomonas*, tal como, por exemplo, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- [00279] espécies de *Erwinia*, tal como, por exemplo, *Erwinia amylovora*.
- [00280] As seguintes doenças de feijões de soja podem ser preferivelmente combatidas:
- [00281] doenças fúngicas nas folhas, caules, silíquas e sementes, causadas, por exemplo, por
- [00282] mancha de alternaria (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), anthracnose (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), mancha marrom (*Septoria glycines*), mancha e pinta de cercospora (*Cercospora kikuchii*), pinta de choanephora (*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.)), mancha de dactuliophora (*Dactuliophora glycines*), míldio da soja (*Peronospora manshurica*), pontos da drechslera (*Drechslera glycini*), manchas olho-de-rã frogeye (*Cercospora sojina*), mancha de leptosphaerulina (*Leptosphaerulina trifolii*), mancha de phyllosticta (*Phyllosticta sojaecola*), pontos na vagem e no caule (Pho-

mopsis sojae), "powdery mildew" (*Microsphaera diffusa*), manchas de pyrenochaeta (*Pyrenochaeta glycines*), pontos de rhizoctonia aérea, foliada e de rede (*Rhizoctonia solani*), rolor (*Phakopsora pachyrhizi*), crosta (*Sphaceloma glycines*), pontos de stemphylium (*Stemphylium botryosum*), mancha tipo alvo (*Corynespora cassiicola*).

[00283] Doenças fúngicas nas raízes e da base do caule causadas, por exemplo, por podridão negra de raiz (*Calonectria crotalariae*), podridão de carvão (*Macrophomina phaseolina*), ferrugem ou apodrecimento por fusarium, podridão de raiz e podridão de vagem e bravadeira (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), podridão de raiz de mycoleptodiscus (*Mycoleptodiscus terrestris*), neocosmospora (*Neocosmopora vasinfecta*), pontos na vagem e caule (*Diaporthe phaseolorum*), cancro no caule (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), podridão de phytophthora (*Phytophthora megasperma*), podridão marrom de caule brown stem rot (*Phialophora gregata*), podridão de pythium (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotylum*, *Pythium ultimum*), podridão de raiz de rhizoctonia, decaimento de caule e tombamento (*Rhizoctonia solani*), decaimento de caule de sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), murcha de sclerotinia (*Sclerotinia rolfii*), podridão de raiz de thielaviopsis (*Thielaviopsis basicola*).

[00284] As substâncias ativas de acordo com a invenção, também apresentam um potente efeito de reforço nas plantas. Por conseguinte, elas são adequadas para a mobilização de forças de defesa próprias da planta contra o ataque por micro-organismos indesejados.

[00285] Por substâncias de reforço das plantas (indutoras de resistência) entendem-se no presente contexto, aquelas substâncias, que estão em condição, de estimular o sistema de defesa de plantas de maneira tal que, na subsequente inoculação com micro-organismos indesejados, as plantas tratadas desenvolvem ampla resistência con-

tra esses micro-organismos.

[00286] No presente caso, entendem-se por micro-organismos indesejados os fungos fitopatogênicos, bactérias e vírus. Portanto, as substâncias de acordo com a invenção, podem ser aplicadas, para proteger plantas contra o ataque pelos patógenos mencionados acima dentro de um certo espaço de tempo após o tratamento. O espaço de tempo, dentro do qual sua proteção é realizada, estende-se geralmente de 1 a 10 dias, preferivelmente de 1 a 7 dias após o tratamento das plantas com as substâncias ativas.

[00287] A boa compatibilidade das substâncias ativas pelas plantas nas concentrações necessárias para o combate de doenças de plantas, permite um tratamento das partes aéreas das plantas, do material de propagação vegetativo e semente e do solo.

[00288] Nesse caso, as substâncias ativas de acordo com a invenção, podem ser aplicadas com êxito particularmente bom para combater doenças de cereais, tais como, por exemplo, contra espécies de Puccinia e de doenças no cultivo do vinho, frutas e vegetais, tais como, por exemplo, contra espécies de Botrytis, Venturia ou Alternaria.

[00289] As substâncias ativas de acordo com a invenção, também são adequadas para aumentar a produção da colheita. Além disso, elas têm um baixo grau de toxicidade e apresentam uma boa compatibilidade pelas plantas.

[00290] Eventualmente, as substâncias ativas de acordo com a invenção, podem ser usadas em certas concentrações e quantidades de aplicação também como herbicidas, para influenciar o crescimento das plantas, bem como para combater parasitos animais. Eventualmente, elas também podem ser aplicadas como produtos intermediários e pré-produtos para a síntese de outras substâncias ativas.

[00291] De acordo com a invenção, todas as plantas e partes das plantas podem ser tratadas. Neste caso, entendem-se por plantas, to-

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

[00292] O tratamento de acordo com a invenção, das plantas e partes das plantas com as substâncias ativas é efetuado diretamente ou pela ação sobre seu meio, habitat ou depósito conforme os métodos de tratamento convencionais, por exemplo, por imersão, pulverização, evaporação, nebulização, espalhamento, revestimento e no caso do material de crescimento, especialmente no caso da semente, além disso, através do revestimento de uma ou mais camadas.

Micotoxinas

[00293] Além disso, através do tratamento de acordo com a invenção, o teor da micotoxina no material colhido e nos alimentos e rações produzidos a partir dessa, pode ser reduzido. Particularmente, mas não exclusivamente, nesse caso, podem ser mencionadas as seguintes micotoxinas: deoxinivalenol (DON), nivalenol, 1,5-Ac-DON, 3-Ac-DON, toxina T2 e HT2, fumonisine, zearalenon, moniliformin, fusarin, diacetoxiscirpenol (DAS), beauvericina, enniatina, fusaroproliferina,

fusarenol, ocratoxinas, patulina, alcalóides do esporão do centeio e aflatoxinas, que podem ser causadas, por exemplo, pelos seguintes fungos: *Fusarium spec.*, tais como *Fusarium acuminatum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikoro*i, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminearum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsethiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides*, e outros e também por *Aspergillus spec.*, *Penicillium spec.*, *Claviceps purpurea*, *Stachybotrys spec.* e outros.

Proteção de materiais

[00294] Na proteção de materiais, as substâncias de acordo com a invenção, podem ser aplicadas para proteger materiais técnicos contra o ataque e destruição por micro-organismos indesejados.

[00295] No presente contexto, materiais técnicos são entendidos como sendo materiais não viventes, que foram preparados para o uso na tecnologia. Por exemplo, materiais técnicos, que devem ser protegidos pelas substâncias ativas de acordo com a invenção, contra a modificação microbiana ou destruição, são adesivos, colas, papel e papelão, têxteis, couro, madeira, pinturas e artigos de material plástico, lubrificantes refrigerantes e outros materiais, que podem ser atacados ou decompostos por micro-organismos. No âmbito dos materiais a serem protegidos, mencionam-se também partes de usinas, por exemplo, circuitos de água de refrigeração, que podem ser prejudicados pela multiplicação de micro-organismos. No âmbito da presente invenção, mencionam-se como materiais técnicos preferivelmente adesivos, colas, papéis e papelões, couro, madeira, pinturas, lubrificantes refrigerantes e fluidos transmissores de calor, de modo particularmente preferido, madeira.

[00296] Como micro-organismos, que podem provocar uma degradação ou modificação dos materiais técnicos, sejam mencionados, por

exemplo, bactérias, fungos, leveduras, algas e organismos mucosos. Preferivelmente, as substâncias ativas de acordo com a invenção, atuam contra fungos, especialmente fungos do mofo, fungos que descoram madeira ou destroem madeira (basidiomicetos), bem como contra organismos mucosos e algas.

[00297] Sejam mencionados, por exemplo, micro-organismos dos seguintes gêneros:

- [00298] Alternaria, tal como Alternaria tenuis,
- [00299] Aspergillus, tal como Aspergillus niger,
- [00300] Chaetomium, tal como Chaetomium globosum,
- [00301] Coniophora, tal como Coniophora puetana,
- [00302] Lentinus, tal como Lentinus tigrinus,
- [00303] Penicillium, tal como Penicillium glaucum,
- [00304] Polyporus, tal como Polyporus versicolor,
- [00305] Aureobasidium, tal como Aureobasidium pullulans,
- [00306] Sclerophoma, tal como Sclerophoma pityophila,
- [00307] Trichoderma, tal como Trichoderma viride,
- [00308] Escherichia, tal como Escherichia coli,
- [00309] Pseudomonas, tal como Pseudomonas aeruginosa,
- [00310] Staphylococcus, tal como Staphylococcus aureus.

Formulações

[00311] A presente invenção refere-se a uma composição para combater micro-organismos indesejados, compreendendo pelo menos uma das fenoxiamidinas de acordo com a invenção.

[00312] Para esse fim, as fenoxiamidinas de acordo com a invenção, dependendo de suas respectivas propriedades físicas e/ou químicas, podem ser convertidas para as formulações convencionais, tais como soluções, emulsões, suspensões, pós, espumas, pastas, granulados, aerossóis, encapsulamentos finíssimos em substâncias poliméricas e em massas de revestimento para semente, bem como formula-

ções de névoa fria e morna em volume ultrabaixo.

[00313] Essas formulações são preparadas de maneira conhecida, por exemplo, misturando as substâncias ativas com diluentes, isto é, solventes líquidos, gases liquefeitos sob pressão e/ou veículos sólidos, eventualmente com o uso de agentes tensoativos, isto é, emulsificantes e/ou agentes de dispersão e/ou agentes produtores de espuma. No caso da utilização de água como diluente, por exemplo, solventes orgânicos também podem ser utilizados como solventes auxiliares. Como solventes líquidos interessam essencialmente: compostos aromáticos, tais como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, compostos aromáticos clorados ou hidrocarbonetos alifáticos clorados, tais como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno, hidrocarbonetos alifáticos, tais como ciclo-hexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, álcoois, tais como butanol ou glicol, bem como seus éteres e ésteres, cetonas, tais como acetona, metiletilcetona, metilisobutircetona ou ciclo-hexanona, solventes fortemente polares, tais como dimetilformamida e dimetilsulfóxido, bem como água. Diluentes ou veículos gasosos liquefeitos são aqueles líquidos, que são gasosos a temperatura normal e sob pressão normal, por exemplo, gases propulsores de aerosol, tais como hidrocarbonetos halogenados, bem como butano, propano, nitrogênio e dióxido de carbono. Como veículos sólidos são interessantes: por exemplo, pós de pedras naturais, tais como caulim, argilas, talco, giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terra de infusórios e pós de pedras sintéticas, tais como ácido silícico altamente disperso, óxido de alumínio e silicatos. Como veículos sólidos para granulados são interessantes: por exemplo, pedras naturais quebradas e fracionadas, tais como calcita, pedra-pomes, mármore, sepiolita, dolomita bem como granulados sintéticos de farinhas inorgânicas e orgânicas, bem como granulados de material orgânico, tais como serra-gem, cascas de coco, espigas de milho e talos de tabaco. Como emul-

sificantes e/ou agentes produtores de espuma são interessantes: por exemplo, emulsificantes não-ionogênicos e aniônicos, tais como éster de ácido polioxietileno-graxo, éter de álcool polietileno-graxo, por exemplo, éter alquilaril-poliglicólico, sulfonatos de alquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de arila bem como hidrolisados de albumina. Como agentes de dispersão são interessantes: por exemplo, lixívia residual de lignina e metilcelulose.

[00314] Nas formulações podem ser usados adesivos, tais como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos, pulverizados, granulados ou em forma de látex, tais como goma arábica, álcool polivinílico, acetato de polivinila, bem como fosfolípidos naturais, tais como cefalinas e lecitinas e fosfolípidos sintéticos. Outros aditivos podem ser óleos minerais e vegetais.

