



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

(21) **PI 0713025-2 A2**



(22) Data de Depósito: 14/06/2007
(43) Data da Publicação: 17/04/2012
(RPI 2154)

(51) *Int.Cl.:*

C07D 207/34
C07D 231/14
C07D 249/04
C07D 277/56
C07D 403/12
C07D 417/12
A01N 43/36
A01N 43/42
A01N 43/56
A01N 43/707
A01N 43/74

(54) **Título:** COMPOSTOS DERIVADOS DE ETENILA CARBOXAMIDA ÚTEIS COMO MICROBIOCIDAS, MÉTODO DE CONTROLE OU PREVENÇÃO DE INFESTAÇÃO DE PLANTAS ÚTEIS POR MICROORGANISMO FITOPATOGÊNICOS E COMPOSIÇÃO PARA CONTROLE E PREVENÇÃO DOS REFERIDOS MICROORGANISMOS

(57) **Resumo:** COMPOSTOS DERIVADOS DE ETENILA CARBOXAMIDA ÚTEIS COMO MICROBIOCIDAS, MÉTODO DE CONTROLE OU PREVENÇÃO DE INFESTAÇÃO DE PLANTAS ÚTEIS POR MICROORGANISMOS FITOPATOGÊNICOS E COMPOSIÇÃO PARA CONTROLE E PREVENÇÃO DOS REFERIDOS MICROORGANISMOS. Compostos da fórmula 1 na qual 1 são adequados para uso como microbiocidas, e na qual A é A₁ ou A é A₂, ou A é A₃ ou A é A₄ e B é um grupo fenila, naftila ou quinolinila.

(30) **Prioridade Unionista:** 16/06/2006 EP 06 012433.6

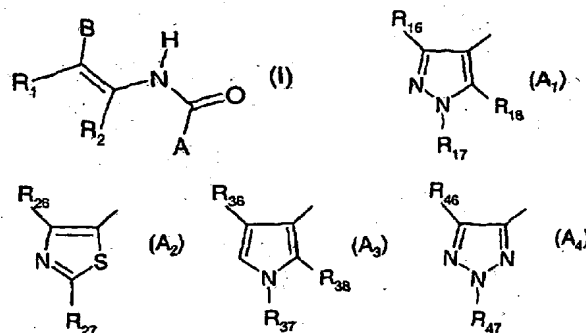
(73) **Titular(es):** Syngenta Limited, Syngenta Participations AG

(72) **Inventor(es):** Daniel Stierli, Harald Walter, John J. Taylor, Paul Anthony Worthington

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

(86) **Pedido Internacional:** PCT EP2007005247 de 14/06/2007

(87) **Publicação Internacional:** WO 2007/144174de 21/12/2007

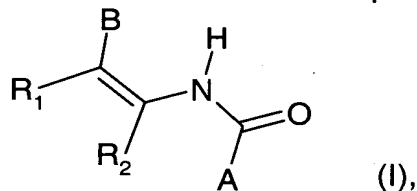


Relatório Descritivo da Patente de Invenção para "**COMPOSTOS DERIVADOS DE ETENILA CARBOXAMIDA ÚTEIS COMO MICROBIOCIDAS, MÉTODO DE CONTROLE OU PREVENÇÃO DE INFESTAÇÃO DE PLANTAS ÚTEIS POR MICROORGANISMOS FITOPATOGÊNICOS E**
5 **COMPOSIÇÃO PARA CONTROLE E PREVENÇÃO DOS REFERIDOS MICROORGANISMOS**".

A presente invenção refere-se a novas etenil amidas, microbiodicamente ativas, em particular fungicidamente ativas. A presente também refere-se a composições que compreendem estes compostos e a seu uso
10 em agricultura ou horticultura para controlar ou prevenir a infestação de plantas por microorganismos fitopatogênicos, preferivelmente fungos.

Derivados de N-[2-(piridinil)etil]-carboxamida e seu uso como fungicidas são descritos no WO 04/074280, WO 05/085238, WO 06/008193 e WO 06/008194. Compostos similares são também conhecidos em outros
15 campos de tecnologia, por exemplo, o uso de cianoenaminas como ligandos para modular a expressão de gene em plantas ou animais é descrito na US 2003/0109705.

Descobriu-se que novas etenila amidas têm atividade microbiodica. A presente invenção desse modo fornece compostos da fórmula I



20 em que

R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio, nitro, C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃, C₃-C₆cicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃ ou C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃;

25 cada R₃ independentemente um do outro significam halogênio, nitro, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenoalcóxi, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-

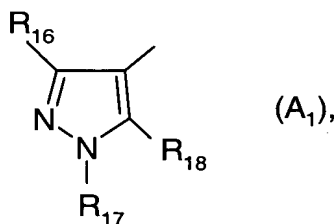
C₆halogenoalquiltio, $-\text{C}(\text{H})=\text{N}(\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})$ ou $-\text{C}(\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})=\text{N}(\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})$;

- ou R₁ e R₂ juntamente com os átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que 1, 2 ou 3 átomos de carbono do referido anel podem ser substituídos por átomos de oxigênio, átomos de nitrogênio e/ou átomos de enxofre e em que o referida anel é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₄;

- cada substituinte R₄ independentemente um do outro significa halogênio, nitro, C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅, C₃-C₆cicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅ ou C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅;

- cada R₅ independentemente um do outro significam halogênio, nitro, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenoalcóxi, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-C₆halogenoalquiltio, $-\text{C}(\text{H})=\text{N}(\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})$ ou $-\text{C}(\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})=\text{N}(\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})$;

A é A₁



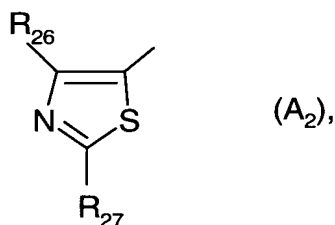
- em que

R₁₆ é halogenometila;

R₁₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenoalquila, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila; e

- R₁₈ é hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenoalquila, C₁-C₄halogenoalcóxi, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila; ou

A é A₂

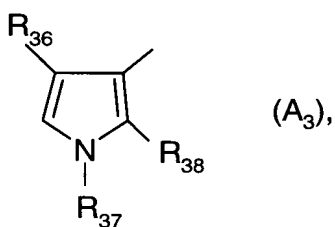


em que

R₂₆ é halogenometila; e

R₂₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄alcóxi- C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila;

5 ou A é A₃



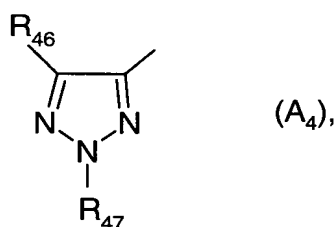
em que

R₃₆ é halogenometila;

R₃₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila; e

10 R₃₈ é hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄halogenoalcóxi, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila;

ou A é A₄



em que

15 R₄₆ é halogenometila; e

R₄₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄alcóxi- C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila;

B é um grupo fenila, naftila ou quinolinila, que é substituído por um ou mais

substituintes R_7 ;

cada substituinte R_7 independentemente um do outro significa halogênio, C_1 - C_6 haloalcóxi, C_1 - C_6 haloalquiltio, ciano, nitro, $-C(H)=N(O-C_1-C_6\text{alquil})$, $-C(C_1-C_6\text{alquil})=N(O-C_1-C_6\text{alquil})$, C_1 - C_6 alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 , C_3 - C_6 cicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 , C_6 - C_{14} bicicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 , C_2 - C_6 alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 , C_2 - C_6 alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 , fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 ou heteroarila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_8 ;

cada R_8 é independentemente um do outro halogênio, ciano, nitro, C_1 - C_6 alcóxi, C_1 - C_6 halogenoalcóxi, C_1 - C_6 alquiltio, C_1 - C_6 halogenoalquiltio, C_3 - C_6 alquenilóxi, C_3 - C_6 alquinilóxi, $-C(H)=N(O-C_1-C_6\text{alquil})$ ou $-C(C_1-C_6\text{alquil})=N(O-C_1-C_6\text{alquil})$;

e isômeros e tautômeros destes compostos.

Os grupos alquila que ocorrem nas definições dos substituintes podem ser de cadeia linear ou ramificados e são, por exemplo, metila, etila, *n*-propila, *n*-butila, *n*-pentila, *n*-hexila, *iso*-propila, *n*-butila, *sec*-butila, *iso*-butila ou *terc*-butila. Os radicais alcóxi, alquenila e alquinila são derivados de radicais alquila mencionados. Os grupos alquenila e alquinila podem ser mono- ou di-insaturados.

Os grupos cicloalquila que ocorrem nas definições dos substituintes são, por exemplo, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila ou cicloexila.

Os grupos bicicloalquila que ocorrem nas definições dos substituintes são, dependendo do tamanho do anel, biciclo[2.1.1]hexano, biciclo[2.2.1]heptano, biciclo[2.2.2]octano, biciclo[3.2.1]octano, biciclo[3.2.2]nonano, biciclo[4.2.2]decano, biciclo[4.3.2]undecano, adamantano e similares.

Halogênio é geralmente flúor, cloro, bromo ou iodo, preferivelmente flúor, bromo ou cloro. Isto também aplica-se, correspondentemente, a

halogênio em combinação com outros significados, tal como halogenaolquila ou halogenoalcóxi.

5 Grupos halogenaolquila preferivelmente têm um comprimento de cadeia de 1 a 4 átomos de carbono. Halogenaolquila é, por exemplo, fluoro- metila, difluorometila, trifluorometila, clorometila, diclorometila, triclorometila, 2,2,2-trifluoroetila, 2-fluoroetila, 2-cloroetila, pentafluoroetila, 1,1-difluoro- 2,2,2-tricloroetila, 2,2,3,3-tetrafluoroetila e 2,2,2-tricloroetila; preferivelmente triclorometila, difluoroclorometila, difluorometila, trifluorometila e diclorofluo- rometila.

10 Grupos halogenalquenila adequados são grupos alquenila que são mono- ou polissubstituídos por halogênio, halogênio sendo flúor, cloro, bromo e iodo e em particular flúor e cloro, por exemplo, 2,2-difluoro-1- metilvinila, 3-fluoropropenila, 3-cloropropenila, 3-bromopropenila, 2,3,3- trifluoropropenila, 2,3,3-tricloropropenila e 4,4,4-trifluorobut-2-en-1-ila.

15 Grupos halogenalquinila adequados são, por exemplo, grupos alquinila que são mono- ou polissubstituído por halogênio, halogênio sendo bromo, iodo e em particular flúor e cloro, por exemplo, 3-fluoropropinila, 3- cloropropinila, 3-bromopropinila, 3,3,3-trifluoropropinila e 4,4,4-trifluorobut-2- in-1-ila.

20 Alcóxi é, por exemplo, metóxi, etóxi, propóxi, i-propóxi, n-butóxi, isobutóxi, sec-butóxi e terc-butóxi; preferivelmente metóxi e etóxi. Halogeno- alcóxi é, por exemplo, fluorometóxi, difluorometóxi, trifluorometóxi, 2,2,2- trifluoroetóxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetóxi, 2-fluoroetóxi, 2-cloroetóxi, 2,2- difluoroetóxi e 2,2,2-tricloroethóxi; preferivelmente difluorometóxi, 2- cloroetóxi e trifluorometóxi. Alquiltio é, por exemplo, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, sec-butiltio ou terc-butiltio, preferivelmente metiltio e etiltio.

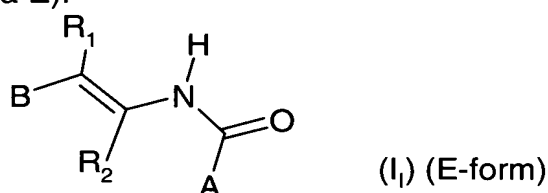
25 Alcoxialquila é, por exemplo, metoximetila, metoxietila, etoximeti- la, etoxietila, n-propoximetila, n-propoxietila, isopropoximetila ou isopropoxie- tila.

30 No contexto da presente invenção "substituído por um ou mais substituintes" na definição de substituintes R_1 , R_2 , R_4 e R_7 , significa tipica-

mente, dependendo da estrutura química de substituintes R_1 , R_2 , R_4 e R_7 , monossubstituído a substituído nove vezes, preferivelmente monossubstituído a substituído cinco vezes, mais preferivelmente mono-, duplo- ou triplo-substituído.

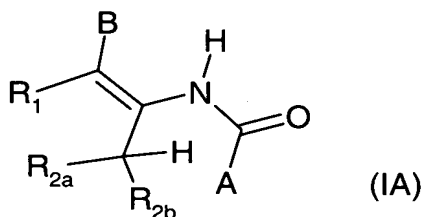
5 No contexto da presente invenção "substituído por um ou mais substituintes" na definição de substituinte B, significa tipicamente, dependendo da estrutura química de substituinte B, monossubstituído a substituído sete vezes, preferivelmente monossubstituído a substituído cinco vezes, mais preferivelmente mono-, duplo- ou triplo-substituído.

10 Os compostos da fórmula I (forma-Z) ocorrem também na forma isomérica I_1 (Forma E):

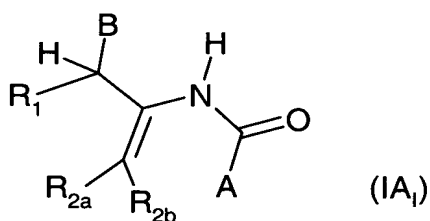


A invenção também abrange a forma isomérica I_1 .

Compostos da fórmula IA

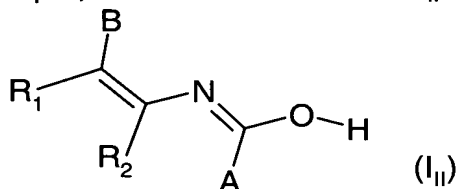


em que B, R_1 e A são como definido sob a fórmula I e R_{2a} e R_{2b} são cada
 15 qual independentemente hidrogênio ou C_1 - C_5 alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_3 , C_2 - C_5 alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_3 ou C_2 - C_5 alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_3 ;
 ou R_1 e R_{2a} juntamente com os átomos de carbono aos quais eles são liga-
 20 dos formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que 1, 2 ou 3 átomos de carbono do referido anel podem ser substituídos por átomos de oxigênio, átomos de nitrogênio e/ou átomos de enxofre e em que o referido anel é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R_4 ; ocorrem também na forma isomérica IA_1



A invenção também abrange a forma isomérica IA_I.

Compostos da fórmula I existem também em formas tautoméricas, tais como, por exemplo, na forma tautomérica I_{II}:



A invenção também abrange a forma tautomérica I_{II} e todas as formas tautoméricas de compostos de fórmula I_I, IA e IA_I ou misturas de qualquer destes compostos em qualquer relação.

Em um grupo preferido de compostos R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃,
 10 ou R₁ e R₂ juntamente com os átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que o referido anel é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₄.

Em um grupo preferido de compostos R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃,
 15 ou R₁ e R₂ juntamente com os átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que o referido anel é não-substituído ou substituído
 20 por um ou mais substituintes R₄.

Em um grupo preferido de compostos R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, C₁-C₆alcóxi e C₁-C₆halogenoalcóxi; ou R₁ e R₂ juntamente com os

átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que o referido anel é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, C₁-C₆alcóxi e C₁-C₆halogenoalcóxi.

5 Em um grupo preferido de compostos R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, ciano, C₁-C₆alcóxi e C₁-C₆halogenoalcóxi; mais preferivelmente R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio e C₁-C₆alcóxi; mais preferivelmente R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio, ou C₁-C₆alquila.

15 Em outro grupo preferido de compostos R₁ e R₂ com os átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que o referido anel é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, C₁-C₆alcóxi e C₁-C₆halogenoalcóxi.

20 Em um grupo preferido de compostos A é A₁.

Em outro grupo preferido de compostos A é A₂.

Em outro grupo preferido de compostos A é A₃.

Em outro grupo preferido de compostos A é A₄.

25 Em um grupo preferido particular de compostos A é A₁, em que R₁₈ é hidrogênio. Em outro grupo preferido particular de compostos A é A₁, em que R₁₆ é halometila, preferivelmente R₁₆ é selecionado de CF₃, CF₂H e CFH₂; R₁₇ é C₁-C₄alquila; e R₁₈ é hidrogênio ou halogênio, preferivelmente hidrogênio.

30 Em outro grupo preferido particular de compostos A é A₂, em que R₂₆ é halometila. preferivelmente R₂₆ é selecionado de CF₃, CF₂H e CFH₂; e R₂₇ é C₁-C₄alquila.

Em ainda outro grupo preferido particular de compostos A é A₃, em que R₃₆ é halometila, preferivelmente R₃₆ é selecionado de CF₃, CF₂H e

CFH₂; R₃₇ é C₁-C₄alquila; e R₃₈ é hidrogênio ou halogênio.

Em ainda outro grupo preferido particular de compostos A é A₄, em que R₄₆ halometila, preferivelmente R₄₆ é selecionado de CF₃, CF₂H e CFH₂; e R₄₇ é C₁-C₄alquila.

5 Uma modalidade da invenção é representada por compostos, em que B é um grupo fenila, que é substituído por um ou mais substituintes R₇.

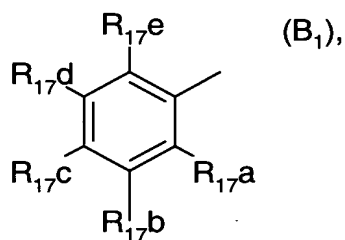
Dentro da referida modalidade, preferivelmente B é um grupo fenila, que é substituído por um, dois ou três substituintes R₇; mais preferi-
10 velmente B é um grupo fenila, que é substituído por um ou dois substituintes R₇.

Também preferivelmente, B é um grupo fenila, que é substituído por pelo menos um substituinte R₇ na posição para.

Em um grupo preferido de compostos cada substituinte R₇ inde-
15 pendentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆haloalcóxi, C₁-C₆haloalquiltio, ciano, nitro, -C(H)=N(O-C₁-C₆alquil), -C(C₁-C₆alquil)=N(O-C₁-C₆alquil), C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído
20 por um ou mais substituintes R₈ ou C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈.

Em um grupo preferido de compostos cada substituinte R₇ inde-
pendentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆alquila, que é não-
substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de ha-
logênio e C₁-C₆alcóxi ou C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído
25 por um ou mais substituintes selecionados de halogênio e C₁-C₆alcóxi.

Em um grupo preferido de compostos, B é B₁



em que

R_{17a} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17b} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17c} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17d} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17e} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; contanto que pelo menos um de R_{17a}, R_{17b}, R_{17c}, R_{17d} e R_{17e} não seja hidrogênio.

Em uma modalidade da invenção, R_{17b} e R_{17d} é hidrogênio; e R_{17a}, R_{17c} e R_{17e} independentemente um do outro são selecionados de hidrogênio, halogênio, ciano, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é halogênio substituído; contanto que pelo menos um de R_{17a}, R_{17c} e R_{17e} não seja hidrogênio.

Em uma modalidade da invenção, R_{17b} e R_{17d} é hidrogênio; e R_{17a}, R_{17c} e R_{17e} independentemente um do outro são selecionados de hidrogênio, halogênio, C₂-C₆alquinila ou C₁-C₆halogenaolquila; contanto que pelo menos um de R_{17a}, R_{17c} e R_{17e} não seja hidrogênio.

Outra modalidade da invenção é representada por compostos, em que B é um grupo naftila ou quinolinila, que é substituído por um ou mais substituintes R₇.

Outra modalidade da invenção é representada por compostos, em que B é um grupo naftila, que é substituído por um ou mais substituintes R₇.

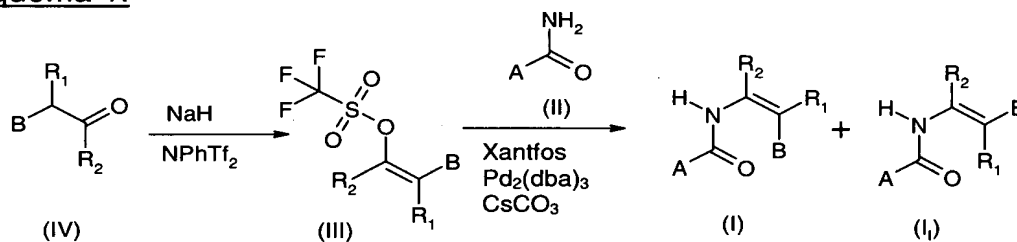
Dentro da referida modalidade, preferivelmente B é um grupo naftila, que é substituído por um ou dois substituintes R₇. Dentro da referida

modalidade, em um grupo preferido de compostos cada substituinte R₇ independentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆haloalcóxi, C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio e C₁-C₆alcóxi; C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio e C₁-C₆alcóxi; ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios.

Outra modalidade da invenção é representada por compostos, em que B é um grupo quinolinila, que é substituído por um ou dois substituintes R₇. Dentro da referida modalidade, em um grupo preferido de compostos cada substituinte R₇ independentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆haloalcóxi, C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio e C₁-C₆alcóxi; C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio e C₁-C₆alcóxi; ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios.

Compostos de fórmula I podem ser preparados pelo esquema de reação 1.

Esquema 1:

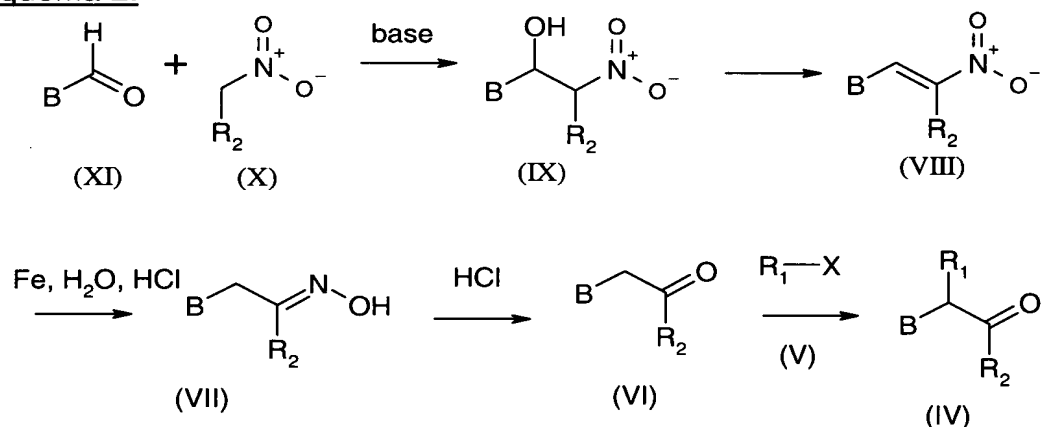


Compostos carbonila de fórmula IV, em que R₁, R₂ e B são como definido sob a fórmula I, podem ser transformados em triflatos de enol de fórmula III, em que R₁, R₂ e B são como definido sob a fórmula I, utilizando metodologia padrão, tal como por exemplo, reação com NaH e NPhTf₂. A referida metodologia é descrita em *J. Am. Chem. Soc.* **1991**, 113, 8975; *J. Org. Chem.* **1989**, 54, 4975 e *Tetrahedron Lett.* **1983**, 979. As temperaturas de reação são entre -20°C e 30°C, solventes adequados são éteres tal como THF, éter dietílico, ou dioxano. Amidação catalisada por paládio dos triflatos de enol de fórmula III com amidas primárias de fórmula II, em que A é como

definido sob a fórmula I fornece os compostos de fórmula I e os compostos isoméricos de fórmula I₁. Geralmente ambos os isômeros são obtidos. As temperaturas de reação são entre 10°C e 80°C e um solvente adequado para esta reação é, por exemplo, dioxano. Outros parâmetros de reação são descritos em *Organic Lett.* **2003**, 5, 4749-4752.

Compostos de fórmula IV podem ser preparados pelo esquema de reação 2.

Esquema 2:



10 Compostos carbonila de fórmula (XI), em que B é como definido sob a fórmula I podem ser reagidos com nitroalcanos de fórmula X, em que R₂ é como definido sob a fórmula I para fornecer compostos álcool de 2-nitro de fórmula IX, em que B e R₂ são como definidos sob a fórmula I, por meio da assim chamada "Reação de Henry" (reação de nitroaldol) de acordo com

15 (a) Baer, H. H., Urbas, L. *The chemistry of the nitro and nitroso groups*; Feuer, H., Ed.; Interscience: New York, **1970**; Vol.2, pp 75-20; (b) Schickh, G.; Apel, H. G. *Methoden der Organischen Chemie (Houben-Weyl Stuttgart, 1971; Vol. 10/1, pp 9-462*; (c) Kabalka, G. W.; Varma, R.s. *Org. Prep. Proc. Int.* **1987**, 283-328; ou (d) Luzzio, F. A. *Tetrahedron* **2001**, 57, 915-945.

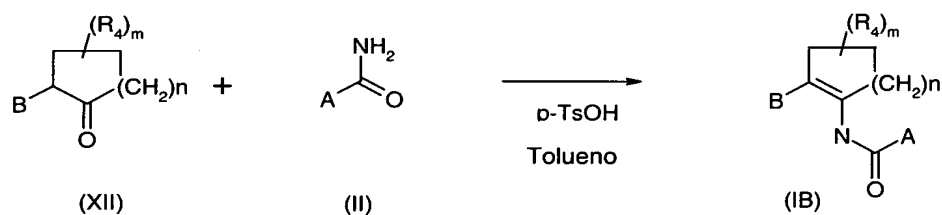
20 Desidratação subsequente fornece nitroalcenos de fórmula VIII, em que B e R₂ são como definidos sob a fórmula I. Uma tal etapa de desidratação é descrita, por exemplo, em *Org. Synthesis Coll Vol I*, 413, (1941). As reações mencionadas acima são realizadas em temperaturas entre 0 – 80°C em solventes próticos e apróticos convenientes, porém podem ser também realizadas

sob condições livres de solvente. Bases convenientes descritas na literatura incluem hidróxidos de metal de álcali, óxidos alcalinos-terrosos, carbonatos, bicarbonatos, alcóxidos e sais de amônio quaternário.

Os nitroalcenos de fórmula VIII podem ser reduzidos com ferro e ácido clorídrico para fornecer oximas de fórmula VII, em que B e R₂ são como definidos sob a fórmula I. As referidas oximas podem ser hidrolisadas a cetonas de fórmula VI, em que B e R₂ são como definidos sob a fórmula I, como é descrito, por exemplo, em *J. Am. Chem. Soc.* 65, 1180 (1943) e *Synthetic Commun.*, 35, 913-922, 2005. A reação é realizada em temperaturas entre 40 – 100°C em um solvente orgânico conveniente tal como metanol, etanol, terc-butanol, trifluoroetanol ou dioxano. A alquilação da cetona de fórmula VI com um composto de fórmula V, em que R₁ é como definido sob a fórmula I e X é um grupo de saída, tal como halogênio, mesilato ou tosila-to, na presença de uma base produz a cetona α -alquilada desejada de fórmula IV, em que B, R₁ e R₂ são como definidos sob a fórmula I. Esta reação é vantajosamente realizada em solventes orgânicos inertes apróticos. Tais solventes são hidrocarbonetos tais como benzeno, tolueno, xileno ou cicloexano, éteres tais como éter dietílico, éter dimetílico de etileno glicol, éter dimetílico de dietileno glicol, tetraidrofurano ou dioxano, amidas tais como N,N-dimetilformamida, dietilformamida ou N-metilpirrolidinona. As temperaturas de reação são entre -20°C e +120°C. Bases adequadas são bases inorgânicas tais como hidretos, por exemplo, hidreto de sódio ou hidreto de cálcio, hidróxidos, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido de potássio, carbonatos tais como carbonato de sódio e carbonato de potássio, ou carbonatos de hidrogênio tais como carbonato de hidrogênio de potássio e carbonato de hidrogênio de sódio podem também ser utilizados como bases. As bases podem ser utilizadas como tais ou então com quantidades catalíticas de um catalisador de transferência de fase, por exemplo, um éter coroa, em particular 18-coroa-6, ou um sal de tetraalquilamônio.

Compostos de fórmula IB podem ser preparados pelo esquema de reação 3.