[00315] É possível usar corantes, tais como pigmentos inorgânicos, por exemplo, óxido de ferro, óxido de titânio, azul de ferrociano e corantes orgânicos, tais como corantes de alizarina, azocorantes e de ftalocianina metálicos e oligonutrientes, tais como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

[00316] Em geral, as formulações contêm entre 0,1 e 95% em peso, de substância ativa, preferivelmente entre 0,5 e 90%.

[00317] As formulações descritas acima podem ser usadas em um processo de acordo com a invenção, para combater micro-organismos indesejados, no qual as fenoxiamidinas de acordo com a invenção, são aplicadas sobre os micro-organismos e/ou no seu habitat.

Tratamento da semente

[00318] O combate de fungos fitopatogênicos através do tratamento da semente de plantas é conhecido há muito tempo e é objeto de constantes aperfeiçoamentos. Contudo, no tratamento da semente há uma série de problemas, que nem sempre podem ser satisfatoriamente resolvidos. Dessa maneira, é desejável, desenvolver processos para

proteger a semente e as plantas em germinação, que dispensam ou, pelo menos, reduzem nitidamente a aplicação adicional de preparados para proteger plantas após a semeadura ou após a emergência das plantas. Além disso, é desejável, otimizar a quantidade da substância ativa aplicada de forma tal, que a semente e a planta em germinação seja protegida da melhor maneira possível contra o ataque por fungos fitopatogênicos, sem, contudo, prejudicar a própria planta através da substância ativa aplicada. De modo especial, os processos para o tratamento da semente também deveriam incluir as propriedades fungicidas intrínsecas de plantas transgênicas, para obter uma ótima proteção da semente e da planta em germinação com um gasto mínimo de preparados para proteger plantas.

[00319] Por conseguinte, a presente invenção refere-se especialmente também a um processo para proteger a semente e as plantas em germinação contra o ataque de fungos fitopatogênicos, em que a semente é tratada com uma composição de acordo com a invenção.

[00320] A invenção refere-se, do mesmo modo, ao uso das composições de acordo com a invenção, para o tratamento da semente para proteger a semente e a planta em germinação contra fungos fitopatogênicos.

[00321] Além disso, a invenção refere-se à semente que, para a proteção contra fungos fitopatogênicos, foi tratada com uma composição de acordo com a invenção.

[00322] Uma das vantagens da presente invenção é que, com base nas propriedades sistêmicas particulares das composições de acordo com a invenção, o tratamento da semente com essas composições não protege somente a própria semente contra fungos fitopatogênicos, mas sim, também as plantas nascidas dessas após a emergência. Dessa maneira, o tratamento imediato da cultura pode ser dispensado no momento da semeadura ou pouco depois.

[00323] Do mesmo modo, deve ser considerado como sendo vantajoso, que as misturas de acordo com a invenção, podem ser aplicadas especialmente também na semente transgênica.

[00324] As composições de acordo com a invenção, são adequadas para proteger a semente de qualquer espécie de planta, que é usada na agricultura, na estufa, em florestas ou na horticultura. Nesse caso, trata-se especialmente de semente de cereais (tais como trigo, cevada, centeio, painço e aveia), milho, algodão, soja, arroz, batatas, girassol, feijão, café, nabo (por exemplo, beterraba e beterraba-sacarina), amendoim, legumes (tais como tomate, pepino, cebolas e salada), grama e plantas ornamentais. O tratamento da semente de cereais (tais como trigo, cevada, centeio e aveia), milho e arroz é de particular importância.

[00325] No âmbito da presente invenção, a composição de acordo com a invenção, é aplicada na semente sozinha ou em uma formulação adequada. Preferivelmente, a semente é tratada em um estado, no qual é tão estável, que não ocorrem quaisquer danos no tratamento. Em geral, o tratamento da semente pode ser efetuado em qualquer momento entre a colheita e a semeadura. Normalmente, utiliza-se semente, que foi separada da planta e libertada de tubérculos, cascas, caules, invólucro, lã ou polpa. Dessa maneira, por exemplo, é possível usar semente, que foi colhida, limpa e secada até um teor de umidade inferior a 15% em peso. Alternativamente, também pode ser usada semente, que após a secagem foi tratada, por exemplo, com água e depois novamente secada.

[00326] Em geral, quando a semente é tratada, deve-se observar, para que a quantidade da composição de acordo com a invenção e/ou outras substâncias aditivas aplicadas na semente seja selecionada de maneira tal, que a germinação da semente não seja prejudicada ou a planta nascida desta não seja prejudicada. Isso deve ser observado

principalmente nas substâncias ativas, que podem mostrar efeitos fitotóxicos em certas quantidades de aplicação.

[00327] As composições de acordo com a invenção, podem ser diretamente aplicadas, isto é, sem conter outros componentes e sem terem sido diluídas. Em geral, é preferível aplicar as composições na semente em forma de uma formulação adequada. Formulações adequadas e processos para o tratamento da semente são conhecidos pelo técnico e são descritos, por exemplo, nos seguintes documentos: US 4.272.417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430 A, US 5.876.739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

[00328] As combinações de substâncias ativas utilizáveis de acordo com a invenção, podem ser convertidas para as formulações desinfetantes convencionais, tais como soluções, emulsões, suspensões, pós, espumas, misturas ou outras massas de revestimento para semente, bem com formulações de volume ultrabaixo.

[00329] Essas formulações são preparadas de maneira conhecida, em que as substâncias ativas ou as combinações de substâncias ativas são misturadas com substâncias aditivas convencionais, tais como, por exemplo, diluentes convencionais, bem como solventes ou diluentes, corantes, umectantes, agentes de dispersão, emulsificantes, desespumantes, conservantes, espessantes secundários, colas, giberelinas e também água.

[00330] Como corantes, que podem estar contidos nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, são interessantes todos os corantes convencionais para tais finalidades. Nesse caso, podem ser usados tanto pigmentos pouco solúveis em água, como também corantes solúveis em água. Como exemplos, sejam citados os corantes conhecidos pelas denominações Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 e C.I. Solvent Red 1.

[00331] Como umectantes, que podem estar contidos nas formula-

ções desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, são interessantes todas as substâncias convencionais para a formulação de substâncias ativas agroquímicas, que promovem a umidificação. Preferivelmente, podem ser usados sulfonatos de alquilnaftaleno, tais como sulfonatos de di-isopropil- ou di-isobutil-naftaleno.

[00332] Como agentes de dispersão e/ou emulsificantes, que podem estar contidos nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, são interessantes todos os agentes de dispersão não-iônicos, aniônicos e catiônicos convencionais para a formulação de substâncias ativas agroquímicas. Preferivelmente, podem ser usados agentes de dispersão não-iônicos ou aniônicos ou misturas de agentes de dispersão não-iônicos ou aniônicos. Como agentes de dispersão não-iônicos adequados mencionam-se especialmente os polímeros por blocos de óxido de etileno-óxido de propileno, éter alquilfenolpoliglicólico, bem como éter triestirilfenolpoliglicólico e seus derivados fosfatados ou sulfatados. Agentes de dispersão aniônicos adequados são especialmente sulfonatos de lignina, sais de ácido poliacrílico e condensados de arilsulfonato-formaldeído.

[00333] Como desespumantes nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, podem estar contidas todas as substâncias inibidoras de espuma convencionais para a formulação de substâncias ativas agroquímicas. Preferivelmente, são utilizáveis desespumantes de silicone e estearato de magnésio.

[00334] Como conservantes nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, podem estar presentes todas as substâncias aplicáveis para tais finalidades em composições agroquímicas. São mencionados, por exemplo, diclorofeno e hemiformal de álcool benzílico.

[00335] Como espessantes secundários, que podem estar contidos nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção,

são interessantes todas as substâncias aplicáveis para tais finalidades em composições agroquímicas. Preferivelmente, interessam derivados de celulose, derivados de ácido acrílico, xantana, argila modificada e ácido silícico altamente disperso.

[00336] Como colas, que podem estar contidas nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, são interessantes todos os adesivos convencionais aplicáveis em desinfetantes. Preferivelmente, sejam mencionados polivinilpirrolidona, acetato de polivinila, álcool polivinílico e tilose.

[00337] Como giberelinas, que podem estar contidas nas formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, interessam preferivelmente as geberelinas A1, A3 (= ácido giberelínico), A4 e A7, o ácido giberelínico é usado de modo particularmente preferido. As giberelinas são conhecidas (compare R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", Vol. 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

[00338] As formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção, podem ser aplicadas ou diretamente ou após prévia diluição com água para o tratamento da semente da mais variada natureza. Dessa maneira, os concentrados ou as preparações que podem ser obtidas desses através de diluição com água, podem ser aplicados para a desinfecção da semente de cereais, tais como trigo, cevada, centeio, aveia e tritcale, bem como da semente de milho, arroz, colza, ervilhas, feijões, algodão, girassol e nabos ou também da semente de legumes da mais variada natureza. As formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção ou suas preparações diluídas também podem ser aplicadas para desinfetar a semente de plantas transgênicas. Nesse caso, na interação com as substâncias formadas através de expressão, também podem ocorrer efeitos sinérgicos adicionais.

[00339] Para o tratamento da semente com as formulações desinfetantes utilizáveis de acordo com a invenção ou das preparações preparadas dessas através da adição de água, interessam todos os equipamentos de mistura convencionalmente aplicáveis para a desinfecção. Na desinfecção, é possível proceder individualmente de maneira tal, que a semente é colocada em um misturador, a quantidade de formulações desinfetantes desejada em cada caso é acrescentada ou como tal ou após prévia diluição com água e misturada até a distribuição homogênea da formulação na semente. Eventualmente, segue-se um procedimento de secagem.

[00340] A quantidade de aplicação das formulações desinfetantes aplicáveis de acordo com a invenção, pode variar dentro de um limite maior. Ela varia de acordo com o respectivo teor das substâncias ativas nas formulações e de acordo com a semente. As quantidades de aplicação da combinação de substância ativa, encontram-se geralmente entre 0,001 e 50 g por quilograma de semente, preferivelmente entre 0,01 e 15 g por quilograma de semente.

Mistura com fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas ou inseticidas conhecidos

[00341] As fenoxiamidinas de acordo com a invenção, podem ser usadas como tais ou em suas formulações também em mistura com fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas ou inseticidas conhecidos para, dessa maneira, por exemplo, ampliar o espectro de ação ou prevenir desenvolvimentos de resistências.

[00342] É possível, também, uma mistura com outras substâncias ativas conhecidas, tais como herbicidas ou com adubos e reguladores de crescimento, protetores ou semiquímicos.

[00343] Além disso, os compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção, também apresentam efeitos antimicóticos muito bons. Eles possuem um espectro de ação antimicótico muito amplo, especialmen-

te contra dermatófitos e leveduras, mofo e fungos difásicos (por exemplo, contra espécies de *Candida*, tais como *Candida albicans*, *Candida glabrata*), bem como *Epidermophyton floccosum*, espécies de *Aspergillus*, tais como *Aspergillus niger* e *Aspergillus fumigatus*, espécies de *Trichophyton*, tal como *Trichophyton mentagrophytes*, espécies de *Microsporon*, tais como *Microsporon canis* e *audouinii*. A enumeração desses fungos não representa de modo algum uma restrição do espectro micótico abrangível, mas sim, tem apenas caráter elucidatório.

[00344] As substâncias ativas podem ser aplicadas como tais, na forma de suas formulações ou nas formas de aplicação preparadas a partir dessas, tais como soluções prontas para o uso, suspensões, pós de pulverização, pastas, pós solúveis, pós de polvilhamento e granulados. A aplicação ocorre de maneira convencional, por exemplo, através de rega, pulverização, atomização, espalhamento, polvilhamento, espumação, revestimento e outros. Além disso, é possível aplicar as substâncias ativas pelo processo de volume ultrabaixo ou injetar a preparação da substância ativa ou a própria substância ativa no solo.

[00345] A semente das plantas também pode ser tratada.

[00346] Ao aplicar as fenoxiamidinas de acordo com a invenção, como fungicidas, as quantidades de aplicação, dependendo do modo de aplicação, podem variar dentro de um limite maior. No tratamento de partes de plantas, as quantidades de aplicação de substância ativa são geralmente entre 0,1 e 10.000 g/ha, preferivelmente entre 10 e 1.000 g/ha. No tratamento da semente, as quantidades de aplicação de substância ativa são geralmente entre 0,001 e 50 g por quilograma de semente, preferivelmente entre 0,01 e 10 g por quilograma de semente. No tratamento do solo, as quantidades de aplicação de substância ativa são geralmente entre 0,1 e 10.000 g/ha, preferivelmente entre 1 e 5.000 g/ha.

GMO's

[00347] O processo de tratamento de acordo com a invenção, pode ser usado para o tratamento de organismos geneticamente modificados (GMOs), por exemplo, plantas ou sementes. Plantas geneticamente modificadas (ou plantas transgênicas) são plantas, nas quais um gene heterólogo foi estavelmente integrado no genoma. O termo "gene heterólogo" significa essencialmente um gene, que é preparado ou ensamblado fora da planta e dessa maneira, ao ser introduzido no genoma do núcleo da célula, no genoma do cloroplasto ou no genoma da hipocôndria da planta transformada, empresta propriedades agronômicas novas ou aperfeiçoadas ou outras, que ele exprime uma proteína ou polipeptídeo interessante ou que ele regula para baixo ou desliga um outro gene, que está presente na planta ou outros genes, que estão presentes na planta (por exemplo, por meio da tecnologia antissentido, tecnologia de cossupressão ou tecnologia RNAi [RNA Interference]). Um gene heterólogo, que está presente no genoma, também é designado como transgene. Um transgene, que é definido por sua presença específica no genoma da planta, é designado como evento de transformação ou transgênico.

[00348] Dependendo das espécies de plantas ou das plantas cultivadas, do seu local e das condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, nutrição), o tratamento de acordo com a invenção, também pode levar a efeitos superaditivos ("sinérgicos"). Dessa maneira, por exemplo, são possíveis os seguintes efeitos, que excedem os efeitos propriamente esperados: baixas quantidades de aplicação e/ou espectro de ação ampliado e/ou maior eficácia das substâncias ativas e composições, que podem ser aplicadas de acordo com a invenção, melhor crescimento da planta, tolerância aumentada contra seca ou teor de água ou sal no solo, poder de florescência aumentado, facilitação da colheita, aceleração do amadurecimento, maior produção, frutos maiores, maior altura da planta, cor verde mais intensa

da folha, floração mais precoce, maior qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior concentração de açúcar nos frutos, melhor poder de armazenagem e/ou processabilidade dos produtos colhidos.

[00349] Em certas quantidades de aplicação, as combinações de substâncias ativas de acordo com a invenção, também podem exercer um efeito de reforço sobre plantas. Por conseguinte, elas são adequadas para a mobilização do sistema de defesa vegetal contra o ataque por fungos fitopatogênicos indesejados e/ou micro-organismos e/ou vírus. Esse pode ser eventualmente um dos motivos para a eficácia aumentada das combinações de acordo com a invenção, por exemplo, contra fungos. Substâncias que reforçam as plantas (indutoras de resistência) devem significar, no presente contexto, também aquelas substâncias ou combinações de substâncias, que são capazes de estimular o sistema de defesa vegetal de forma tal, que as plantas tratadas, quando elas são inoculadas, em seguida, com fungos fitopatogênicos e/ou micro-organismos e/ou vírus indesejados, apresentam um grau de resistência considerável contra esses fungos fitopatogênicos e/ou micro-organismos e/ou vírus indesejados. No presente caso, entendem-se por fungos fitopatogênicos e/ou micro-organismos e/ou vírus indesejados, os fungos fitopatogênicos, bactérias e vírus. Por conseguinte, as substâncias de acordo com a invenção, podem ser aplicadas para a proteção das plantas contra o ataque pelos patógenos mencionados dentro de um certo espaço de tempo após o tratamento. O espaço de tempo, através do qual é obtido um efeito de proteção, estende-se geralmente de 1 a 10 dias, preferivelmente 1 a 7 dias, após o tratamento das plantas com as substâncias ativas.

[00350] Às plantas e espécies de plantas, que são preferivelmente tratadas de acordo com a invenção, incluem-se todas as plantas, que dispõem de genoma, que confere características úteis, particularmente

vantajosas a essas plantas (é indiferente, se isso foi obtido através de cultivo e/ou biotecnologia).

[00351] Plantas e espécies de plantas, que também são preferivelmente tratadas de acordo com a invenção, são resistentes a um ou mais fatores bióticos de estresse, isto é, essas plantas apresentam uma melhor defesa contra parasitos animais e microbianos, tais como nematódios, insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e vírus e/ou viroides.

[00352] Plantas e espécies de plantas, que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, são aquelas plantas, que são resistentes a um ou mais fatores abióticos de estresse. As condições abióticas de estresse incluem, por exemplo, seca, condições de frio e calor, estresse osmótico, umidade do nível de retenção, teor de sal do solo aumentado, exposição aumentada aos minerais, condições de ozônio, condições de luz forte, disponibilidade limitada de nutrientes de nitrogênio, disponibilidade limitada de nutrientes de fósforo ou falta de sombra.

[00353] Plantas e espécies de plantas, que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, são aquelas plantas, que são caracterizadas por propriedades de rendimento aumentadas. Um rendimento aumentado nessas plantas pode ser baseado, por exemplo, na melhor fisiologia da planta, no melhor crescimento da planta e melhor desenvolvimento da planta, tais como eficiência do aproveitamento da água, eficiência de retenção de água, melhor aproveitamento do nitrogênio, assimilação de carbono aumentada, melhor fotossíntese, força de germinação reforçada e amadurecimento acelerado. Além disso, o rendimento pode ser influenciado por uma melhor arquitetura da planta (em condições de estresse e não estresse), entre essas, a floração prematura, controle da floração para a produção de semente híbrida, poder de crescimento da planta germinada, tamanho da planta, núme-

ro e distância dos entrenós, crescimento da raiz, tamanho da semente, tamanho dos frutos, tamanho da siliqua, número de síliquas ou espigas, número de sementes por siliqua ou espiga, massa da semente, enchimento reforçado da semente, perda de semente reduzida, estouro de síliquas reduzido, bem como estabilidade. Outras características de rendimento incluem composição da semente, tal como teor de carboidratos, teor de proteína, teor de óleo e composição do óleo, valor nutritivo, redução dos compostos adversos aos alimentos, processabilidade aperfeiçoada e capacidade de armazenamento aperfeiçoada.

[00354] Plantas, que podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas híbridas, que já exprimem as propriedades da heterose ou do efeito híbrido, que resulta geralmente em um maior rendimento, maior capacidade de crescimento, melhor saúde e melhor resistência contra fatores bióticos e abióticos de estresse. Tais plantas são tipicamente produzidas pelo fato, de cruzar uma linha de pais de polens estéreis endocruzados (os parentes femininos) com uma outra linha de pais de polens férteis endocruzados (o parente masculino). A semente híbrida é tipicamente colhida das plantas de polens estéreis e vendida a cultivadores. Plantas de polens estéreis podem ser produzidas, às vezes (por exemplo, no milho), através de despendoamento (isto é, remoção mecânica dos órgãos sexuais masculinos ou das flores masculinas); contudo, é usual, que a esterilidade dos polens se baseie nos determinantes genéticos no genoma da planta. Nesse caso, especialmente quando no caso do produto desejado, visto que se deseja colher das plantas híbridas, se trata das sementes, é normalmente favorável assegurar, que a fertilidade dos polens nas plantas híbridas, que contêm os determinantes genéticos responsáveis pela esterilidade dos polens, seja inteiramente restaurada. Isso pode ser obtido, assegurando, que os parentes masculinos possuem genes de restauração de fertilidade apropriados, que estão em condição, de restaurar a fertili-

dade dos polens em plantas híbridas, que contêm os determinantes genéticos, que são responsáveis pela esterilidade dos polens. Determinantes genéticos para a esterilidade dos polens podem estar localizados no citoplasma. Exemplos de esterilidade citoplasmática de polens (CMS) são descritos, por exemplo, para espécies de Brassica (WO 1992/005251, WO 1995/009910, WO 1998/27806, WO 2005/002324, WO 2006/021972 e US 6.229.072). Contudo, os determinantes genéticos para esterilidade de polens também podem estar localizados no genoma do núcleo celular. Plantas de polens estéreis também podem ser obtidas com métodos da biotecnologia vegetal, tal como engenharia genética. Um meio particularmente favorável para a produção de plantas de polens estéreis é descrito na WO 89/10396, na qual, por exemplo, uma ribonuclease, tal como uma barnase, é expressa seletivamente nas células de tapetum nos estames. A fertilidade pode ser restaurada, então, através da expressão nas células de tapetum de um inibidor de ribonuclease, tal como barstar (por exemplo, WO 1991/002069).

[00355] Plantas ou espécies de plantas (que são obtidas com métodos da biotecnologia de plantas, tal como a engenharia genética), que podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas tolerantes aos herbicidas, isto é, plantas, que foram tornadas tolerantes em relação a um ou mais herbicidas dados. Tais plantas podem ser obtidas ou através de transformação genética ou através da seleção de plantas, que contêm uma mutação, que confere uma tal tolerância aos herbicidas.

[00356] Plantas tolerantes aos herbicidas são, por exemplo, plantas tolerantes ao glifosato, isto é, plantas, que foram tornadas tolerantes ao herbicida glifosato ou aos seus sais. Dessa maneira, por exemplo, as plantas tolerantes ao glifosato podem ser obtidas através da transformação da planta com um gene, que codifica a enzima 5-

enolpiruvilshikimat-3-fosfato sintase (EPSPS). Exemplos desses genes EPSPS são o gene AroA (mutante CT7) da bactéria *Salmonella typhimurium* (Comai e colaboradores, *Science* (1983), 221, 370-371), o gene CP4 da bactéria *Agrobacterium* sp. (Barry e colaboradores, *Curr. Topics Plant Physiol.* (1992), 7, 139-145), os genes, que codificam uma EPSPS da petúnia (Shah e colaboradores, *Science* (1986), 233, 478-481), uma EPSPS do tomate (Gasser e colaboradores, *J. Biol. Chem.* (1988), 263, 4280-4289) ou uma EPSPS de eleusine (WO 2001/66704). Pode tratar-se também de uma EPSPS mutada, tal como descrito, por exemplo, na EP-A 0837944, WO 2000/066746, WO 2000/066747 ou WO 2002/026995. Plantas tolerantes ao glifosato também podem ser obtidas pelo fato, de exprimir um gene, que codifica uma enzima de glifosato-oxidorreductase, tal como descrito na US 5.776.760 e US 5.463.175. Plantas tolerantes ao glifosato também podem ser obtidas pelo fato, de exprimir um gene, que codifica uma enzima de glifosato-acetiltransferase, tal como é descrita, por exemplo, nas WO 2002/036782, WO 2003/092360, WO 2005/012515 e WO 2007/024782. Plantas tolerantes ao glifosato também podem ser obtidas pelo fato, de selecionar plantas contendo mutações que ocorrem naturalmente dos genes citados acima, tais como são descritas, por exemplo, na WO 2001/024615 ou WO 2003/013226.