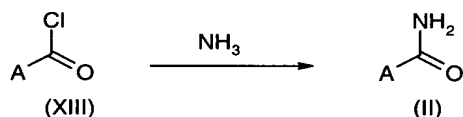
Esquema 3:



Compostos cicloalquenila de fórmula IB, em que R₄, A e B são como definidos sob a fórmula I e n e m são 1 a 3, podem ser preparados por condensação de 2-aryl cicloalcanonas de fórmula XII, em que R₄ e B são como definidos sob a fórmula I e n e m são 1 a 3, com uma amida primária de fórmula II, em que A é como definido sob a fórmula I. Tais reações de condensação são descritas, por exemplo, em *J. Org. Chem.* **1995**, *60*, 4324-4330. A reação é realizada em um solvente conveniente em temperatura de refluxo com um catalisador ácido e remoção azeotrópica de água. Solventes adequados são tolueno ou xileno. Ácido para-toluenossulfônico (PTSA) e resina *Amberlyst-15* podem ser utilizados como catalisadores ácidos.

Compostos de fórmula II podem ser preparados pelo esquema de reação 4.

Esquema 4:



Compostos de fórmula XIII, em que A é como definido sob a fórmula I, são reagidos com amônia para fornecer os compostos de fórmula II utilizando-se metodologia conhecida.

Para preparação de todos os outros Compostos da fórmula I funcionalizados de acordo com as definições de A, B, R₁ e R₂, existe um grande número de métodos padrão conhecidos adequados, tais como alquilação, halogenação, acilação, amidação, oximação, oxidação e redução. A escolha dos métodos de preparação que são adequados é dependente das propriedades (reatividade) dos substituintes nos intermediários.

Os compostos da fórmula XIII são conhecidos e alguns deles são comercialmente disponíveis. Eles podem ser preparados analogamente como descrito, por exemplo, nos WO 00/09482, WO 02/38542, WO 04/018438, EP-0-589-301, WO 93/11117 e Arch. Pharm. Res. 2000, 23(4),

315-323.

Os compostos de fórmula V, X, XI e XII são conhecidos e são comercialmente disponíveis ou podem ser preparados de acordo com as referências mencionadas acima ou de acordo com métodos conhecidos na
5 técnica.

As reações resultando em Compostos da fórmula I são vantajosamente realizadas em solventes orgânicos inertes apróticos. Tais solventes são hidrocarbonetos tais como benzeno, tolueno, xileno ou cicloexano, hidrocarbonetos clorinado tais como diclorometano, triclorometano, tetraclo-
10 rometano ou clorobenzeno, éteres tais como éter dietílico, éter dimetílico de etileno glicol, éter dimetílico de dietileno glicol, tetraidrofurano ou dioxano, nitrilas tais como acetonitrila ou propionitrila, amidas tais como N,N-dimetilformamida, dietilformamida ou N-metilpirrolidinona. As temperaturas de reação são vantajosamente entre -20°C e +120°C. Em geral, as reações
15 são levemente exotérmicas e, geralmente, elas podem ser realizadas em temperatura ambiente. Para diminuir o tempo de reação, ou então iniciar a reação, a mistura pode ser aquecida sucintamente para o ponto de ebulição da mistura reacional. Os tempos de reação podem também ser diminuídos por adição de algumas gotas de base como catalisador de reação. Bases
20 adequadas são, em particular, aminas terciárias tais como trimetilamina, trietilamina, quinuclidina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano, 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno ou 1,5-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Entretanto, bases inorgânicas tais como hidretos, por exemplo, hidreto de sódio ou hidreto de cálcio, hidróxidos, por exemplo, hidróxido de sódio ou hidróxido
25 de potássio, carbonatos tais como carbonato de sódio e carbonato de potássio, ou carbonatos de hidrogênio tais como hidrogeno carbonato de potássio e carbonato de hidrogênio de sódio podem também ser utilizados como bases. As bases podem ser utilizadas como tais ou então com quantidades catalíticas de um catalisador de transferência de fase, por exemplo, um éter coroa, em particular 18-coroa-6, ou um sal de tetraalquilamônio.
30

Os compostos de fórmula I podem ser isolados da maneira usual por concentração e/ou por evaporação do solvente e purificados por recrista-

lização ou trituração do resíduo sólido em solventes em que eles não são facilmente solúveis, tais como éteres, hidrocarbonetos aromáticos ou hidrocarbonetos clorados.

Os compostos I e, onde apropriado, os tautômeros destes, podem estar presentes na forma de um dos isômeros que são possíveis ou como uma mistura destes, por exemplo, na forma de isômeros puros, tais como antípodos e/ou diastereômeros, ou como misturas de isômero, tais como misturas de enantiômero, por exemplo, racematos, misturas de diastereômero ou misturas de racemato, dependendo do número, configuração absoluta e relativa de átomos de carbono assimétricos que ocorrem na molécula e/ou dependendo da configuração de ligações duplas não aromáticas que ocorrem na molécula; a invenção refere-se aos isômeros puros e também a todas as misturas de isômero que são possíveis e deve ser entendida em cada caso neste sentido anterior e posterior, mesmo quando detalhes estereoquímicos não são mencionados especificamente em cada caso.

Misturas diastéreo-isoméricas ou misturas de racemato de compostos I, que podem ser obtidas dependendo de quais materiais de partida e procedimentos foram escolhidos podem ser separadas de uma maneira conhecida nos diastereômeros puros ou racematos com base nas diferenças físicoquímicas dos componentes, por exemplo, por cristalização fracional, destilação e/ou cromatografia.

Misturas enantioméricas, tais como racematos, que podem ser obtidas de uma maneira similar podem ser resolvidas nos antípodos óticos por métodos conhecidos, por exemplo, por recristalização de um solvente opticamente ativo, por cromatografia sobre adsorventes quirais, por exemplo, cromatografia líquida de desempenho elevado (HPLC) sobre acetil celulose, com o auxílio de microorganismos adequados, por clivagem com enzimas imobilizadas, específicas, por meio da formação de compostos de inclusão, por exemplo, utilizando éteres coroa quirais, onde apenas um enantiômero é complexado, ou por conversão em sais diastereoméricos, por exemplo, por reação de um racemato de produto final básico com um ácido opticamente ativo, tal como um ácido carboxílico, por exemplo, ácido canfor, tartárico ou

málico, ou ácido sulfônico, por exemplo, ácido canforsulfônico, e separação da mistura de diastereômero que pode ser obtida desta maneira, por exemplo, por cristalização fracional baseada em suas diferentes solubilidades, para fornecer os diastereômeros, dos quais o enantiômero desejado pode ser estabelecido livre pela ação de agentes adequados, por exemplo, agentes básicos.

Diastereômeros ou enantiômeros puros podem ser obtidos de acordo com a invenção não apenas por separação de misturas de isômero adequadas, porém também por métodos geralmente conhecidos de síntese diastereoseletiva ou enantioseletiva, por exemplo, realizando-se o processo de acordo com a invenção com materiais de partida de uma estereoquímica adequada.

É vantajoso isolar ou sintetizar em cada caso o isômero biologicamente mais eficaz, por exemplo, enantiômero ou diastereômero, ou mistura de isômero, por exemplo, mistura de enantiômero ou mistura de diastereômero, se os componentes individuais tiverem uma atividade biológica diferente.

Os compostos I e, onde apropriado, os tautômeros destes, podem, se apropriado, também ser obtidos na forma de hidratos e/ou incluem outros solventes, por exemplo, aqueles que podem ter sido utilizados para a cristalização de compostos que estão presentes em forma sólida.

Foi atualmente descoberto que os compostos de fórmula I de acordo com a invenção têm, para propósitos práticos, um espectro muito vantajoso de atividades para proteção de plantas úteis contra doenças que são causadas por microorganismos fitopatogênicos, tais como fungos, bactérias ou viroses.

A invenção refere-se a um método de controle ou prevenção de infestação de plantas úteis por microorganismos fitopatogênicos, em que um composto de fórmula I é aplicado como ingrediente ativo às plantas, às partes destas ou ao loco destas. Os compostos de fórmula I de acordo com a invenção são distinguidos por excelente atividade em baixas taxas de aplicação, por serem bem tolerados por plantas e por serem ambientalmente seguros. Eles têm propriedades curativa, preventiva e sistêmica muito úteis

e são utilizados para proteger numerosas plantas úteis. Os compostos de fórmula I podem ser utilizados para inibir ou destruir as doenças que ocorrem nas plantas ou partes de plantas (fruto, flores, folhas, caules, tubérculos, raízes) de diferentes colheitas de plantas úteis, enquanto ao mesmo tempo
5 proteger também aquelas partes das plantas que se desenvolvem mais tarde por exemplo, de microorganismos fitopatogênicos.

É também possível utilizar compostos de fórmula I como agentes de adubo para o tratamento de material de propagação de planta, em particular de sementes (fruto, tubérculos, grãos) e mudas de planta (por exemplo,
10 arroz), para a proteção contra infecções fúngicas bem como contra fungos fitopatogênicos que ocorrem no solo.

Além disso, os compostos de fórmula I de acordo com a invenção podem ser utilizados para controlar fungos em áreas relacionadas, por exemplo, na proteção de materiais técnicos, incluindo madeira e produtos
15 técnicos relacionados à madeira, em armazenagem de alimento ou em manuseio de higiene.

Os compostos de fórmula I são, por exemplo, eficazes contra os fungos fitopatogênicos das seguintes classes: Fungi imperfecti (por exemplo, *Botrytis*, *Pyricularia*, *Helminthosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cercospora* e
20 *Alternaria*) e Basidiomicetos (por exemplo, *Rhizoctonia*, *Hemileia*, *Puccinia*). Adicionalmente, eles são também eficazes contra as classes de Ascomicetos (por exemplo, *Venturia* e *Erysife*, *Podosphaera*, *Monilinia*, *Uncinula*) e das classes de Oomicetos (por exemplo, *Phytophthora*, *Pythium*, *Plasmopara*). Atividade importante foi observada contra mofo em pó (*Erysife* spp.).
25 Além disso, os novos compostos de fórmula I são eficazes contra bactérias fitopatogênicas e viroses (por exemplo, contra *Xanthomonas* spp, *Pseudomonas* spp, *Erwinia amilovora* bem como contra o vírus de mosaico de tabaco). Boa atividade foi observada contra ferrugem de soja asiática (*Phakopsora pachyrhizi*).

30 Dentro do escopo da invenção, plantas úteis para serem protegidas tipicamente compreendem as seguintes espécies de plantas: cereal (trigo, cevada, centeio, aveia, arroz, milho, sorgo e espécies relacionadas);

beterraba (beterraba açucareira e beterraba alimentar); pomo, drupas e fruto macio (maças, peras, ameixas, pêsegos, amêndoas, cerejas, morangos, framboesas e amoras-pretas); plantas leguminosas (feijões, lentilhas, ervilhas, sojas); plantas oleosas (colza, mostarda, papoula, azeitonas, girassóis, coco, plantas de óleo de rícino, grãos de coco, amendoins); plantas de pepino (abóboras, pepinos, melões); plantas de fibra (algodão, linho, cânhamo, juta); fruto cítrico (laranjas, limões, toranja, mandarins); vegetais (espinafre, alface, aspargo, repolhos, cenouras, cebolas, tomates, batatas, páprica); lauráceas (abacate, canela, canfor) ou plantas tais como tabaco, nozes, cafés, berinjelas, cana-de-açúcar, chá, pimenta, videiras, lúpulos, bananas e plantas de borracha natural, bem como ornamentais.

O termo "plantas úteis" deve ser entendido como incluindo também plantas úteis que foram tornadas tolerantes a herbicidas como bromoxinila ou classes de herbicidas (tais como, por exemplo, inibidores de HPPD, inibidores de ALS, por exemplo, primisulfuron, prosulfuron e trifloxisulfuron, inibidores de EPSPS (5-enol-pirovil-chiquimato-3-fosfato-sintase), inibidores de GS (glutamina sintetase) ou inibidores de PPO (protoporfirinog oxidase)) como um resultado de métodos convencionais de reprodução ou engenharia genética. Um exemplo de uma colheita que foi tornada tolerante a imidazolinonas, por exemplo, imazamox, por métodos convencionais de reprodução (mutagênese) é Clearfield® colza de verão (Canola). Exemplos de colheitas que foram tornadas tolerantes a herbicidas ou classes de herbicidas por métodos de engenharia genética incluem variedades de milho resistentes a glifosato e glufosinato comercialmente disponíveis sob os nomes comerciais RoundupReady®, Herculex I® e Libertilink®.

O termo "plantas úteis" deve ser entendido como incluindo também plantas úteis que foram desse modo transformadas pelo uso de técnicas de DNA recombinante que elas são capazes de sintetizar uma ou mais toxinas de ação seletiva, tais como são conhecidas, por exemplo, de bactérias de produção de toxina, especialmente aquelas do gênero *Bacillus*.

O termo "plantas úteis" deve ser entendido como incluindo também plantas úteis que foram desse modo transformadas pelo uso de técni-

cas de DNA recombinante que elas são capazes de sintetizar substâncias antipatogênicas tendo uma ação seletiva, tais como, por exemplo, as assim chamadas "proteínas relacionadas à patogênese" (PRPs, veja por exemplo, EP-A-0 392 225). Exemplos de tais substâncias antipatogênicas e plantas transgênicas capazes de sintetizar tais substâncias antipatogênicas são conhecidos, por exemplo, de EP-A-0 392 225, WO 95/33818, e EP-A-0 353 191. Os métodos de produzir tais plantas transgênicas são geralmente conhecidos pela pessoa versada na técnica e são descritos, por exemplo, nas publicações mencionadas acima.

10 O termo "loco" de uma planta útil como utilizado aqui destina-se a abranger o lugar no qual as plantas úteis estão desenvolvendo-se, onde os materiais de propagação de planta das plantas úteis são semeados ou onde os materiais de propagação de planta das plantas úteis serão colocados no solo. Um exemplo para um tal loco é um campo, no qual plantas de colheita estão desenvolvendo-se.

15 O termo "material de propagação de planta" é entendido por denotar partes geradoras da planta, tais como sementes, que podem ser utilizadas para a multiplicação das últimas, e material vegetativo, tal como mudas ou tubérculos, por exemplo, batatas. Neste contexto pode ser mencionado por exemplo, sementes (no sentido estrito), raízes, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas e partes de plantas. Plantas germinadas e plantas jovens que devem ser transplantadas após germinação ou após emergência do solo, podem também ser mencionadas. Estas plantas jovens podem ser protegidas antes do transplante por um tratamento total ou parcial por imersão.

20 Preferivelmente "material de propagação de planta" é entendido denotar sementes.

Os compostos de fórmula I podem ser utilizados em forma não modificada ou, preferivelmente, juntamente com veículos e adjuvantes convencionalmente empregados na técnica de formulação.

30 Portanto, a invenção também refere-se às composições para controle e proteção contra microorganismos fitopatogênicos, compreendendo um composto de fórmula I e um veículo inerte, e a um método de controle

ou prevenção de infestação de plantas úteis por microorganismos fitopatogênicos, em que uma composição, compreendendo um composto de fórmula I como ingrediente ativo e um veículo inerte, é aplicada às plantas, às partes destas ou ao loco destas.

5 Para esta finalidade, os compostos de fórmula I e veículos inertes são convenientemente formulados de maneira conhecida em concentra-
dos emulsificáveis, pastas revestíveis, soluções diretamente vaporizáveis ou
diluíveis, emulsões diluídas, pós umectáveis, pós solúveis, poeiras, granula-
dos, e também encapsulações por exemplo, em substâncias poliméricas.
10 Como com o tipo das composições, os métodos de aplicação, tais como va-
porização, atomização, polvilhamento, dispersão, revestimento ou despeja-
mento, são escolhidos de acordo com os objetivos pretendidos e as circuns-
tâncias prevaletentes. As composições podem também conter outros adju-
vantes tais como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de viscosida-
15 de, aglutinantes ou aderentes bem como fertilizantes, doares de micronutri-
ente ou outras formulações para obter efeitos especiais.

 Veículos e adjuvantes adequados podem ser sólidos ou líquidos
e são substâncias úteis na tecnologia de formulação, por exemplo, substân-
cias naturais ou minerais regeneradas, solventes, dispersantes, agentes
20 umectantes, aderentes, espessantes, aglutinantes ou fertilizantes. Tais veí-
culos são, por exemplo, descritos no WO 97/33890.

 Os compostos de fórmula I ou composições, compreendendo um
composto de fórmula I como ingrediente ativo e um veículo inerte, pode ser
aplicado ao loco da planta ou planta a ser tratada, simultaneamente ou em
25 sucessão com outros compostos. Estes outros compostos podem ser, por
exemplo, fertilizantes ou doadores de micronutriente ou outras preparações
que influenciam o crescimento das plantas. Eles podem também ser herbici-
das seletivos, bem como inseticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas,
molusticidas, ou misturas de diversas dessas preparações, se desejado, jun-
30 tamente com outros veículos, tensoativos ou adjuvantes de promoção de
aplicação habitualmente empregados na técnica de formulação.

 Um método preferido de aplicar um composto de fórmula I, ou

uma Composição, compreendendo um composto de fórmula I como ingrediente ativo e um veículo inerte, é aplicação folhear. A frequência de aplicação e a taxa de aplicação dependerá do risco de infestação pelo correspondente patógeno. Entretanto, os compostos de fórmula I podem também penetrar a
5 planta através das raízes por meio do solo (ação sistêmica) por encharcamento do loco da planta com uma formulação líquida, ou aplicando-se os compostos em forma sólida ao solo, por exemplo, em forma granular (aplicação ao solo). Em colheitas de arroz de água tais granulados podem ser aplicados ao campo de arroz alagado. Os compostos de fórmula I podem tam-
10 bém ser aplicados às sementes (revestimento) impregnando-se as sementes ou tubérculos com uma formulação líquida do fungicida ou revestindo-os com uma formulação sólida.

Uma formulação, isto é, uma composição compreendendo o composto de fórmula I e, se desejado, um adjuvante sólido ou líquido, é pre-
15 parado de uma maneira conhecida, tipicamente e intimamente misturando-se e/ou moendo-se o composto com extensores, por exemplo, solventes, veículos sólidos e, opcionalmente, compostos tensoativos (tensoativos).

As formulações químicas usualmente conterão de 0,1 a 99% em peso, preferivelmente de 0,1 a 95% em peso, do composto de fórmula I, 99,9
20 a 1% em peso, preferivelmente 99,8 a 5% em peso, de um adjuvante sólido ou líquido, e de 0 a 25% em peso, preferivelmente de 0,1 a 25% em peso, de um tensoativo.

Ao passo que é preferido formular produtos comerciais como concentrados, o usuário final normalmente utilizará formulações diluídas.

25 Taxas vantajosas de aplicação são normalmente de 5 g a 2 kg de ingrediente ativo (a.i.) por hectare (ha), preferivelmente de 10 g a 1 kg a.i./ha, mais preferivelmente de 20 g a 600 g a.i./ha. Quando utilizado como um agente de encharcamento de semente, taxas convenientes de aplicação são de 10 mg a 1 g de substância ativa por kg de sementes. A taxa
30 de aplicação da ação desejada pode ser determinada por experimentos. Ela depende, por exemplo, do tipo de ação, do estágio de desenvolvimento da planta útil, e da aplicação (localização, duração, método de aplicação) e po-

de, devido a estes parâmetros, variar dentro de amplos limites.

Surpreendentemente, foi atualmente descoberto que os compostos de fórmula I podem também ser utilizados em métodos de proteção de colheitas de plantas úteis contra o ataque por organismo os fitopatogênicos, bem como o tratamento de colheitas úteis infestadas por organismo os fitopatogênicos compreendendo administrar uma combinação de glifosato e pelo menos um composto de fórmula I à planta ou loco desta em que a planta é resistente ou sensível ao glifosato.

Os referidos métodos podem fornecer controle inesperadamente melhorado de doenças em comparação ao uso dos compostos de fórmula I na ausência de glifosato. Os referidos métodos podem ser eficazes no realce do controle de doença por compostos de fórmula I. Ao mesmo tempo que a mistura de glifosato e pelo menos um composto de fórmula I pode aumentar o espectro da doença controlado, pelo menos em parte, pelo composto de fórmula I, um aumento na atividade do composto de fórmula I sobre espécies de doença já conhecidos ser controlados em algum grau pelo composto de fórmula I, pode também ser o efeito observado.

Os referidos métodos são particularmente eficazes contra os organismo os fitopatogênicos do *kingdom Fungi*, *phylum Basidiomycot*, class *Uredinomyces*, subclasse *Urediniomycetidae* e a ordem *Uredinales* (comumente referida como ferrugens). Espécies de ferrugens tendo um impacto particularmente grande sobre a agricultura incluem aquelas da família *Phakopsoraceae*, particularmente aquelas do gênero *Phakopsora*, por exemplo, *Phakopsora pachyrhizi*, que é também referida como ferrugem da soja Asiática, e aquelas da família *Pucciniaceae*, particularmente aquelas do gênero *Puccinia* tal como *Puccinia graminis*, também conhecido como ferrugem de caule ou ferrugem negro, que é uma doença problema em colheitas de cereal e *Puccinia recondita*, também conhecido como ferrugem marrom.

Uma modalidade do referida método é um método de proteger colheitas de plantas úteis contra o ataque por um organismo fitopatogênico e/ou o tratamento de colheitas de plantas úteis infestadas por um organismo fitopatogênico, o referido método compreendendo simultaneamente aplicar

glifosato, incluindo sais ou ésteres destes, e pelo menos um composto de fórmula I, que tem atividade contra o organismo fitopatogênico a pelo menos um membro selecionado do grupo consistindo na planta, uma parte da planta e o loco da planta.

5 Surpreendentemente, foi atualmente descoberto que os compostos de fórmula I, ou um sal farmacêutica destes, descritos acima, têm também um espectro de atividade vantajoso para o tratamento e/ou prevenção de infecção microbiana em um animal.

"Animal" pode ser qualquer animal, por exemplo, inseto, mamífero, réptil, peixe, anfíbio, preferivelmente mamífero, mais preferivelmente ser humano. "Tratamento" significa o uso de um animal que tem infecção microbiana a fim de reduzir ou tornar mais lenta ou interromper a doença ou disseminação da infecção, ou para reduzir a infecção ou curar a infecção. "Prevenção" significa o uso em um animal que não tem nenhum sinal evidente de infecção microbiana a fim de prevenir qualquer infecção futura, ou para reduzir ou tornar lento o aumento ou disseminação de qualquer infecção futura.

De acordo com a presente invenção é provido o uso de um composto de fórmula I na fabricação de um medicamento para uso no tratamento e/ou prevenção de infecção microbiana em um animal. É também provida a utilização de um composto de fórmula I como um agente farmacêutico. É também provida a utilização de um composto de fórmula I como um agente antimicrobiano no tratamento de um animal. De acordo com a presente invenção é também fornecida uma composição farmacêutica compreendendo como um ingrediente ativo, um composto de fórmula I, ou um sal farmacêuticamente aceitável deste, e um diluente ou veículo farmacêuticamente aceitável. Esta composição pode ser utilizada para o tratamento e/ou prevenção de antiinfecção microbiana em um animal. Esta composição farmacêutica pode ser em uma forma adequada para administração oral, tal como comprimido, losangos, cápsulas duras, suspensões aquosas, suspensões oleosas, pós dispersíveis em emulsões, grânulos dispersíveis, xaropes e elixires. Alternativamente, esta composição farmacêutica pode ser em uma

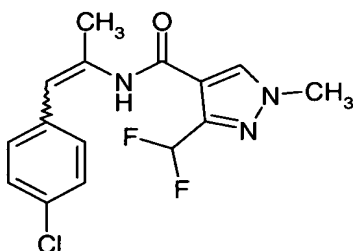
forma adequada para aplicação tópica, tal como um *spray*, um creme ou loção. Alternativamente, esta composição farmacêutica pode ser em uma forma adequada para administração parenteral, por exemplo, injeção. Alternativamente esta composição farmacêutica pode ser em forma inalável, tal como um *spray* aerosol.

Os compostos de fórmula I são eficazes contra várias espécies microbianas capazes de causar uma infecção microbiana em um animal. Exemplos de tais espécies microbianas são aquelas que causam Aspergilose, tal como *Aspergillus fumigatus*, *A. flavus*, *A. terreus*, *A. nidulans* e *A. niger*; aquelas que causam Blastomycosis tal como *Blastomyces dermatitidis*; aquelas que causam Candidíase tal como *Candida albicans*, *C. glabrata*, *C. tropicalis*, *C. parapsilosis*, *C. krusei* e *C. lusitaniae*; aquelas que causam Coccidioidomycosis tal como *Coccidioides immitis*; aquelas que causam Cryptococcosis tal como *Cryptococcus neoformans*; aquelas que causam Histoplasmosis tal como *Histoplasma capsulatum* e aquelas que causam Zygomycosis tal como *Absidia corymbifera*, *Rhizomucor pusillus* e *Rhizopus arrhizus*. Outros exemplos são *Fusarium* Spp tal como *Fusarium oxisporum* e *Fusarium solani* e *Scedosporium* Spp tal como *Scedosporium apiospermum* e *Scedosporium prolificans*. Todavia, outros exemplos são *Microsporum* Spp, *Trichophyton* Spp, *Epidermophyton* Spp, *Mucor* Spp, *Sporothrix* Spp, *Phialophora* Spp, *Cladosporium* Spp, *Petriellidium* spp, *Paracoccidioides* Spp e *Histoplasma* Spp.

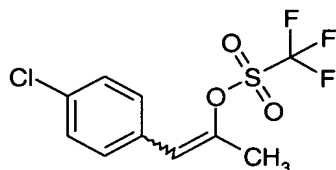
Os seguintes Exemplos não limitantes ilustram a invenção acima descrita em maiores detalhes sem limitá-la.

Exemplos de preparação:

Exemplo P1: Preparação de [(E/Z)-2-(4-clorofenil)-1-metil-vinil]-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (composto n.º 1.007):



a) Preparação de éster 2-(4-cloro-fenil)-1-metil-vinílico de ácido trifluoro-metanossulfônico



4-Clorofenilacetona (1,0 g, 5,9 mmoles) foi adicionada a uma suspensão agitada de hidreto de sódio (515 mg de 55-65 peso %, 11,8
 5 mmoles) em THF (15 ml) a 0°C. A mistura reacional foi agitada durante 1 hora, em seguida N-fenil-(bis)-trifluorometanossulfonamida (2,5 g, 7,08 mmoles) foi adicionado. A mistura reacional foi agitada durante 3 horas em temperatura ambiente. MeOtBu (20 ml) e etanol (1 ml) foram adicionados. Após isto, água (20 ml) foi adicionada e as camadas foram separadas. A camada
 10 aquosa foi extraída com MeOtBu (20 ml). As camadas orgânicas combinadas foram lavadas com água (20 ml) e solução de cloreto de sódio a 10% (20 ml), secadas sobre MgSO₄ e concentradas em vácuo. O concentrado foi purificado por cromatografia *instantânea* sobre sílica-gel (eluente: hexano/etilacetato 9:1). 1,5 g (84% de teoria) de uma mistura de isômeros E e Z
 15 de éster 2-(4-cloro-fenil)-1-metil-vinílico de ácido trifluoro-metanossulfônico foi obtido na forma de um óleo incolor.

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): δ 6,57 (s,1H,(forma Z), 6,1 (s,1H,(forma E)), 2,27 (s,3H,(forma E)), 2,25 (s,3H, (forma Z)).

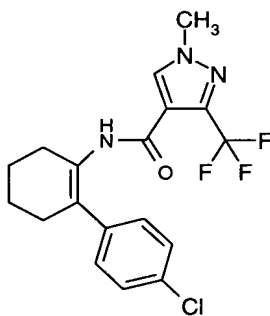
b) Preparação de [(E/Z)-2-(4-clorofenil)-1-metil-vinil]-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (composto nº 1.007)

20 Cs₂CO₃ (301 mg, 0,92 mmol), amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (150 mg, 0,86 mmol), Xantfos (38 mg, 0,06 mmol) e Pd₂(dba)₃ (20 mg, 0,02 mmol) foram adicionados a uma solução dos triflatos de enol como preparada no exemplo 1a) (200 mg, 0,66 mmol) em

dioxano (4 ml) em temperatura ambiente. A mistura foi agitada sob atmosfera de nitrogênio durante 15 horas a 50°C. A mistura foi filtrada, concentrada e purificada por cromatografia *instantânea* sobre sílica-gel (eluente: hexano/etilacetato 8:2). Uma mistura de [(E)-2-(4-clorofenil)-1-metil-vinil]-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico e [(Z)-2-(4-clorofenil)-1-metil-vinil]-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico foi obtida.