[00357] Outras plantas resistentes aos herbicidas são, por exemplo, plantas, que são tornadas tolerantes aos herbicidas, que inibem a enzima glutamina sintase, tal como bialafos, fosfinotricina ou glufosinato. Tais plantas podem ser obtidas pelo fato, de exprimir uma enzima, que desintoxica o herbicida ou um mutante da enzima glutamina sintase, que é resistente contra inibição. Uma tal enzima desintoxicada eficaz é, por exemplo, uma enzima, que codifica uma fosfinotricina-acetiltransferase (tal como, por exemplo, a proteína bar ou pat de espécies de *Streptomyces*). Plantas, que exprimem uma fosfinotricina-acetiltransferase

exógena, são descritas, por exemplo, nas US 5.561.236; US 5.648.477; US 5.646.024; US 5.273.894; US 5.637.489; US 5.276.268; US 5.739.082; US 5.908.810 e US 7.112.665.

[00358] Outras plantas tolerantes aos herbicidas são também plantas, que foram tornadas tolerantes aos herbicidas, que inibem a enzima hidroxifenilpiruvato dioxigenase (HPPD). No caso das hidroxifenilpiruvato dioxigenases trata-se de enzimas, que catalisam a reação, na qual o para-hidroxifenilpiruvato (HPP) é reagido para formar o homogentisato. Plantas, que são tolerantes aos inibidores HPPD, podem ser transformadas com um gene, que codifica uma enzima HPPD resistente de origem natural ou com um gene, que codifica uma enzima HPPD mutada de acordo com as WO 1996/038567, WO 1999/024585 e WO 1999/024586. Uma tolerância aos inibidores HPPD também pode ser obtida pelo fato, de transformar plantas com genes, que codificam certas enzimas, que possibilitam a formação de homogentisato apesar da inibição da enzima HPPD nativa através do inibidor HPPD. Tais plantas e genes são descritos nas WO 1999/034008 e WO 2002/36787. A tolerância de plantas aos inibidores HPPD também pode ser aperfeiçoada pelo fato, de transformar plantas adicionalmente para um gene, que codifica uma enzima tolerante ao HPPD, com um gene, que codifica uma enzima prefenato desidrogenase, tal como descrita na WO 2004/024928.

[00359] Outras plantas resistentes aos herbicidas são plantas que são tornadas tolerantes aos inibidores de acetolactato sintase (ALS). Nos inibidores de ALS conhecidos incluem-se, por exemplo, sulfonilureia, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos e/ou herbicidas de sulfonilaminocarbonil triazolinona. Sabe-se, que diferentes mutações na enzima ALS (também conhecida como acetohidroxiácido sintase, AHAS) conferem uma tolerância em relação aos diferentes herbicidas ou grupos de herbicidas, tal como descrito, por exemplo, por Tranel e Wright, *Weed Science* (2002), 50, 700-712, con-

tudo, também nas US 5.605.011, US 5.378.824, US 5.141.870 e US 5.013.659. A produção de plantas tolerantes à sulfonilureia e plantas tolerantes à imidazolinona é descrita na US 5.605.011; US 5.013.659; US 5.141.870; US 5.767.361; US 5.731.180; US 5.304.732; US 4.761.373; US 5.331.107; US 5.928.937; e US 5.378.824; bem como na publicação internacional WO 1996/033270. Outras plantas tolerantes à imidazolinona são descritas também, por exemplo, na WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351 e WO 2006/060634. Outras plantas tolerantes à sulfonilureia e imidazolinona são descritas também, por exemplo, nas WO 2007/024782.

[00360] Outras plantas, que são tolerantes à imidazolinona e/ou à sulfonilureia, podem ser obtidas através de mutagênese induzida, seleção em culturas de células na presença do herbicida ou através de cultivo de mutação, tal como descrito, por exemplo, para soja na US 5.084.082, para arroz na WO 1997/41218, para a beterraba na US 5.773.702 e WO 1999/057965, para salada na US 5.198.599 ou para o girassol, na WO 2001/065922.

[00361] Plantas ou espécies de plantas (que são obtidas por métodos da biotecnologia vegetal, tal como a engenharia genética), que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas transgênicas resistentes aos insetos, isto é, plantas, que foram tornadas resistentes contra o ataque com certos insetos-alvo. Tais plantas podem ser obtidas através de transformação genética ou através da seleção de plantas, que contêm uma mutação, que confere uma tal resistência contra insetos.

[00362] O termo "planta transgênica resistente contra insetos" compreende, no presente contexto, qualquer planta, que contém pelo menos um transgene, que abrange uma sequência de codificação, que codifica o seguinte:

1) uma proteína cristalina inseticida de *Bacillus thuringiensis* ou uma parte inseticida do mesmo, tal como as proteínas cristalinas inseticidas, listadas por Crickmore e outros, *Microbiology and Molecular Biology Reviews* (1998), 62, 807-813, atualizada por Crickmore e outros (2005) na nomenclatura de toxinas de *Bacillus thuringiensis*, online em:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/) ou partes inseticidas da mesma, por exemplo, proteínas das classes de proteínas Cry Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae ou Cry3Bb ou partes inseticidas destas; ou

2) uma proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* ou uma parte do mesmo, que na presença de uma segunda, outra proteína cristalina, tem ação inseticida como *Bacillus thuringiensis* ou como uma parte do mesmo, tal como a toxina binária, que consiste nas proteínas cristalinas Cy34 e Cy35 (Moellenbeck e outros, *Nat. Biotechnol.* (2001), 19, 668-72; Schnepf e outros, *Applied Environm. Microb.* (2006), 71, 1765-1774); ou

3) uma proteína híbrida inseticida, que compreende partes de duas diferentes proteínas cristalinas inseticidas de *Bacillus thuringiensis*, tais como por exemplo, um híbrido das proteínas de 1) acima ou um híbrido das proteínas de 2) acima, por exemplo, a proteína Cry1A.105, que é produzida pelo evento de milho MON98034 (WO 2007/027777); ou

4) uma proteína de acordo com um dos pontos 1 a 3) acima, na qual alguns, especialmente a 1 a 10, aminoácidos foram substituídos por um outro aminoácido, para obter uma eficácia inseticida mais elevada em relação a uma espécie de insetos-alvo e/ou para ampliar o espectro das espécies de insetos-alvo correspondentes e/ou devido a modificações, que foram induzidas no DNA de codificação durante a clonagem ou transformação, tal como a proteína Cry3Bb1

em eventos de milho MON863 ou MON88017 ou a proteína Cry3A no evento de milho MIR 604;

5) uma proteína inseticida secretada de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus* ou uma parte inseticida do mesmo, tal como as proteínas inseticidas de ação vegetativa (vegetative insecticidal proteins, VIP), que são listadas em http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por exemplo, proteínas da classe de proteínas VIP3Aa; ou

6) uma proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus*, que tem ação inseticida na presença de uma segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus*, tal como a toxina binária, que consiste nas proteínas VIP1A e VIP2A (WO 1994/21795);

7) uma proteína híbrida inseticida, que compreende partes de diferentes proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus*, tal como um híbrido das proteínas de 1) ou um híbrido das proteínas de 2) acima; ou

8) uma proteína de acordo com um dos pontos 1) a 3) acima, na qual alguns, especialmente 1 a 10, aminoácidos foram substituídos por um outro aminoácido, para obter uma eficácia inseticida mais elevada em relação a uma espécie de inseto-alvo e/ou para ampliar o espectro das espécies de insetos-alvo correspondentes e/ou devido a modificações, que foram induzidas no DNA de codificação durante a clonagem ou transformação (em que a codificação permanece para uma proteína inseticida), tal como a proteína VIP3Aa no evento de algodão COT 102.

[00363] Naturalmente, as plantas transgênicas resistentes aos insetos no presente contexto, incluem também qualquer planta, que compreende uma combinação de genes, que codificam as proteínas de uma das classes 1 a 8 mencionadas acima. Em uma forma de concre-

tização, uma planta resistente aos insetos contém mais do que um transgene, que codifica uma proteína de acordo com uma das 1 a 8 mencionadas acima, para ampliar o espectro das espécies de insetos-alvo correspondentes ou para retardar o desenvolvimento de uma resistência dos insetos contra as plantas, pelo fato, de utilizar diferentes proteínas, que são inseticidas para a mesma espécie de insetos-alvo, contudo, apresentam um diferente modo de ação, tal como ligação a diferentes pontos de ligação do receptor no inseto.

[00364] Plantas ou espécies de plantas (que foram obtidas por métodos da biotecnologia vegetal, como a engenharia genética), que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, são tolerantes aos fatores abióticos de estresse. Tais plantas podem ser obtidas através da transformação genética ou através da seleção de plantas, que contêm uma mutação, que confere uma tal resistência contra estresse. Nas plantas particularmente úteis com tolerância ao estresse são incluídas as seguintes:

a. plantas, que contêm um transgene, que tem o poder de reduzir a expressão e/ou atividade do gene para a poli(ADP-ribose)polimerase (PARP) nas células de plantas ou plantas, tal como descrito na WO 2000/004173 ou EP 04077984.5 ou EP 06009836.5;

b. plantas, que contêm um transgene promotor de tolerância ao estresse, que tem o poder de reduzir a expressão e/ou atividade dos genes que codificam PARP das plantas ou células das plantas, tal como descrito, por exemplo, na WO 2004/090140;

c. plantas, que contêm um transgene promotor de tolerância ao estresse, que codifica uma enzima funcional em plantas da rota de biossíntese da nicotinamidadenindinucleotídeo-salvage, entre essas, a nicotinamidase, nicotinato fosforribosiltransferase, adeniltransferase de mononucleotídeo de ácido nicotínico, nicotinamidadenindinucleotídeo sintetase ou nicotinamidafosforribosiltransferase, tal como descrito, por

exemplo, na EP 04077624.7 ou WO 2006/133827 ou PCT/EP07/002433.

[00365] Plantas ou espécies de plantas (que foram obtidas por métodos da biotecnologia vegetal, tal como a engenharia genética), que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, apresentam uma quantidade, qualidade e/ou capacidade de armazenamento modificada do produto colhido e/ou propriedades modificadas de certos componentes do produto colhido, tais como, por exemplo:

1) plantas transgênicas, que sintetizam um amido modificado, que em relação as suas propriedades químico-físicas, especialmente do teor de amilose ou da proporção de amilose/amilopectina, ao grau de ramificação, ao comprimento médio de cadeia, à distribuição das cadeias laterais, ao comportamento da viscosidade, à resistência ao gel, ao tamanho do grão de amido e/ou à morfologia do grão de amido, é modificado em comparação com o amido sintetizado em células de plantas de tipo selvagem ou plantas de tipo selvagem, de modo que esse amido modificado é mais adequado para certas aplicações. Essas plantas transgênicas, que sintetizam um amido modificado, são descritas, por exemplo, na EP 0.571.427, WO 1995/004826, EP 0.719.338, WO 1996/15248, WO 1996/19581, WO 1996/27674, WO 1997/11188, WO 1997/26362, WO 1997/32985, WO 1997/42328, WO 1997/44472, WO 1997/45545, WO 1998/27212, WO 1998/40503, WO 99/58688, WO 1999/58690, WO 1999/58654, WO 2000/008184, WO 2000/008185, WO 2000/28052, WO 2000/77229, WO 2001/12782, WO 2001/12826, WO 2002/101059, WO 2003/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 2000/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 2002/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP

07090007.1, EP 07090009.7, WO 2001/14569, WO 2002/79410, WO 2003/33540, WO 2004/078983, WO 2001/19975, WO 1995/26407, WO 1996/34968, WO 1998/20145, WO 1999/12950, WO 1999/66050, WO 1999/53072, US 6.734.341, WO 2000/11192, WO 1998/22604, WO 1998/32326, WO 2001/98509, WO 2001/98509, WO 2005/002359, US 5.824.790, US 6.013.861, WO 1994/004693, WO 1994/009144, WO 1994/11520, WO 1995/35026 ou WO 1997/20936.