¹H RMN (400 MHz, CDCl₃): isômero E δ 2,12 (d, 3H, CH₃), 3,93 (s, 3H, CH₃), 6,85 (t, 1H, CHF₂, J = 55 Hz), 7,18 (m, 2H, ArH), 7,30 (m, 2H, ArH), 7,30 (s, 1H), 7,49 (s, 1H, NH), 7,97 (s, 1H, pirazol-H); isômero Z δ 2,34 (d, 3H, CH₃), 3,98 (s, 3H, CH₃), 5,83 (s, 1H), 6,83 (t, 1H, CHF₂, J = 55 Hz), 7,19 (m, 2H, ArH), 7,26 (m, 2H, ArH), 7,64 (s, 1H, NH), 7,84 (s, 1H, pirazol-H).

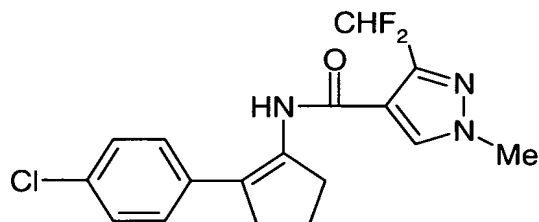
Exemplo P2: Preparação de [2-(4-Clorofenil)-cicloex-1-enil]-amida de ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico (composto nº 2.025):



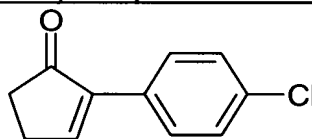
0,521 g de 2-(4-clorofenil)-cicloexanona (preparado como descrito em J. Org. Chem. 70, 2005, página 2967) e 0,482 g de amida de ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico foram suspensos com 5 mg de ácido p-toluenossulfônico em 20 ml de tolueno e aquecidos à temperatura de refluxo do solvente durante 24 horas sob remoção contínua de água. A mistura reacional foi lavada com bicarbonato de sódio a 5% e água, secada e o solvente foi removido sob vácuo. O produto de reação foi purificado por cromatografia sobre uma coluna de sílica-gel (eluente: etilacetato:hexano 1:1). 0,55 g de [2-(4-clorofenil)-cicloex-1-enil]-amida de ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico foi obtido na forma de cristais (ponto de

fusão de 145 - 148°C).

Exemplo P3: Preparação de [2-(4-cloro-fenil)-ciclopent-1-enil]-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H -pirazol-4-carboxílico (composto nº 1.024):

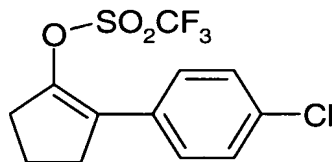


5 **a) Preparação de 2-(4'clorofenil)ciclopent-2-enona**



4,8 g de 2-Iodo-ciclopent-2-enona (preparado como descrito em Org. Lett. 6, 2004, página 3289), 5,4 g de ácido 4-clorofenilborônico, 8,5 g de óxido de prata(I), 0,425 g de trifenilarsina e 0,265 g de $\text{Pd}(\text{C}_6\text{H}_5\text{CN})_2\text{Cl}_2$ foram adicionados a 90 ml de tetraidrofurano e 20 ml de água. A mistura reacional foi agitada sob atmosfera de nitrogênio durante 16 horas. A mistura reacional foi diluída com cloreto de amônio, filtrada e extraída duas vezes com acetato de etila. O resíduo foi purificado por cromatografia e o solvente foi evaporado. 3,44 g de 2-(4'clorofenil)ciclopent-2-enona foram obtidos (ponto de fusão de 71 - 72°C).

15 **b) Preparação de éster 2-(4-cloro-fenil)-1-metil-vinílico de ácido trifluorometanossulfônico**



0,5 g do produto preparado como descrito no exemplo 3a) foi dissolvido em 15 ml de diclorometano e resfriado para -78°C. 2,85 ml de uma solução a 1M de selectrídeo de sódio foram adicionados gota a gota. A mistura reacional foi agitada durante 2 horas a -78°C. 1g de N,N-Bis(trifluormetilsulfonil)anilina foi adicionado e a mistura foi aquecida para a temperatura ambiente. Água foi adicionada, a mistura reacional foi extraída

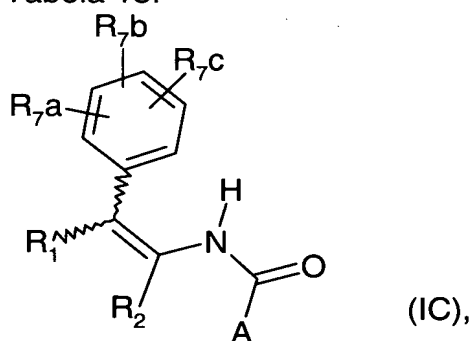
com diclorometano, lavada com água e secada. Após remoção do solvente, a mistura reacional foi cromatografada sobre sílica-gel (hexano:acetato de etila 3:1). 0,61 g do enoltriflato foi obtido. Este produto de reação foi utilizado diretamente sem outra purificação.

5 c) Preparação de [2-(4-cloro-fenil)-ciclopent-1-enil]-amida de ácido 1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxílico (composto nº 1.024)

O enoltriflato preparado como descrito no exemplo 3b) foi dissolvido sob atmosfera de nitrogênio em 12 ml de dioxano, 0,85 g de carbonato de céσιο e 0,425 g de 1-Metil-3-difluormetil-4-pirazolcarboxamida foram adicionados. 0,19 g de Xantfos® e 0,1 g de Pd₂(dba)₃ foram adicionados e a suspensão resultante agitada sob atmosfera de nitrogênio durante 16 horas a 50°C. A mistura reacional foi filtrada, lavada com acetato de etila, o solvente foi removido e o produto de reação foi purificado por cromatografia sobre sílica-gel (hexano:acetato de etila 3:1). 0,4 g de [2-(4-cloro-fenil)-ciclopent-1-enil]-amida de ácido 1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxílico foi obtido (ponto de fusão de 103 - 105°C).

Tabelas 1 a 6: Compostos da fórmula IC

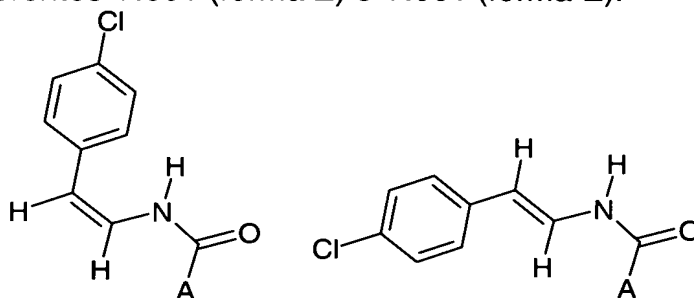
A invenção é também ilustrada pelos compostos individuais preferidos da fórmula IC listada abaixo nas Tabelas 1 a 6. Dados de caracterização são fornecidos na Tabela 13.



Cada das Tabelas 1 a 6, que segue a Tabela Y abaixo, compreende 256 compostos da fórmula IC em que R₁, R₂, R_{7a}, R_{7b} e R_{7c} têm os valores fornecidos na Tabela Y e A tem o valor fornecido nas Tabelas pertinentes 1 a 6. Desse modo a Tabela 1 corresponde à Tabela Y quando Y for 1 e A tiver o valor fornecido no cabeçalho da Tabela 1, a Tabela 2 corresponde à Tabela Y quando Y for 2 e A tiver o valor fornecido no cabeçalho da Tabela

2, e assim por diante para as Tabelas 3 a 6.

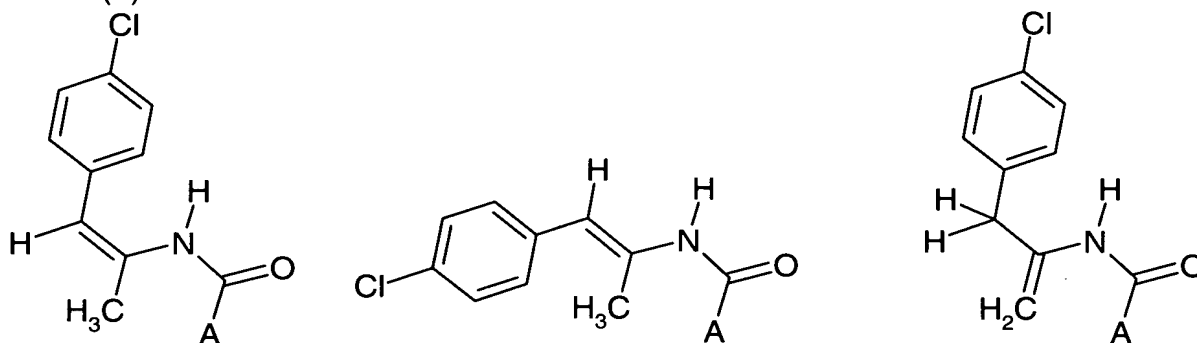
Todos os compostos da fórmula IC ocorrem em pelo menos duas formas isoméricas diferentes, como elas são descritas para os compostos da fórmula I, como compostos da fórmula I (forma Z) e compostos da fórmula I₁ (forma E). Por exemplo, compostos nº Y.001 ocorrem nas duas formas isoméricas diferentes Y.001 (forma Z) e Y.001 (forma E):



Y.001 Forma Z

Y.001 Forma E

Alguns outros compostos da fórmula IC, tais como, por exemplo, compostos nº Y.007, Y.019, Y.033 e Y.045 entre outros, ocorrem em três formas isoméricas diferentes. Por exemplo, compostos nº Y.007 ocorrem nas três formas isoméricas diferentes Y.007 (forma Z), Y.007 (forma E) e Y.007 (3):



Y.007 (Z-forma)

Y.007 (forma E)

Y.007 (3)

Outros compostos da fórmula IC ocorrem em mais do que três formas isoméricas. Por exemplo, compostos nº Y.008 a Y.018 ocorrem em mais do que três formas isoméricas diferentes.

Tabela Y:

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.001	H	H	4-Cl	H	H
Y.002	CH ₃	H	4-Cl	H	H
Y.003	CH ₂ CH ₃	H	4-Cl	H	H
Y.004	CH(CH ₃) ₂	H	4-Cl	H	H
Y.005	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-Cl	H	H
Y.006	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-Cl	H	H
Y.007	H	CH ₃	4-Cl	H	H
Y.008	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H
Y.009	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H
Y.010	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-Cl	H	H
Y.011	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H
Y.012	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-Cl	H	H
Y.013	H	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H
Y.014	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H
Y.015	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H
Y.016	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H
Y.017	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H
Y.018	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H
Y.019	H	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H
Y.020	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H
Y.021	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H
Y.022	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H
Y.023	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H
Y.024	(CH ₂) ₃		4-Cl	H	H
Y.025	(CH ₂) ₄		4-Cl	H	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.026	(CH ₂) ₅		4-Cl	H	H
Y.027	H	H	4-CF ₃	H	H
Y.028	CH ₃	H	4-CF ₃	H	H
Y.029	CH ₂ CH ₃	H	4-CF ₃	H	H
Y.030	CH(CH ₃) ₂	H	4-CF ₃	H	H
Y.031	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-CF ₃	H	H
Y.032	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-CF ₃	H	H
Y.033	H	CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.034	CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.035	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.036	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.037	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.038	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.039	H	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.040	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.041	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.042	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.043	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.044	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H
Y.045	H	CH(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H	H
Y.046	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H	H
Y.047	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H	H
Y.048	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H	H
Y.049	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H	H
Y.050	(CH ₂) ₃		4-CF ₃	H	H
Y.051	(CH ₂) ₄		4-CF ₃	H	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.052	(CH ₂) ₅		4-CF ₃	H	H
Y.053	H	H	4-OCF ₃	H	H
Y.054	CH ₃	H	4-OCF ₃	H	H
Y.055	CH ₂ CH ₃	H	4-OCF ₃	H	H
Y.056	CH(CH ₃) ₂	H	4-OCF ₃	H	H
Y.057	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-OCF ₃	H	H
Y.058	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-OCF ₃	H	H
Y.059	H	CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.060	CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.061	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.062	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.063	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.064	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.065	H	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.066	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.067	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.068	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.069	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.070	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H
Y.071	H	CH(CH ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H
Y.072	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H
Y.073	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H
Y.074	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H
Y.075	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H
Y.076	(CH ₂) ₃		4-OCF ₃	H	H
Y.077	(CH ₂) ₄		4-OCF ₃	H	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.078	(CH ₂) ₅		4-OCF ₃	H	H
Y.079	H	CH ₃	4-F	H	H
Y.080	CH ₃	CH ₃	4-F	H	H
Y.081	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-F	H	H
Y.082	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-F	H	H
Y.083	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-F	H	H
Y.084	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-F	H	H
Y.085	H	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H
Y.086	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H
Y.087	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H
Y.088	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H
Y.089	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H
Y.090	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H
Y.091	H	H	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.092	CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.093	CH ₂ CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.094	CH(CH ₃) ₂	H	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.095	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.096	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.097	H	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.098	CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.099	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.100	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.101	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.102	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.103	H	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.104	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.105	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.106	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.107	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.108	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.109	H	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.110	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.111	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.112	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.113	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H	H
Y.114	(CH ₂) ₃		4-p-Cl-fenila	H	H
Y.115	(CH ₂) ₄		4-p-Cl-fenila	H	H
Y.116	(CH ₂) ₅		4-p-Cl-fenila	H	H
Y.117	H	H	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.118	CH ₃	H	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.119	CH ₂ CH ₃	H	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.120	CH(CH ₃) ₂	H	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.121	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.122	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.123	H	CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.124	CH ₃	CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.125	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.126	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.127	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.128	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.129	H	CH ₂ CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.130	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.131	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.132	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.133	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.134	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.135	H	CH(CH ₃) ₂	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.136	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.137	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.138	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.139	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.140	(CH ₂) ₃		4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.141	(CH ₂) ₄		4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.142	(CH ₂) ₅		4-C≡CC(CH ₃) ₃	H	H
Y.143	H	H	4-Cl	2-Cl	H
Y.144	CH ₃	H	4-Cl	2-Cl	H
Y.145	CH ₂ CH ₃	H	4-Cl	2-Cl	H
Y.146	CH(CH ₃) ₂	H	4-Cl	2-Cl	H
Y.147	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-Cl	2-Cl	H
Y.148	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-Cl	2-Cl	H
Y.149	H	CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.150	CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.151	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.152	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.153	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.154	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.155	H	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-Cl	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.156	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.157	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.158	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.159	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.160	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-Cl	H
Y.161	H	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-Cl	H
Y.162	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-Cl	H
Y.163	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-Cl	H
Y.164	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-Cl	H
Y.165	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-Cl	H
Y.166	(CH ₂) ₃		4-Cl	2-Cl	H
Y.167	(CH ₂) ₄		4-Cl	2-Cl	H
Y.168	(CH ₂) ₅		4-Cl	2-Cl	H
Y.169	H	H	4-F	2-F	H
Y.170	CH ₃	H	4-F	2-F	H
Y.171	CH ₂ CH ₃	H	4-F	2-F	H
Y.172	CH(CH ₃) ₂	H	4-F	2-F	H
Y.173	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-F	2-F	H
Y.174	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-F	2-F	H
Y.175	H	CH ₃	4-F	2-F	H
Y.176	CH ₃	CH ₃	4-F	2-F	H
Y.177	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-F	2-F	H
Y.178	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-F	2-F	H
Y.179	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-F	2-F	H
Y.180	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-F	2-F	H
Y.181	H	CH ₂ CH ₃	4-F	2-F	H

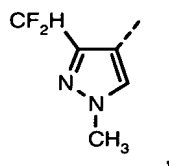
Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.182	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	2-F	H
Y.183	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	2-F	H
Y.184	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-F	2-F	H
Y.185	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	2-F	H
Y.186	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	2-F	H
Y.187	H	CH(CH ₃) ₂	4-F	2-F	H
Y.188	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-F	2-F	H
Y.189	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-F	2-F	H
Y.190	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-F	2-F	H
Y.191	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-F	2-F	H
Y.192	(CH ₂) ₃		4-F	2-F	H
Y.193	(CH ₂) ₄		4-F	2-F	H
Y.194	(CH ₂) ₅		4-F	2-F	H
Y.195	H	H	4-Cl	2-F	H
Y.196	CH ₃	H	4-Cl	2-F	H
Y.197	CH ₂ CH ₃	H	4-Cl	2-F	H
Y.198	CH(CH ₃) ₂	H	4-Cl	2-F	H
Y.199	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-Cl	2-F	H
Y.200	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	4-Cl	2-F	H
Y.201	H	CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.202	CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.203	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.204	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.205	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.206	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.207	H	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-F	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.208	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.209	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.210	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.211	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.212	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	2-F	H
Y.213	H	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-F	H
Y.214	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-F	H
Y.215	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-F	H
Y.216	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-F	H
Y.217	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	2-F	H
Y.218	(CH ₂) ₃		4-Cl	2-F	H
Y.219	(CH ₂) ₄		4-Cl	2-F	H
Y.220	(CH ₂) ₅		4-Cl	2-F	H
Y.221	H	H	2-Cl	4-F	H
Y.222	CH ₃	H	2-Cl	4-F	H
Y.223	CH ₂ CH ₃	H	2-Cl	4-F	H
Y.224	CH(CH ₃) ₂	H	2-Cl	4-F	H
Y.225	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	2-Cl	4-F	H
Y.226	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	2-Cl	4-F	H
Y.227	H	CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.228	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.229	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.230	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.231	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.232	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.233	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H

Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.234	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.235	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.236	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.237	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.238	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H
Y.239	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-F	H
Y.240	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-F	H
Y.241	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-F	H
Y.242	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-F	H
Y.243	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-F	H
Y.244	(CH ₂) ₃		2-Cl	4-F	H
Y.245	(CH ₂) ₄		2-Cl	4-F	H
Y.246	(CH ₂) ₅		2-Cl	4-F	H
Y.247	H	H	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.248	CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.249	CH ₂ CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.250	CH(CH ₃) ₂	H	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.251	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.252	H	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.253	CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.254	CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.255	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.256	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl	H
Y.257	H	H	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.258	CH ₃	H	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.259	CH ₂ CH ₃	H	2-Cl	4-Cl	6-Cl

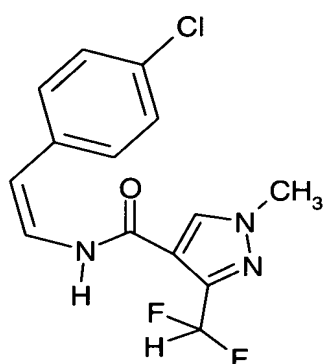
Comp. N°	R ₁	R ₂	R _{7a}	R _{7b}	R _{7c}
Y.260	CH(CH ₃) ₂	H	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.261	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.262	(CH ₂) ₃ CH ₃	H	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.263	H	CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.264	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.265	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.266	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.267	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.268	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.269	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.270	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.271	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.272	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.273	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.274	(CH ₂) ₃ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.275	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.276	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.277	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.278	CH(CH ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.279	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.280	(CH ₂) ₃		2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.281	(CH ₂) ₄		2-Cl	4-Cl	6-Cl
Y.282	(CH ₂) ₅		2-Cl	4-Cl	6-Cl

A Tabela 1 fornece 282 compostos da fórmula (IA), em que A é

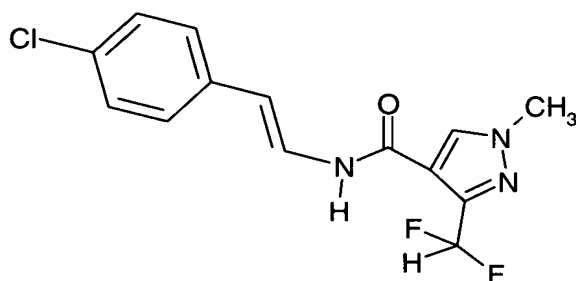


em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e R_1 , R_2 , R_{7a} , R_{7b} e R_{7c} são como definidos na Tabela Y. Por exemplo, o composto 1.001 ocorre nas formas Z e E ou em misturas destas. Composto 1.001 (forma Z) e composto 1.001 (forma E) têm a seguinte estrutura:

5



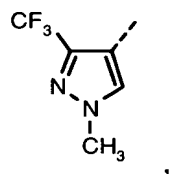
1.001 (Forma Z)



1.001 (Forma E)

Forma E.

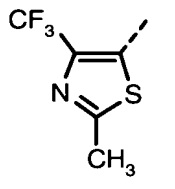
A Tabela 2 fornece 282 compostos da fórmula (IA) em que A é



em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e R_1 , R_2 , R_{7a} , R_{7b} e R_{7c} são como definidos na Tabela Y.

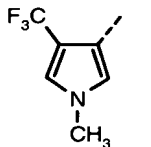
10

A Tabela 3 fornece 282 compostos da fórmula (IA) em que A é



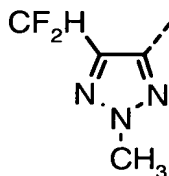
em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e R_1 , R_2 , R_{7a} , R_{7b} e R_{7c} são como definidos na Tabela Y.

A Tabela 4 fornece 282 compostos da fórmula (IA) em que A é



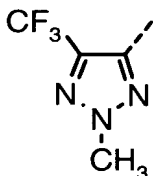
em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e R_1 , R_2 , R_{7a} , R_{7b} e R_{7c} são como definidos na Tabela Y.

A Tabela 5 fornece 282 compostos da fórmula (IA) em que A é



5 em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e R_1 , R_2 , R_{7a} , R_{7b} e R_{7c} são como definidos na Tabela Y.

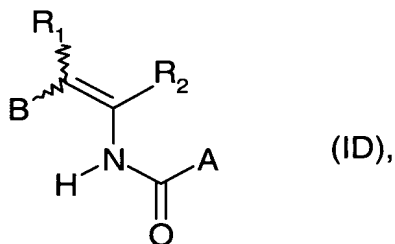
A Tabela 6 fornece 282 compostos da fórmula (IA) em que A é



em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e R_1 , R_2 , R_{7a} , R_{7b} e R_{7c} são como definidos na Tabela Y.

Tabelas 7 a 12: Compostos da fórmula ID

10 A invenção é também ilustrada pelos compostos individuais preferidos da fórmula ID listada abaixo nas Tabelas 7 a 12. Dados de caracterização são fornecidos na Tabela 13.

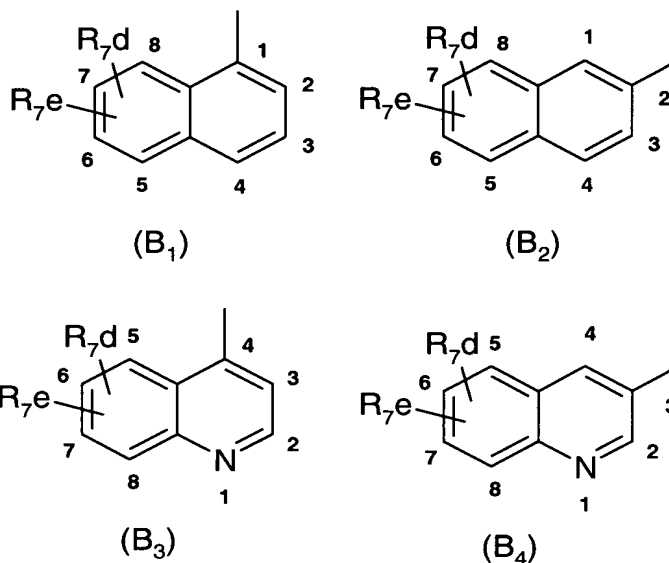


15 Cada das Tabelas 7 a 12, que segue a Tabela W abaixo, compreende 288 compostos da fórmula ID em que B, R_1 e R_2 têm os valores fornecidos na Tabela W e A tem o valor fornecido nas Tabelas pertinentes 7 a 12. Desse modo a Tabela 7 corresponde à Tabela W quando W for 7 e A tiver o valor fornecido no cabeçalho da Tabela 7, a Tabela 8 corresponde à

Tabela W quando W for 8 e A tiver o valor fornecido no cabeçalho da Tabela 8, e assim por diante para as Tabelas 9 a 12. Como é descrito para compostos da fórmula IC, também cada composto da fórmula ID ocorre em formas isoméricas diferentes.

5 Tabela W:

Na Tabela W o grupo B significa o grupo B₁, B₂, B₃ ou B₄:



Composto nº	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.001	B ₁	H	H	2-Cl	H
W.002	B ₁	H	CH ₃	2-Cl	H
W.003	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.004	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.005	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	H
W.006	B ₁	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H
W.007	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.008	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.009	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	H
W.010	B ₁	H	H	4-Cl	H
W.011	B ₁	H	CH ₃	4-Cl	H
W.012	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.013	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.014	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H
W.015	B ₁	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
W.016	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.017	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.018	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H
W.019	B ₁	H	H	5-Cl	H
W.020	B ₁	H	CH ₃	5-Cl	H
W.021	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.022	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.023	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	5-Cl	H
W.024	B ₁	CH ₃	CH ₃	5-Cl	H
W.025	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.026	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.027	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	5-Cl	H
W.028	B ₁	H	H	6-Cl	H
W.029	B ₁	H	CH ₃	6-Cl	H
W.030	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.031	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.032	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	6-Cl	H
W.033	B ₁	CH ₃	CH ₃	6-Cl	H
W.034	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.035	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.036	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-Cl	H
W.037	B ₁	H	H	8-Cl	H
W.038	B ₁	H	CH ₃	8-Cl	H
W.039	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	8-Cl	H

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.040	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.041	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	8-Cl	H
W.042	B ₁	CH ₃	CH ₃	8-Cl	H
W.043	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.044	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.045	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	8-Cl	H
W.046	B ₁	H	H	4-p-Cl-fenila	H
W.047	B ₁	H	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H
W.048	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H
W.049	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H
W.050	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H
W.051	B ₁	CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	H
W.052	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H
W.053	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	H
W.054	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	H
W.055	B ₁	H	H	8-p-Cl-fenila	H
W.056	B ₁	H	CH ₃	8-p-Cl-fenila	H
W.057	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	H
W.058	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	H
W.059	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	8-p-Cl-fenila	H
W.060	B ₁	CH ₃	CH ₃	8-p-Cl-fenila	H
W.061	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	H
W.062	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	H
W.063	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	8-p-Cl-fenila	H
W.064	B ₁	H	H	2-Cl	4-Cl
W.065	B ₁	H	CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.066	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.067	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.068	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl
W.069	B ₁	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.070	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.071	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.072	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl
W.073	B ₁	H	H	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.074	B ₁	H	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.075	B ₁	H	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.076	B ₁	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.077	B ₁	H	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.078	B ₁	CH ₃	CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.079	B ₁	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.080	B ₁	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.081	B ₁	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-p-Cl-fenila	2-Cl
W.082	B ₂	H	H	6-Cl	H
W.083	B ₂	H	CH ₃	6-Cl	H
W.084	B ₂	H	CH ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.085	B ₂	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.086	B ₂	H	CH(CH ₃) ₂	6-Cl	H
W.087	B ₂	CH ₃	CH ₃	6-Cl	H
W.088	B ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.089	B ₂	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.090	B ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-Cl	H
W.091	B ₂	H	H	6-CF ₃	H
W.092	B ₂	H	CH ₃	6-CF ₃	H
W.093	B ₂	H	CH ₂ CH ₃	6-CF ₃	H