2) Plantas transgênicas, que sintetizam polímeros de carboidratos não-amido ou polímeros de carboidratos não-amido, cujas propriedades em comparação com plantas de tipo selvagem, são alteradas sem modificação genética. Exemplos são plantas, que produzem a polifrutose, especialmente do tipo da inulina e levan, tal como descrito nas EP 0.663.956, WO 1996/001904, WO 1996/021023, WO 1998/039460 e WO 1999/024593, plantas, que produzem o alfa-1,4-glucano, tal como descrito na WO 1995/031553, US 2002/031826, US 6.284.479, US 5.712.107, WO 1997/047806, WO 1997/047807, WO 1997/047808 e WO 2000/14249, plantas, que produzem alfa-1,4-glucanos ramificados com alfa-1,6, tal como descrito na WO 2000/73422 e plantas, que produzem alternan, tal como descrito na WO 2000/047727, EP 06077301.7, US 5.908.975 e EP 0728213.

3) Plantas transgênicas, que produzem hialuronan, tal como descrito, por exemplo, na WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006/304779 e WO 2005/012529.

[00366] Plantas ou espécies de plantas (que foram obtidas por métodos da biotecnologia vegetal, tal como a engenharia genética), que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas, tais como plantas de algodão com propriedades fibrosas alteradas. Tais plantas pode ser obtidas através de transformação genética ou através da seleção de plantas, que contêm uma mutação, que confere tais propriedades fibrosas alteradas; nessa incluem-se:

a) plantas, tais como plantas de algodão, que contêm uma forma alterada de genes da celulose sintase, tal como descrito na WO 1998/ 000549,

b) plantas, tais como plantas de algodão, que contêm uma forma alterada de ácidos nucleicos homólogos rsw2 ou rsw3, tal como descrito na WO 2004/053219;

c) plantas, tais como plantas de algodão com uma expressão aumentada da sacarose fosfato sintase, tal como descrito na WO 2001/ 017333;

d) plantas, tais como plantas de algodão com uma expressão aumentada da sacarose sintase, tal como descrito na WO 02/45485;

e) plantas, tais como plantas de algodão, nas quais o momento do controle de passagem dos plasmodemos é alterado na base da célula fibrosa, por exemplo, através da regulação para baixo da β -1,3-glucanase fibrosseletiva, tal como descrito na WO 2005/017157;

f) plantas, tais como plantas de algodão com fibras com reatividade alterada, por exemplo, através da expressão do gene de N-acetilglucosamina transferase, entre esses, também nodC e de genes da quitina sintase, tal como descrito na WO 2006/136351.

[00367] Plantas ou espécies de plantas (que foram obtidas por métodos da biotecnologia vegetal, tal como a engenharia genética), que também podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas, tais como colza ou plantas de Brassica afins com propriedades alteradas da composição de óleo. Tais plantas podem ser obtidas através de transformação genética ou através de seleção de plantas, que contêm uma mutação, que confere tais propriedades oleosas alteradas; nessas incluem-se:

a) plantas, tais como plantas de colza, que produzem óleo com um alto teor de ácido oleico, tal como descrito, por exemplo, na

US 5.969.169, US 5.840.946, ou US 6.323.392 ou US 6.063.947;

b) plantas, tais como plantas de colza, que produzem óleo com um baixo teor de ácido linolênico, tal como descrito na US 6.270.828, US 6.169.190 ou US 5.965.755;

c) plantas, tais como plantas de colza, que produzem óleo com um baixo teor de ácido graxo saturado, tal como descrito na US 5.434.283.

[00368] Plantas transgênicas particularmente úteis, que podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas com um ou mais genes, que codificam uma ou mais toxinas, são as plantas transgênicas, que são oferecidas sob as seguintes denominações comerciais: YIELD GARD® (por exemplo, milho, algodão, soja), KnockOut® (por exemplo, milho), Bite Gard® (por exemplo, milho), BT-Xtra® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), Nucotn® (algodão), Nucotn 33B® (algodão), NatureGard® (por exemplo, milho), Protecta® e NewLeaf® (batata). Plantas tolerantes aos herbicidas, que devem ser citadas, são por exemplo, espécies de milho, espécies de algodão e espécies de soja, que são oferecidas sob as seguintes denominações comerciais: Roundup Ready® (tolerância ao glifosato, por exemplo, milho, algodão, feijão), Liberty Link® (tolerância à fosfinotricina, por exemplo, colza), IMI® (tolerância à imidazolinona) e SCS® (tolerância à sulfonilureia), por exemplo, milho. Nas plantas resistentes aos herbicidas (plantas tradicionalmente cultivadas para tolerância aos herbicidas), que devem ser citadas, incluem-se as espécies oferecidas pela denominação Clearfield® (por exemplo, milho).

[00369] Plantas transgênicas particularmente úteis, que podem ser tratadas de acordo com a invenção, são plantas, que contêm eventos de transformação ou uma combinação de eventos de transformação e que são listadas, por exemplo, nos arquivos de diversas autoridades nacionais ou regionais (vide, por exemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browser.aspx e

<http://www.agbios.com/dbase.php>).

[00370] A preparação e o uso das substâncias ativas de acordo com a invenção, devem ser detalhadamente ilustrados com base nos seguintes exemplos, sem, contudo, estar restrito aos mesmos.

Exemplos de preparação

N-etil-N-metil-N'-[4-(3-*terc*butilfenóxi)-5-trifluormetil-2-metilfenil]formamidina

[00371] 150 mg (0,46 mmol) de 4-(3-*terc*butilfenóxi)-5-trifluormetil-2-metilanilina são dissolvidos em 10 ml de metanol e adicionados a 0,4 ml de uma solução de N-etil-N-metilformamid-dimetilacetal em metanol (60%). A mistura de reação é agitada a 45°C por 12 horas, em seguida, libertada do solvente no vácuo e purificada por meio de cromatografia de coluna. São obtidos 100 mg de produto (99,9% de pureza, 54,9% de rendimento; log P (pH 2,3) = 2,52).

[00372] Síntese dos compostos de partida:

4-bromo-3-(difluormetil)-2-metil-nitrobenzeno

[00373] A uma solução de 9,50 g (28,8 mmols, 74% de pureza GC-MS) de 2-bromo-4-metil-5-nitrobenzaldeído em 150 ml de diclorometano absoluto gotejaram-se cuidadosamente, a -30°C, 12,20 g de trifluoreto de dietilamino enxofre (75,7 mmols). A mistura de reação foi inicialmente agitada por 2 horas a -30°C e em seguida, reservada para aquecer à temperatura ambiente durante a noite.

[00374] A solução de reação foi cuidadosamente bruscamente resfriada com 5 ml de metanol, adicionada a 50 ml de água e extraída duas vezes com diclorometano. As fases orgânicas combinadas foram secadas e concentradas no evaporador rotativo. O resíduo foi cromatografado em um cartucho de sílica-gel (ciclo-hexano/éster etílico de ácido acético = 10:1).

[00375] Foram obtidos 8,0 g (22,2 mmols, 74% de pureza GC-MS, 77% da teoria) de 1-bromo-2-(difluormetil)-5-metil-4-nitrobenzeno co-

mo sólido.

2-bromo-4-metil-5-nitrobenzaldeído

[00376] A uma solução de 11,00 g (55,2 mmols) de 2-bromo-4-metilbenzaldeído em 65 ml de ácido sulfúrico (a 95%) gotejaram-se lentamente, a 5°C, 11 ml de ácido nítrico (a 68%). A temperatura de reação foi mantida abaixo de 15°C. Em seguida, a mistura de reação foi agitada a 15°C por uma hora e a seguir, colocada cuidadosamente em água gelada, filtrada e lavada com água. O sólido foi secado no alto vácuo. Foram obtidos 13,00 g (74% de pureza GC-MS, 39,4 mmols, 71% da teoria) de 2-bromo-4-metil-5-nitrobenzaldeído com o logP (HCOOH) = 2,61.

4-cloro-3-trifluormetil-2-metil-nitrobenzeno

[00377] 4,9 g (25,2 mmols) de 4-metil-2-cloro-benzotrifluoreto são previamente introduzidos em 10 ml de ácido sulfúrico concentrado, resfriados a 0°C e lentamente adicionados a uma mistura de 1,5 ml de ácido sulfúrico concentrado e 1,5 ml de ácido nítrico concentrado. Agita-se por 15 minutos, coloca-se em gelo, extrai-se repetidas vezes com diclorometano, secam-se as fases orgânicas combinadas sobre MgSO₄ e remove-se o solvente no vácuo. São obtidos 4,7 g de produto (98% de pureza, 81% de rendimento, logP (HCOOH): 3,60).

[00378] 4-metil-2-cloro-benzotrifluoreto é preparado de acordo com o procedimento da literatura (J. Fluorine Chem. 1981, 18(3), 281-291).

4-(3-*terc*butilfenóxi)-5-trifluormetil-2-metilanilina

[00379] Uma solução de 19,60 g (55,47 mmols) de 4-(3-*terc*butilfenóxi)-5-trifluormetil-2-metilanilina em 100 ml de metanol é inicialmente adicionada a 37,55 g (166,41 mmols) de di-hidrato de cloreto de estanho(II) à temperatura ambiente e, em seguida, lentamente adicionada a 100 ml de ácido clorídrico concentrado sob congelamento. Esta é aquecida sob refluxo por 4 horas, resfriada à temperatura ambiente, concentrada, adicionada à água, o resíduo é filtrado e

secado no vácuo. O produto bruto é purificado por meio de cromatografia de coluna. (13,2 g, 86% de pureza, 63,5% de rendimento, $\log P$ (pH 2,3) = 4,67).

4-(3-tercbutilfenóxi)-5-trifluormetil-2-metilnitrobenzeno

[00380] 3,00 g (19,97 mmols) de 3-tercbutilfenol, 4,35 g (18,16 mmols) de 4-cloro-5-trifluormetil-2-metilnitrobenzeno e 3,26 g (23,60 mmols) de carbonato de potássio são aquecidos sob refluxo em 50 ml de N,N-dimetilformamida a 50°C por 15 minutos. A solução de reação é adicionada à água, extraída repetidamente com diclorometano, secada sobre Na₂SO₄, filtrada e o solvente é removido no vácuo. O sólido é lavado com água e hexano e secado no vácuo (6,6 g, 70,0% de pureza, 72,0% de rendimento, $\log P$ (pH 2,3) = 5,68).