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.094	B ₂	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
W.095	B ₂	H	CH(CH ₃) ₂	6-CF ₃	H
W.096	B ₂	CH ₃	CH ₃	6-CF ₃	H
W.097	B ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
W.098	B ₂	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
W.099	B ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-CF ₃	H
W.100	B ₂	H	H	6-OCF ₃	H
W.101	B ₂	H	CH ₃	6-OCF ₃	H
W.102	B ₂	H	CH ₂ CH ₃	6-OCF ₃	H
W.103	B ₂	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-OCF ₃	H
W.104	B ₂	H	CH(CH ₃) ₂	6-OCF ₃	H
W.105	B ₂	CH ₃	CH ₃	6-OCF ₃	H
W.106	B ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-OCF ₃	H
W.107	B ₂	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-OCF ₃	H
W.108	B ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-OCF ₃	H
W.109	B ₂	H	H	6-p-Cl-fenila	H
W.110	B ₂	H	CH ₃	6-p-Cl-fenila	H
W.111	B ₂	H	CH ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	H
W.112	B ₂	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	H
W.113	B ₂	H	CH(CH ₃) ₂	6-p-Cl-fenila	H
W.114	B ₂	CH ₃	CH ₃	6-p-Cl-fenila	H
W.115	B ₂	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	H
W.116	B ₂	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	H
W.117	B ₂	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-p-Cl-fenila	H
W.118	B ₃	H	H	2-Cl	H
W.119	B ₃	H	CH ₃	2-Cl	H
W.120	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.121	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.122	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	H
W.123	B ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H
W.124	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.125	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.126	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	H
W.127	B ₃	H	H	3-Cl	H
W.128	B ₃	H	CH ₃	3-Cl	H
W.129	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	3-Cl	H
W.130	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	3-Cl	H
W.131	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	3-Cl	H
W.132	B ₃	CH ₃	CH ₃	3-Cl	H
W.133	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	3-Cl	H
W.134	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	3-Cl	H
W.135	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	3-Cl	H
W.136	B ₃	H	H	5-Cl	H
W.137	B ₃	H	CH ₃	5-Cl	H
W.138	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.139	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.140	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	5-Cl	H
W.141	B ₃	CH ₃	CH ₃	5-Cl	H
W.142	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.143	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.144	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	5-Cl	H
W.145	B ₃	H	H	6-Cl	H
W.146	B ₃	H	CH ₃	6-Cl	H
W.147	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	6-Cl	H

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.148	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.149	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	6-Cl	H
W.150	B ₃	CH ₃	CH ₃	6-Cl	H
W.151	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.152	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-Cl	H
W.153	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-Cl	H
W.154	B ₃	H	H	8-Cl	H
W.155	B ₃	H	CH ₃	8-Cl	H
W.156	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.157	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.158	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	8-Cl	H
W.159	B ₃	CH ₃	CH ₃	8-Cl	H
W.160	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.161	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.162	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	8-Cl	H
W.163	B ₃	H	H	2-Cl	5-Cl
W.164	B ₃	H	CH ₃	2-Cl	5-Cl
W.165	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	5-Cl
W.166	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	5-Cl
W.167	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	5-Cl
W.168	B ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	5-Cl
W.169	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	5-Cl
W.170	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	5-Cl
W.171	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	5-Cl
W.172	B ₃	H	H	2-Cl	6-Cl
W.173	B ₃	H	CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.174	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl

Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.175	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.176	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	6-Cl
W.177	B ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.178	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.179	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.180	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	6-Cl
W.181	B ₃	H	H	2-Cl	8-Cl
W.182	B ₃	H	CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.183	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.184	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.185	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	8-Cl
W.186	B ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.187	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.188	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.189	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	8-Cl
W.190	B ₃	H	H	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.191	B ₃	H	CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.192	B ₃	H	CH ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.193	B ₃	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.194	B ₃	H	CH(CH ₃) ₂	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.195	B ₃	CH ₃	CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.196	B ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.197	B ₃	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.198	B ₃	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.199	B ₄	H	H	2-Cl	H
W.200	B ₄	H	CH ₃	2-Cl	H
W.201	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H

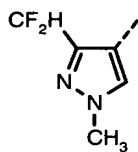
Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.202	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.203	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	H
W.204	B ₄	CH ₃	CH ₃	2-Cl	H
W.205	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.206	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	H
W.207	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	H
W.208	B ₄	H	H	4-Cl	H
W.209	B ₄	H	CH ₃	4-Cl	H
W.210	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.211	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.212	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H
W.213	B ₄	CH ₃	CH ₃	4-Cl	H
W.214	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.215	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	4-Cl	H
W.216	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	4-Cl	H
W.217	B ₄	H	H	5-Cl	H
W.218	B ₄	H	CH ₃	5-Cl	H
W.219	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.220	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.221	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	5-Cl	H
W.222	B ₄	CH ₃	CH ₃	5-Cl	H
W.223	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.224	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	5-Cl	H
W.225	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	5-Cl	H
W.226	B ₄	H	H	7-Cl	H
W.227	B ₄	H	CH ₃	7-Cl	H
W.228	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	7-Cl	H

Composto nº	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.229	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	7-Cl	H
W.230	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	7-Cl	H
W.231	B ₄	CH ₃	CH ₃	7-Cl	H
W.232	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	7-Cl	H
W.233	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	7-Cl	H
W.234	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	7-Cl	H
W.235	B ₄	H	H	8-Cl	H
W.236	B ₄	H	CH ₃	8-Cl	H
W.237	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.238	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.239	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	8-Cl	H
W.240	B ₄	CH ₃	CH ₃	8-Cl	H
W.241	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.242	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-Cl	H
W.243	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	8-Cl	H
W.244	B ₄	H	H	2-Cl	4-Cl
W.245	B ₄	H	CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.246	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.247	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.248	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl
W.249	B ₄	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.250	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.251	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl
W.252	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	4-Cl
W.253	B ₄	H	H	2-Cl	6-Cl
W.254	B ₄	H	CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.255	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl

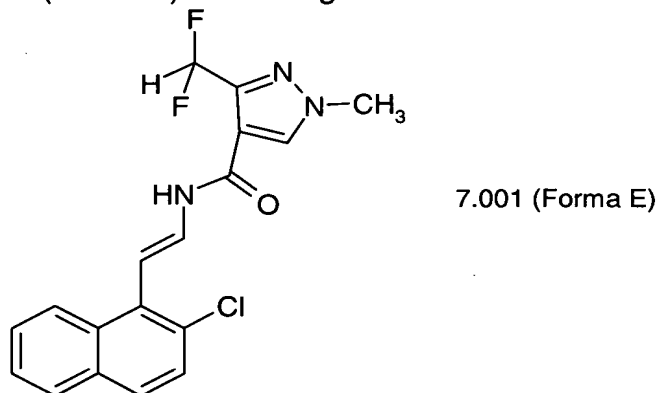
Composto n°	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.256	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.257	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	6-Cl
W.258	B ₄	CH ₃	CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.259	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.260	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	6-Cl
W.261	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	6-Cl
W.262	B ₄	H	H	2-Cl	8-Cl
W.263	B ₄	H	CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.264	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.265	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.266	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	8-Cl
W.267	B ₄	CH ₃	CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.268	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.269	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	2-Cl	8-Cl
W.270	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	2-Cl	8-Cl
W.271	B ₄	H	H	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.272	B ₄	H	CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.273	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.274	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.275	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.276	B ₄	CH ₃	CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.277	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.278	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.279	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	6-p-Cl-fenila	2-Cl
W.280	B ₄	H	H	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.281	B ₄	H	CH ₃	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.282	B ₄	H	CH ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	2-Cl

Composto nº	B	R ₁	R ₂	R _{7d}	R _{7e}
W.283	B ₄	H	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.284	B ₄	H	CH(CH ₃) ₂	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.285	B ₄	CH ₃	CH ₃	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.286	B ₄	CH ₃	CH ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.287	B ₄	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	8-p-Cl-fenila	2-Cl
W.288	B ₄	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	8-p-Cl-fenila	2-Cl

A Tabela 7 fornece 288 compostos da fórmula (IB), em que A é

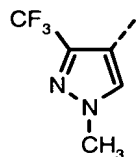


em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e B, R₁, R₂, R_{7d} e R_{7e} são como definidos na Tabela W. Por exemplo, o composto 7.001 (forma E) tem a seguinte estrutura:



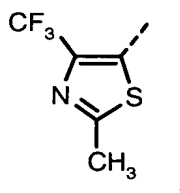
5

A Tabela 8 fornece 288 compostos da fórmula (IB) em que A é



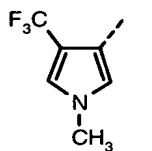
em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e B, R₁, R₂, R_{7d} e R_{7e} são como definidos na Tabela W.

A Tabela 9 fornece 288 compostos da fórmula (IB) em que A é



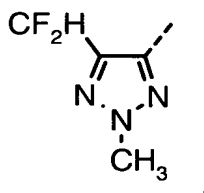
em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e B, R₁, R₂, R_{7d} e R_{7e} são como definidos na Tabela W.

A Tabela 10 fornece 288 compostos da fórmula (IB) em que A é



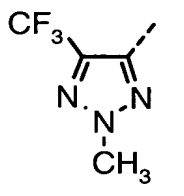
em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e B, R₁, R₂, R_{7d} e R_{7e} são como definidos na Tabela W.

A Tabela 11 fornece 288 compostos da fórmula (IB) em que A é



em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e B, R₁, R₂, R_{7d} e R_{7e} são como definidos na Tabela W.

A Tabela 12 fornece 288 compostos da fórmula (IB) em que A é



em que as linhas tracejadas indicam o ponto de ligação do grupo A ao grupo amida, e B, R₁, R₂, R_{7d} e R_{7e} são como definidos na Tabela W.

Tabela 13: Dados de caracterização

A Tabela 13 mostra ponto de fusão selecionado e dados de RMN selecionados para os compostos das Tabelas 1 a 12. CDCl₃ foi utilizado como o solvente para medidas de RMN, a menos que de outra maneira estabelecido. Se uma mistura de solventes estiver presente, isto será indicado como, por exemplo: CDCl₃/d₆-DMSO). Nenhuma tentativa é feita para listar todos os dados de caracterização em todos os casos.

Na Tabela 12 e em toda a descrição que segue, temperaturas são fornecidas em graus Celsius; "RMN" significa espectro de ressonância magnética nuclear; MS significa espectro de massa; "%" é porcentagem em peso, a menos que concentrações correspondentes sejam indicadas em outras unidades. As seguintes abreviações são utilizadas em toda esta descrição:

p.f. =	ponto de fusão	b.p. =	ponto de ebulição.
S =	singleto	br =	amplo
d =	duplete	dd =	Dupleto de dupletos
t =	triplete	q =	quarteto
m =	multiplete	ppm =	partes por milhão

Comp. Nº.	Dados de 1H-RMN: ppm (multiplicidade/número de Hs)	MS [M+H] ⁺	ponto de fusão de (°C)
1.007 (forma E)	2,12 (d, 3H), 3,93 (s, 3H), 6,85 (t, 1H, CHF ₂ , J = 55 Hz), 7,18 (m, 2H), 7,30 (m, 2H), 7,30 (s, 1H), 7,49 (s, 1H, NH), 7,97 (s, 1H).	326/328	resina
1.007 (forma Z)	2,34 (d, 3H), 3,98 (s, 3H), 5,83 (s, 1H), 6,83 (t, 1H), 7,19 (m, 2H), 7,26 (m, 2H), 7,64 (s, 1H, NH), 7,84 (s, 1H).	326/328	resina
1.024			103 - 105
1.025			136 - 137
1.079 (forma E)	2,10 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 6,85 (t, 1H), 7,00 (m, 2H), 7,15 - 7,22 (m, 3H), 7,50 (br s, 1H), 7,97 (s, 1H).	310	resina
1.079 (forma Z)	2,34 (d, 3H), 3,92 (s, 3H), 5,85 (s, 1H), 6,77 (t, 1H), 7,00 (m, 2H), 7,25 (m, 2H), 7,62 (s, 1H, NH), 7,85 (s, 1H).	310	resina

1.149 (forma E)	2,03 (s, 3H), 3,95 (s, 3H), 6,85 (t, 1H), 7,25 (m, 3H), 7,41 (s, 1H), 7,52 (br s, 1H), 7,99 (s, 1H).	360/362/364	resina
1.149 (forma Z)	2,39 (d, 3H), 3,97 (s, 3H), 5,84 (s, 1H), 6,73 (t, 1H), 7,17(dxd, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,48 (br s, 1H), 7,84 (s, 1H).	360/362/364	resina
2.025			145 - 148
2.079 (forma E)	2,12 (s, 3H), 4,00 (s, 3H), 7,12 (br s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,02 (m, 2H), 7,17 - 7,25 (m, 3H).	328	140
2.079 (forma Z)	2,35 (s, 3H), 3,97 (s, 3H), 5,85 (s, 1H), 7,02 (m, 2H), 7,22 (m, 2H), 7,37 (br s, 1H), 7,87 (s, 1H).	328	125

EXEMPLOS DE FORMULAÇÃO PARA COMPOSTOS DA FÓRMULA I:

Exemplo F-1.1 a F-1.3: Concentrados Emulsificáveis

Componentes	F-1.1	F-1.2	F-1.3
5 Composto de Tabelas 1 a 12	25%	40%	50%
Dodecilbenzenossulfonato de cálcio	5%	8%	6%
Éter de polietileno glicol de óleo de rícino (unidades de etilenóxi de 36 moles)	50%	-	-
10 Éter de tributilfenolpolietileno glicol (30 moles de unidades de etilenóxi)	-	12%	4%
cicloexanona	-	15%	20%
mistura de xileno	65%	25%	20%

15 Emulsões de qualquer concentração desejada podem ser preparadas diluindo-se tais concentrados com água.

Exemplo F-2: Concentrado emulsificável

Componentes	F-2
Compostos de Tabelas 1 a 12	10%
5 Éter de octilfenolpolietileno glicol (unidades de etilenóxi 4 a 5 moles)	3%
Éter de poliglicol de óleo de rícino de dodecilbenzenossulfonato de cálcio	3%
(unidades de etilenóxi de 36 moles)	4%
10 cicloexanona	30%
mistura de xileno	50%

Emulsões de qualquer concentração desejada podem ser preparadas diluindo-se tais concentrados com água.

15 Exemplos F-3,1 a F-3,4: Soluções

Componentes	F-3.1	F-3.2	F-3.3	F-3.4
composto de Tabelas 1 a 12	80%	10%	5%	95%
20 éter monometílico de propileno glicol	20%	-	-	-
polietileno glicol (massa molecular relativa: 400 unidades de massa atômica	-	70%	-	-
N-metilpirrolid-2-ona	-	20%	-	-
óleo de coco epoxidado	-	-	1%	5%
25 benzina (faixa de ebulição: 160 - 190°C)	-	-	94%	-

As soluções são adequadas para uso na forma de microgotas.