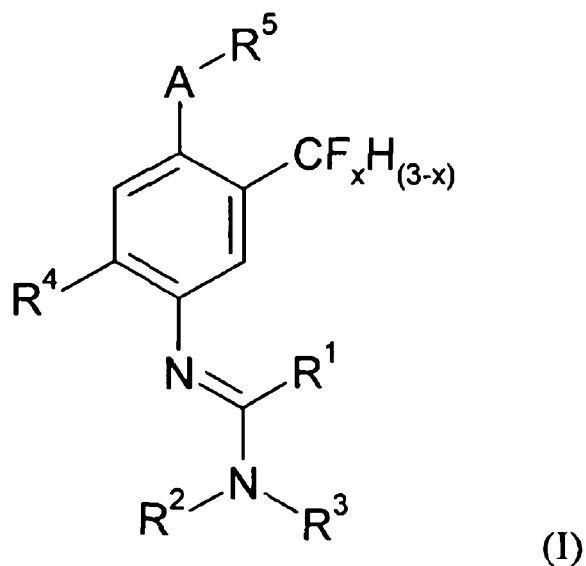
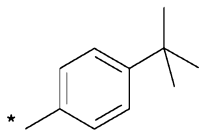
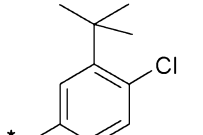
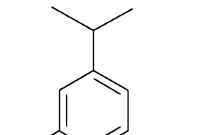
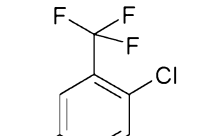
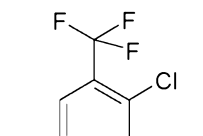
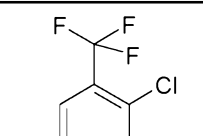
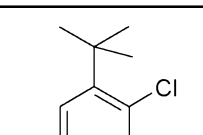
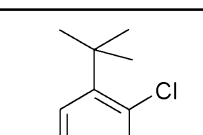
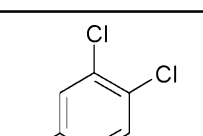
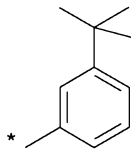
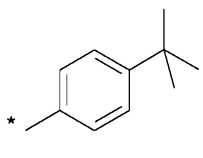
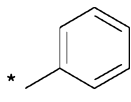
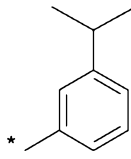
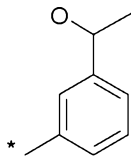
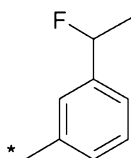
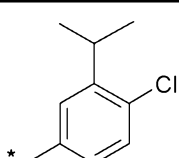
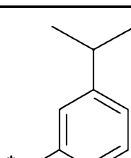
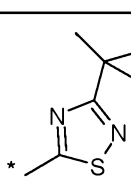
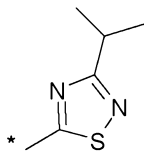
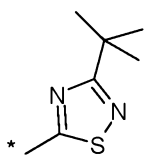
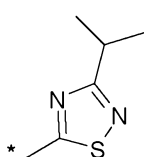
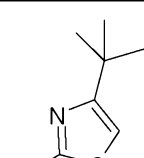
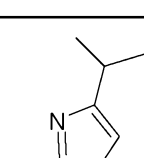
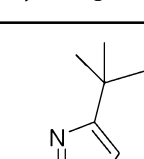
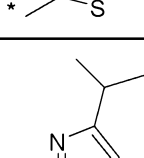


Tabela I

nº	logP neutro	logP ácido	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	x	R ⁵
1		2,93	O	H	Et	Me	Me	1	

n°	logP neutro	logP ácido	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	x	R ⁵
2		2,67	ligação	H	Et	Me	Me	1	
3	6,68	3,26	O	H	Et	Me	Me	3	
4	5,74	2,65	O	H	Et	Me	Me	3	
5	5,77	2,81	O	H	Et	Me	Me	3	
6	6,15	3,01	O	H	Pr	Me	Me	3	
7	6,19	2,98	O	H	-(CH ₂) ₅ -		Me	3	
8	6,30	3,13	O	H	Me	Me	Me	3	
9		2,82	O	H	Et	Me	Me	2	
10		2,31	O	H	Et	Me	Me	2	

n°	logP neutro	logP ácido	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	x	R ⁵
11	6,04	2,52	O	H	Et	Me	Me	3	
12	6,15	2,74	bond	H	Et	Me	Me	3	
13		1,73	O	H	Et	Me	Me	2	
14		2,60	O	H	-(CH ₂) ₅ -		Me	2	
15		1,65	O	H	Et	Me	Me	2	
16		2,17	O	H	Et	Me	Me	2	
17		2,97	O	H	Et	Me	Me	2	
18		2,50	O	H	Et	Me	Me	2	
19			O	H	Et	Me	Me	2	

n°	logP neutro	logP ácido	A	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	x	R ⁵
20			O	H	Et	Me	Me	2	
21			O	H	Et	Me	Me	3	
22			O	H	Et	Me	Me	3	
23			O	H	Et	Me	Me	2	
24			O	H	Et	Me	Me	2	
25			O	H	Et	Me	Me	3	
26			O	H	Et	Me	Me	3	

Exemplos de utilização

Teste com Alternaria (tomate) / protetor

Solvente: 24,5 partes em peso, de acetona

24,5 partes em peso, de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquil-aril-poliglicólico

[00381] Para produzir uma preparação de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quanti-

dades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

[00382] Para testar a eficácia protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos de *Alternaria solani*. Em seguida, as plantas são colocadas em uma cabine de incubação a cerca de 20°C e 100% de umidade atmosférica relativa.

[00383] 3 dias após a inoculação, efetua-se a avaliação. Nesse caso, 0% significa uma eficiência, que corresponde àquela do controle, enquanto uma eficiência de 100% significa, que não se observa qualquer ataque.

[00384] Neste teste, os compostos **3, 5, 9, 12 e 13** de acordo com a invenção (vide tabela I) mostram, com uma concentração de substância ativa de 100 ppm, uma eficiência de 70% ou mais.

Teste com Uromyces (feijão) / protetor

Solvente: 24,5 partes em peso, de acetona
 24,5 partes em peso, de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquil-aril-poliglicólico

[00385] Para produzir uma preparação de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

[00386] Para testar a eficácia protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos do patógeno da ferrugem do feijão *Uromyces appendiculatus* e permanecem, depois, por 1 dia a cerca de 20°C e 100% de umidade atmosférica relativa em uma cabine de incubação.

[00387] Em seguida, as plantas são colocadas na estufa a cerca de 21°C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 90%.

[00388] 10 dias após a inoculação, efetua-se a avaliação. Nesse caso, 0% significa uma eficiência, que corresponde àquela do controle, enquanto uma eficiência de 100% significa, que não se observa qualquer ataque.

[00389] Neste teste, os compostos **3, 4, 5, 9, 10, 12 e 13** de acordo com a invenção (vide tabela I) mostram, com uma concentração de substância ativa de 100 ppm, uma eficiência de 70% ou mais.

Teste com *Sphaerotheca* (pepino) / protetor

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

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

[00390] Para produzir uma preparação de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

[00391] Para testar a eficácia protetora, plantas de pepino jovens são pulverizadas com a preparação da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. 1 dia após o tratamento, as plantas são inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos de *Sphaerotheca fuliginea*. Em seguida, as plantas são colocadas na estufa com 70% de umidade atmosférica relativa e uma temperatura de 23°C.

[00392] 7 dias após a inoculação, efetua-se a avaliação. Nesse caso, 0% significa uma eficiência, que corresponde aquela do controle, enquanto uma eficiência de 100% significa, que não se observa qualquer ataque.

[00393] Neste teste, os compostos **3, 4, 5, 6, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15 e 16** de acordo com a invenção (vide tabela I) mostram, com uma concentração de substância ativa de 500 ppm, uma eficiência de 70% ou mais.

Teste com Erysiphe (cevada) / protetor

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

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

[00394] Para produzir uma preparação de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

[00395] Para testar a eficácia protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são borrifadas com esporos de *Erysiphe graminis f. sp. hordei*. As plantas são colocadas em uma estufa com uma temperatura de cerca de 20°C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 80%, para favorecer o desenvolvimento de pústulas de oídio.

[00396] 7 dias após a inoculação, efetua-se a avaliação. Nesse caso, 0% significa uma eficiência, que corresponde àquela do controle, enquanto uma eficiência de 100% significa, que não se observa qualquer ataque.

[00397] Neste teste, os compostos 1, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10 e 12 de acordo com a invenção, mostram, com uma concentração de substância ativa de 100 ppm, uma eficiência de 70% ou mais.

Teste com Puccinia (trigo) / protetor

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

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

[00398] Para produzir uma preparação de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, de substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

[00399] Para testar a eficácia protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação da substância ativa na quantidade de aplica-

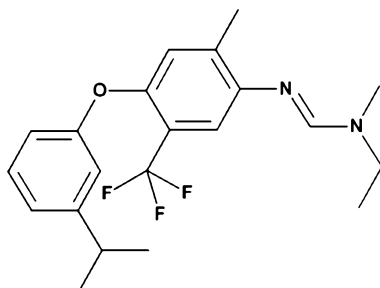
ção indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são borrifadas com uma suspensão de conídias de *Puccinia recondita*. As plantas permanecem em uma cabine de incubação por 48 horas a 20°C e 100% de umidade atmosférica relativa. Em seguida, as plantas são colocadas em uma estufa com uma temperatura de cerca de 20°C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 80%, para favorecer o desenvolvimento de pústulas de ferrugem.

[00400] 10 dias após a inoculação, efetua-se a avaliação. Nesse caso, 0% significa uma eficiência, que corresponde àquela do controle, enquanto uma eficiência de 100% significa, que não se observa qualquer ataque.

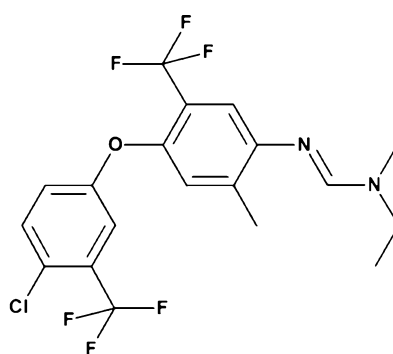
[00401] Neste teste, os compostos 1, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10 e 12 de acordo com a invenção mostram, com uma concentração de substância ativa de 1000 ppm, uma eficiência de 70% ou mais.

REIVINDICAÇÕES

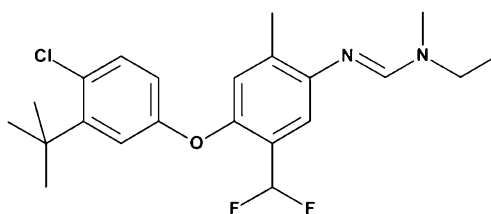
1. Fluoralquilfenilamidinas, caracterizadas pelo fato de que são selecionadas do grupo consistindo em:



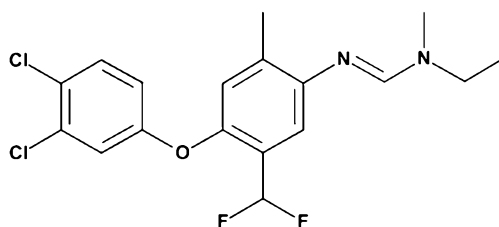
,



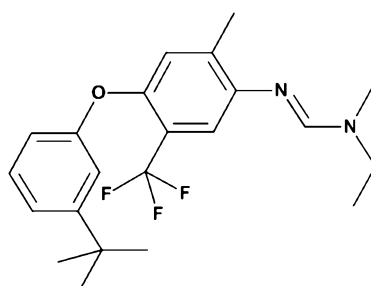
,



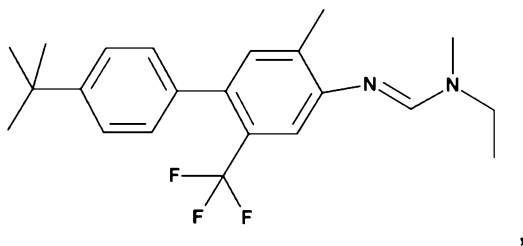
,



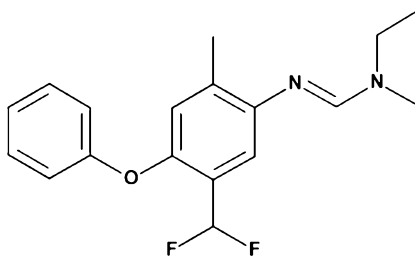
,



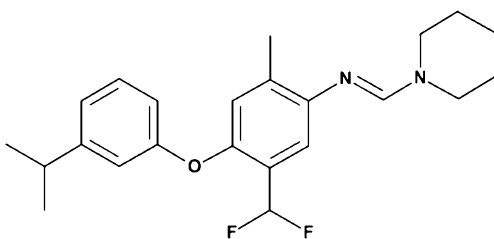
,



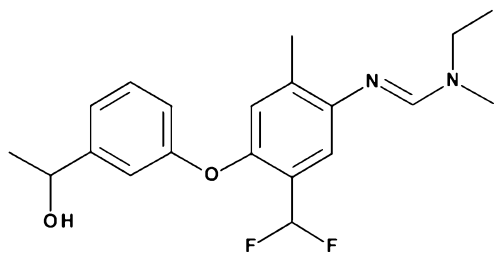
,



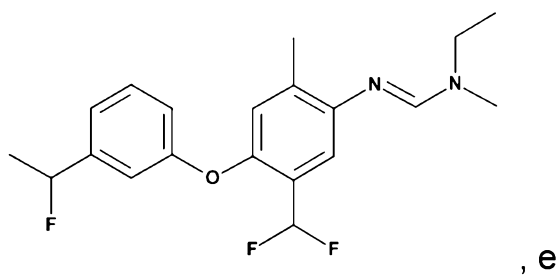
,



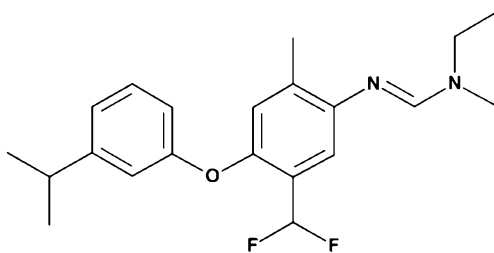
,



,



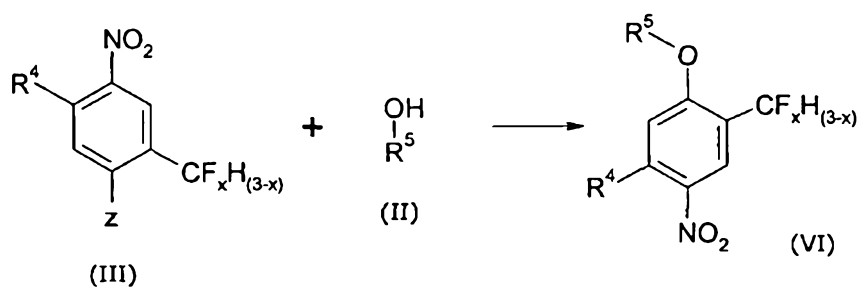
, e



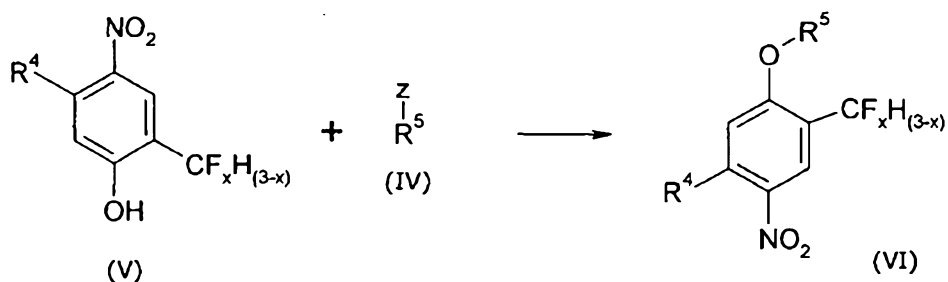
.

2. Processo para preparar as fluoralquilfenilamidinas, como definidas na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que compreende pelo menos uma das seguintes etapas (a) a (n):

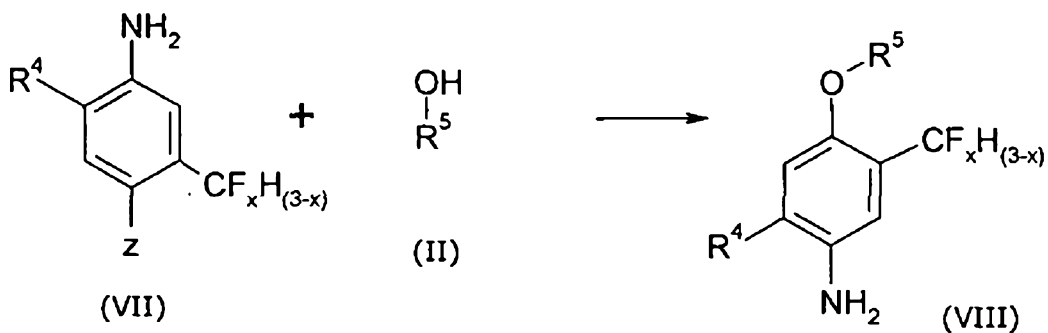
(a) reação de derivados de nitrobenzeno da fórmula (III) com álcoois ou fenóis da fórmula (II), de acordo com o seguinte esquema de reação:



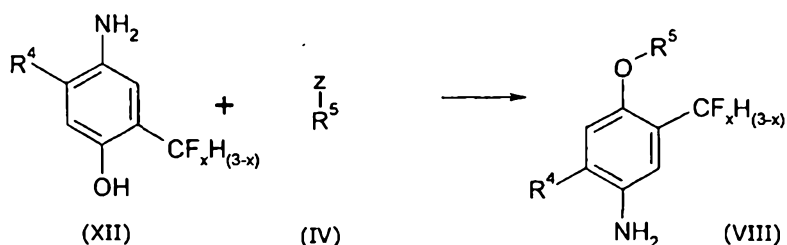
(b) reação de derivados de nitrofenol da fórmula (V) com derivados de fenila de fórmula (IV), de acordo com o seguinte esquema de reação:



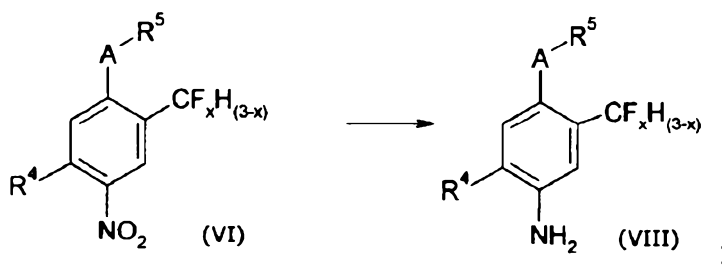
(c) reação de anilinas da fórmula (VII) com fenóis da fórmula (II), de acordo com o seguinte esquema de reação:



(d) reação de aminofenóis da fórmula (XII) com derivados de fenila da fórmula (IV), de acordo com o seguinte esquema de reação:

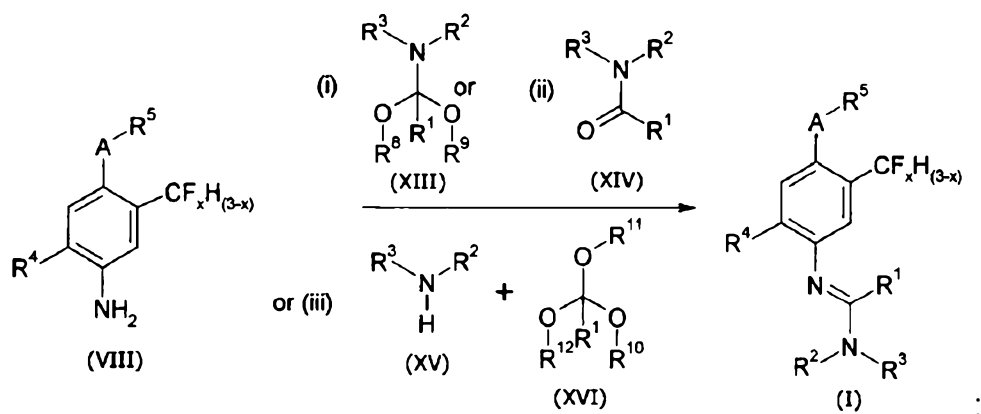


(e) redução dos fluoralquilnitrofenóis da fórmula (VI) para fluoralquilanilinas da fórmula (VIII), de acordo com o seguinte esquema de reação:



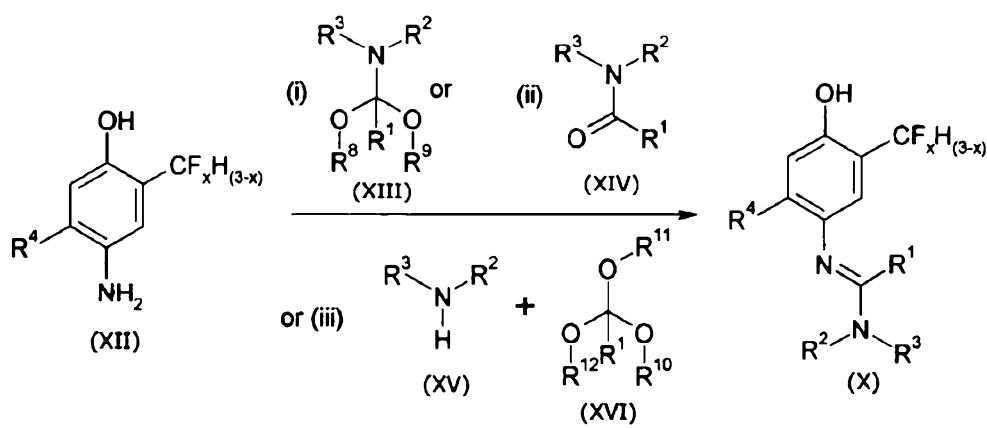
(f) reação dos éteres anilínicos da fórmula (VIII) com

- (i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou
- (ii) com amidas da fórmula (XIV) ou
- (iii) com aminas da fórmula (XV), na presença de orto ésteres da fórmula (XVI), de acordo com o seguinte esquema de reação:

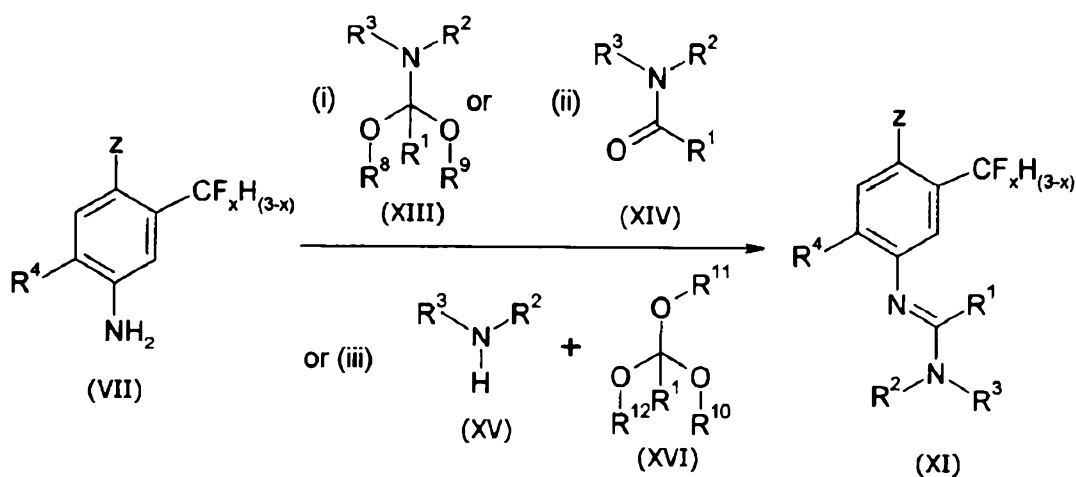


(g) reação dos aminofenóis da fórmula (XII) com

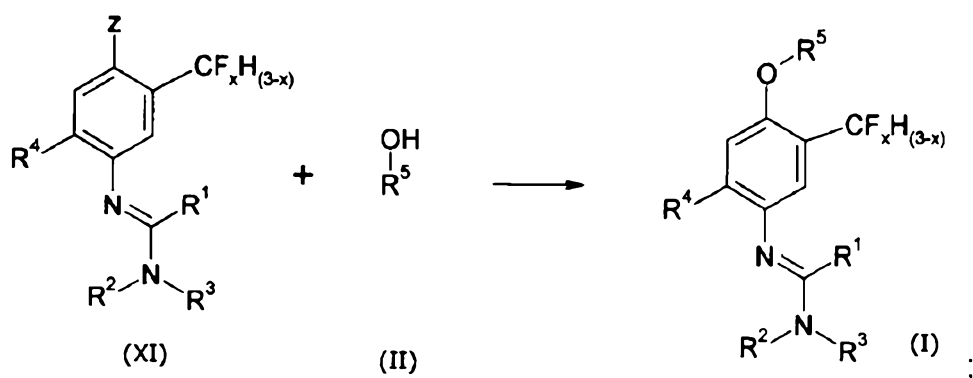
- (i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou
 (ii) com amidas da fórmula (XIV) ou
 (iii) com aminas da fórmula (XV), na presença de orto ésteres da fórmula (XVI), de acordo com o seguinte esquema de reação:



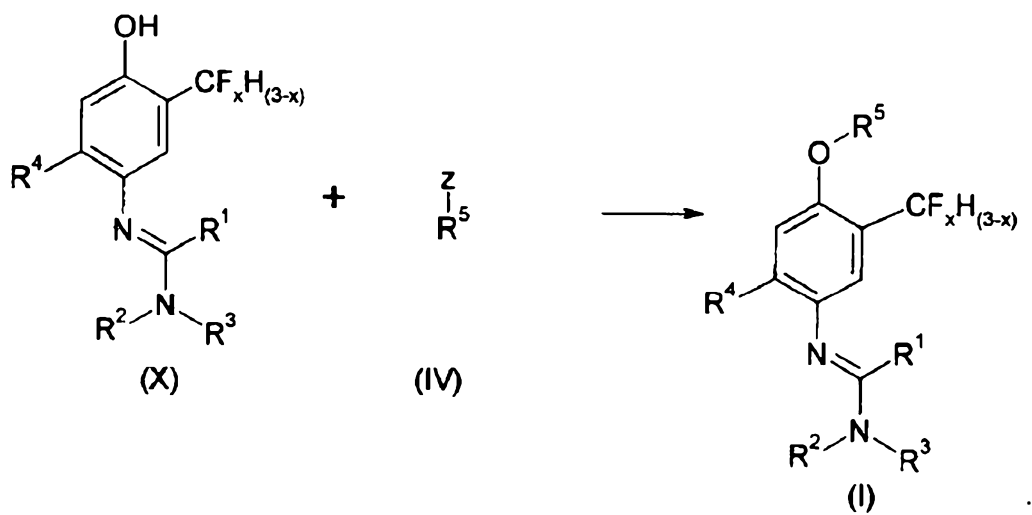
- (h) reação dos aminofenóis da fórmula (VII) com
 (i) aminoacetais da fórmula (XIII) ou
 (ii) com amidas da fórmula (XIV) ou
 (iii) com aminas da fórmula (XV), na presença de orto ésteres da fórmula (XVI), de acordo com o seguinte esquema de reação:



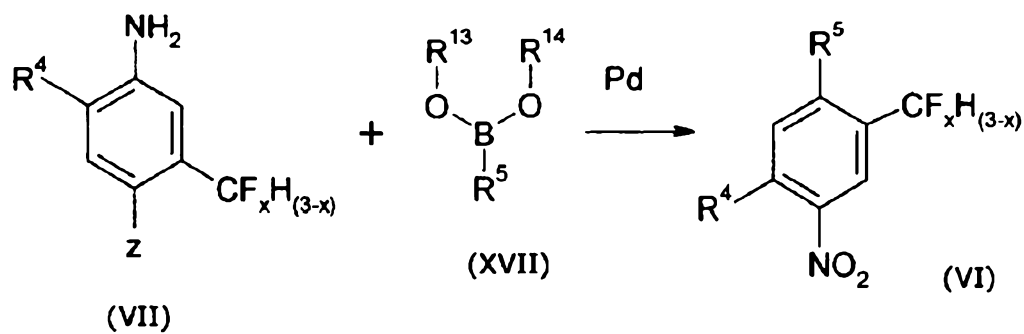
- (i) reação de amidinas da fórmula (XI) com álcoois ou fenóis da fórmula (II) de acordo com o seguinte esquema de reação:



(j) reação de amidinas da fórmula (XI) com derivados de fenila da fórmula (IV), de acordo com o seguinte esquema de reação:



(k) reação de fluoralquilanilinas da fórmula (VII) com derivados de ácido borônico da fórmula (XVII), de acordo com o seguinte esquema de reação:



sendo que nas fórmulas descritas acima,

x é 2 ou 3,

Z é um grupo de saída,

R^1 é hidrogênio,

R^2 é etila,

R^3 é metila,

ou R^2 e R^3 em conjunto formam um anel piperidina,

R^4 é metila,

A é uma ligação simples ou oxigênio,

R^5 é fenila, que é opcionalmente substituída por 1 ou 2 substituintes selecionados do grupo consistindo em iPr, tBu, Cl, CF_3 , (1-hidróxi)etila e (1-flúor)etila;

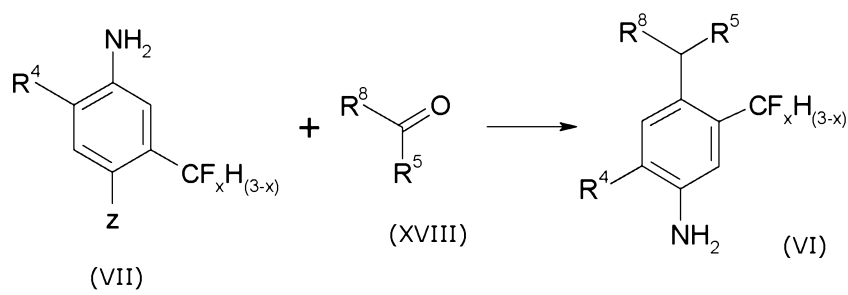
R^8 e R^9 , independentemente uns dos outros, são selecionados de grupos C_1 - C_8 alquila;

R^{10} e R^{11} , independentemente uns dos outros, são selecionados de grupos C_1 - C_8 alquila;

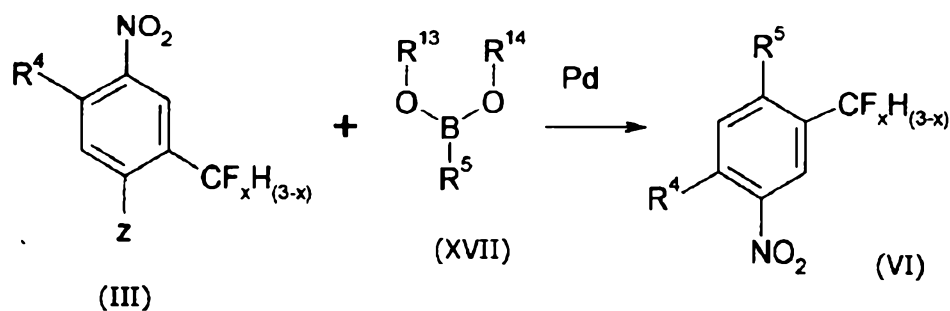
R^{12} é C_1 - C_8 alquila;

R^{13} e R^{14} , independentemente uns dos outros, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila ou C_{5-18} -arila ou C_{7-19} -arilalquila, e os quais, juntos com os átomos de oxigênio aos quais estão ligados, podem formar um anel com cinco, seis ou sete membros;

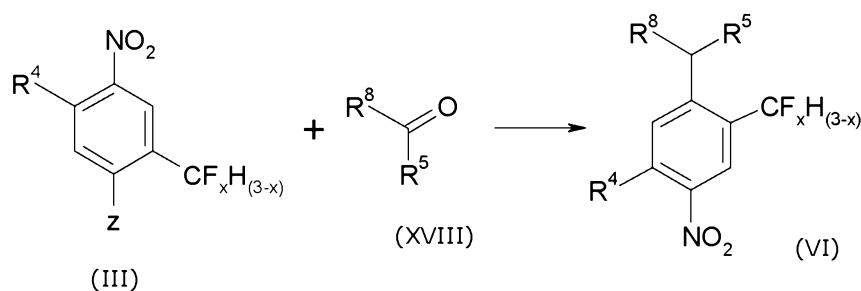
(L) reação de fluoralquilanilinas da fórmula (VII) com aldeídos ou cetonas da fórmula (XVIII), de acordo com o seguinte esquema de reação:



(m) reação de fluoralquilitrobenzenos da fórmula (III) com derivados de ácido borônico da fórmula (XVII), de acordo com o seguinte esquema de reação:



(n) reação de fluoralquilnitrobenzenos da fórmula (III) com aldeídos ou cetonas da fórmula (XVIII), de acordo com o seguinte esquema de reação:



sendo que nas fórmulas descritas acima,

x , Z , R^4 , R^5 e R^8 são como definidos acima;

R^{13} e R^{14} , independentemente uns dos outros, são selecionados do grupo que consiste em hidrogênio, grupos C_{1-12} -alquila, C_{2-12} -alquenila, C_{2-12} -alquinila ou grupos C_{5-18} -arila ou C_{7-19} -arilalquila, e os quais, juntos com os átomos de oxigênio, aos quais estão ligados, podem formar um anel com cinco, seis ou sete membros.

3. Composição para combater micro-organismos indesejados, caracterizada pelo fato de que compreende pelo menos uma fluoralquilfenilamidina, como definidas na reivindicação 1.

4. Uso de uma fluoralquilfenilamidina, como definidas na reivindicação 1, ou de misturas dessas, caracterizado pelo fato de que é para combater micro-organismos indesejados, excluído o tratamento em seres humanos e/ou animais.

5. Processo para combater micro-organismos indesejados, caracterizado pelo fato de que fluoralquilfenilamidinas, como definidas

na reivindicação 1, são aplicadas sobre os micro-organismos e/ou em seu habitat, excluído o tratamento em seres humanos e/ou animais.

6. Semente resistente a micro-organismos indesejados, caracterizada pelo fato de que compreende uma semente que é revestida com pelo menos uma fluoralquilfenilamidina, como definidas na reivindicação 1.

7. Uso de fluoralquilfenilamidinas, como definidas na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que é para o tratamento de semente.

8. Uso de fluoralquilfenilamidinas, como definidas na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que é para o tratamento de plantas transgênicas.

9. Uso de fluoralquilfenilamidinas, como definidas na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que é para o tratamento da semente de plantas transgênicas.

10. Processo para proteger semente contra micro-organismos indesejados, caracterizado pelo fato de que compreende o uso de uma semente tratada com pelo menos uma fluoralquilfenilamidina, como definidas na reivindicação 1.