Exemplos F-4.1 a F-4.4: Granulados

Componentes	F-4.1	F-4.2	F-4.3	F-4.4
30 composto de Tabelas 1 a 12	5%	10%	8%	21%

caulim	94%	-	79%	54%
ácido silícico altamente disperso	1%	-	13%	7%
atapulgita	-	90%	-	18%

5 O novo composto é dissolvido em diclorometano, a solução é vaporizada sobre o veículo e o solvente é em seguida removido por destilação sob vácuo.

Exemplos F-5.1 e F-5.2: Pós

10	Componentes	F-5.1	F-5.2
	composto de Tabelas 1 a 12	2%	5%
	ácido silícico altamente disperso	1%	5%
	talco	97%	-
15	caulim -	90%	

Pós pronto para o uso são obtidos intimamente misturando-se todos os componentes.

Exemplos F-6.1 a F-6.3: Pós umectáveis

20	Componentes	F-6.1	F-6.2	F-6.3
	composto de Tabelas 1 a 12	25%	50%	75%
	sulfonato de lignina de sódio	5%	5%	-
25	sulfato de laurila de sódio	3%	-	5%
	sulfonato de diisobutilnaftaleno de sódio - éter de octilfenolpolietileno glicol (7 a 8 moles de unidades de etilenóxi)	6%	10%	
	ácido silícico altamente disperso	5%	10%	10%
30	caulim	62%	27%	-

Todos os componentes são misturados e a mistura é totalmente

moída em um moinho adequado para fornecer pós umectáveis que podem ser diluídos com água para suspensões de qualquer concentração desejada.

Exemplo F7: Concentrado fluível para tratamento de semente

composto de Tabelas 1 a 12	40 %
propileno glicol	5 %
copolímero de butanol PO/EO	2 %
tristirenofenol com 10-20 moles EO	2 %
1,2-benzisotiazolin-3-ona (na forma de uma solução a 20% em água)	0,5 %
sal de cálcio de pigmento monoazo	5 %
óleo de silicone (na forma de uma emulsão a 75 % em água)	0,2 %
Água	45,3 %

O ingrediente ativo finamente moído é intimamente misturado com os adjuvantes, fornecendo um concentrado de suspensão, do qual suspensões de qualquer diluição desejada podem ser obtidas por diluição com água. Utilizando-se tais diluições, plantas vivas bem como material de propagação de planta podem ser tratados e protegidos contra infestação por microorganismo os, por vaporização, derramamento ou imersão.

10 EXEMPLOS BIOLÓGICOS: AÇÕES FUNGICIDAS

Exemplo B-1: Ação contra *Podosphaera leucotricha*/maçã (mofo pulverulento em maçã)

Mudass de maçã com 5 semanas de idade cv. McIntosh são tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em uma câmara de *spray*. Um dia após a aplicação plantas de maçã são inoculadas sacudindo as plantas infectadas com mofo pulverulento de maçã em cima das plantas de teste. Após um período de incubação de 12 dias a 22°C e 60% r.h. sob um regime de luz de 14/10 horas (luz/escuro) a incidência da doença é avaliada. Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 15 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 20 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-2: Ação contra *Venturia inaequalis*/maçã (Crosta em maçã)

Muda de maçã com 4 semanas de idade cv. McIntosh são tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em uma câmara de *spray*. Um dia após a aplicação plantas de maçã são inoculadas vaporizando-se uma suspensão de esporo (4×10^5 conídios/ml) sobre as plantas teste. Após um período de incubação de 4 dias a 21°C e 95% r.h. as plantas são colocadas durante 4 dias a 21°C e 60% r.h. em uma estufa. Após outro período de incubação de 4 dias a 21°C e 95% r.h. a incidência da doença é avaliada. Os Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-3: Ação contra *Erysife graminis*/cevada (Mofo pulverulento em cevada)

Plantas de cevada com 1 semana de idade cv. expressa são tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em uma câmara de *spray*. Um dia após a aplicação plantas de cevada são inoculadas agitando-se as plantas infectadas com mofo pulverulento em cima das plantas de teste. Após um período de incubação de 6 dias a 20°C/18°C (dia/noite) e 60% r. h. em uma estufa a incidência da doença é avaliada. Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-4: Ação contra *Botrytis cinerea*/maçã (Botrytis em frutos de maçã)

Em um fruto de maçã cv. Golden Delicious 3 orifícios são drenados e cada um carregado com gotículas de 30 µl do composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%). Duas horas após a aplicação de 50 µl de uma suspensão de esporo de *B. cinerea* (4×10^5 conídios/ml) são pipetados sobre os sítios de aplicação. Após um período de incubação de 7 dias a 22°C em uma câmara de crescimento a incidência da doença é avaliada. Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E),

1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-5: Ação contra *Botrytis cinerea*/grape (Botrytis on grapes)

Mudas de videira com 5 semanas de idade cv. Gutedel são tra-
 5 tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em
 uma câmara de *spray*. Dois dias após a aplicação as plantas de videira são
 inoculadas vaporizando-se uma suspensão de esporo (1×10^6 conídios/ml) so-
 bre as plantas de teste. Após um período de incubação de 4 dias a 21°C e
 95% r.h. em uma estufa a incidência da doença é avaliada. Compostos
 10 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (for-
 ma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079
 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-6: Ação contra *Botrytis cinerea*/tomate (Botrytis em tomates)

Plantas de tomate com 4 semanas de idade cv. *Roter Gnom* são
 15 tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em
 uma câmara de *spray*. Dois dias após a aplicação as plantas de tomate são
 inoculadas vaporizando-se uma suspensão de esporo (1×10^5 conídios/ml) so-
 bre as plantas teste. Após um período de incubação de 4 dias a 20°C e 95%
 r.h. em uma câmara de crescimento a incidência da doença é avaliada.
 20 Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E),
 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e
 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-7: Ação contra *Pyrenophora teres*/cevada (Pústula de líquido em cevada)

25 Plantas de cevada com 1 semana de idade cv. expressa são
 tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em
 uma câmara de *spray*. Dois dias após a aplicação as plantas de cevada são
 inoculadas vaporizando-se uma suspensão de esporo (3×10^4 conídios/ml) so-
 bre as plantas teste. Após um período de incubação de 2 dias a 20°C e 95%
 30 r.h. as plantas são mantidas durante 2 dias a 20°C e 60% r.h. em uma estu-
 fa. A incidência da doença é avaliada 4 dias após a inoculação. Compostos
 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (for-

ma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

Exemplo B-8: Ação contra *Septoria tritici*/trigo (mancha na folha de *Septoria* em trigo)

5 Plantas de trigo com 2 semanas de idade cv. Riband são tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em uma câmara de *spray*. Um dia após a aplicação, as plantas de trigo são inoculadas vaporizando-se uma suspensão de esporo (10×10^5 conídios/ml) sobre as plantas teste. Após um período de incubação de 1 dia a 23°C e 95% r.h., as
10 plantas são mantidas durante 16 dias a 23°C e 60% r.h. em uma estufa. a incidência da doença é avaliada 18 dias após a inoculação.

Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

15 Exemplo B-9: Ação contra *Uncinula necator*/videira (mofo pulverulento em videira)

Mudas de videira com 5 semanas de idade cv. Gutedel são tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em uma câmara de *spray*. Um dia após a aplicação, as plantas de videira são
20 inoculadas agitando as plantas infectadas com mofo pulverulento de videira em cima das plantas de teste. Após um período de incubação de 7 dias a 26°C e 60% r.h. sob um regime de luz de 14/10 horas (luz/escuro) a incidência da doença é avaliada. Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (for-
25 ma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

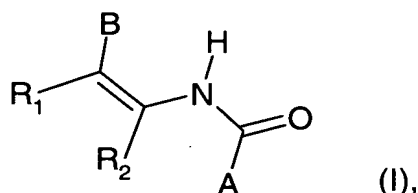
Exemplo B-10: Ação contra *Alternaria solani*/tomato (doenças precose sobre tomates)

Plantas de tomate com 4 semanas de idade cv. Roter Gnom são
30 tratadas com o composto de teste formulado (ingrediente ativo a 0,02%) em uma câmara de *spray*. Dois dias após a aplicação, as plantas de tomate são inoculadas vaporizando-se uma suspensão de esporo (2×10^5 conídios/ml) so-

bre as plantas teste. Após um período de incubação de 3 dias a 20°C e 95% de r.h. em uma câmara de crescimento a incidência da doença é avaliada. Compostos 1.007 (forma-E), 1.007 (forma-Z), 1.024, 1.025, 1.079 (forma-E), 1.079 (forma-Z), 1.149 (forma-E), 1.149 (forma-Z), 2.025, 2.079 (forma-E) e 5 2.079 (forma-Z) mostram boa atividade neste teste (<20% de infestação).

REIVINDICAÇÕES

1. Composto, caracterizado pelo fato de que apresenta da fórmula I

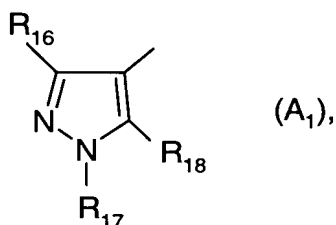


em que

- 5 R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio, nitro, C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃, C₃-C₆cicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃ ou C₂-C₆alquinila, que é não-
- 10 substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₃;
- cada R₃ independentemente um do outro significam halogênio, nitro, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenoalcóxi, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-C₆halogenoalquiltio, -C(H)=N(O-C₁-C₆alquil) ou -C(C₁-C₆alquil)=N(O-C₁-C₆alquil);
- 15 ou R₁ e R₂ juntamente com os átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que 1, 2 ou 3 átomos de carbono do referido anel podem ser substituídos por átomos de oxigênio, átomos de nitrogênio e/ou átomos de enxofre e em que o referido anel é não-substituído ou substituído
- 20 por um ou mais substituintes R₄;
- cada substituinte R₄ independentemente um do outro significa halogênio, nitro, C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅, C₃-C₆cicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅ ou C₂-C₆alquinila, que é não-
- 25 substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₅;
- cada R₅ independentemente um do outro significa halogênio, nitro, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenoalcóxi, C₃-C₆cicloalquila, C₁-C₆alquiltio, C₁-

C₆halogenoalquiltio, $-\text{C}(\text{H})=\text{N}(\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})$ ou $-\text{C}(\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})=\text{N}(\text{O}-\text{C}_1-\text{C}_6\text{alquil})$;

A é A₁



em que

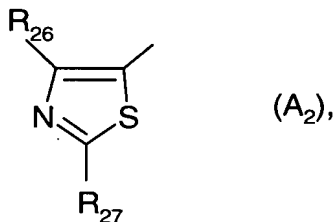
5 R₁₆ é halogenometila;

R₁₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenoalquila, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila; e

R₁₈ é hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenoalquila, C₁-C₄halogenoalcóxi, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-

10 C₄alquila;

Ou A é A₂



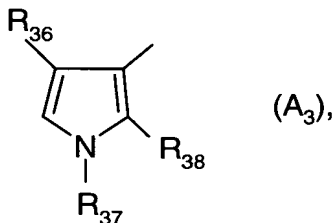
em que

R₂₆ é halogenometila; e

R₂₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenoalquila, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila;

15

ou A é A₃



em que

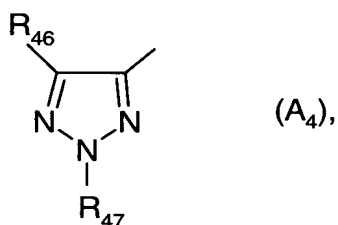
R₃₆ é halogenometila;

R₃₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila; e

R₃₈ é hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄halogenoalcóxi, C₁-C₄alcóxi-C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-

5 C₄alquila;

ou A é A₄



em que

R₄₆ é halogenometila; e

10 R₄₇ é C₁-C₄alquila, C₁-C₄halogenaolquila, C₁-C₄alcóxi- C₁-C₄alquila ou C₁-C₄halogenoalcóxi-C₁-C₄alquila;

B é um grupo fenila, naftila ou quinolinila, que é substituído por um ou mais substituintes R₇;

15 cada substituinte R₇ independentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆haloalcóxi, C₁-C₆haloalquiltio, ciano, nitro, -C(H)=N(O-C₁-C₆alquil), -C(C₁-C₆alquil)=N(O-C₁-C₆alquil), C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₃-C₆cicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₆-C₁₄bicicloalquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈ ou heteroarila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈;

25 cada R₈ é independentemente um do outro halogênio, ciano, nitro, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenoalcóxi, C₁-C₆alquiltio, C₁-C₆halogenoalquiltio, C₃-C₆alquenilóxi, C₃-C₆alquinilóxi, -C(H)=N(O-C₁-C₆alquil) ou -C(C₁-C₆alquil)=N(O-C₁-C₆alquil);

e isômeros e tautômeros destes compostos.

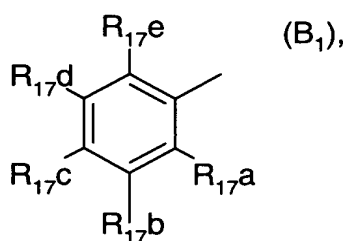
2. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que A é A1.

3. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que B é um grupo fenila, que é substituído por um ou mais substituintes R₇.

4. Composto I de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que cada substituinte R₇ independentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆haloalcóxi, C₁-C₆haloalquiltio, ciano, nitro, -C(H)=N(O-C₁-C₆alquil), -C(C₁-C₆alquil)=N(O-C₁-C₆alquil), C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈ ou C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈.

5. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que A é A1 e B é grupo fenila, que é substituído por um ou mais substituintes R₇ independentemente um do outro significa halogênio, C₁-C₆haloalcóxi, C₁-C₆haloalquiltio, ciano, nitro, -C(H)=N(O-C₁-C₆alquil), -C(C₁-C₆alquil)=N(O-C₁-C₆alquil), C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈, C₂-C₆alquenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈ ou C₂-C₆alquinila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes R₈.

6. Composto de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que B é B₁



em que

R_{17a} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído

ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17b} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17c} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17d} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; R_{17e} é hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₆alquila, C₂-C₆alquinila, C₁-C₆alcóxi, C₁-C₆halogenaolquila, C₁-C₆halogenoalcóxi ou fenila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais halogênios; contanto que pelo menos um de R_{17a}, R_{17b}, R_{17c}, R_{17d} e R_{17e} não seja hidrogênio.

7. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio ou C₁-C₆alquila, que é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, C₁-C₆alcóxi e C₁-C₆halogenoalcóxi; ou R₁ e R₂ juntamente com os átomos de carbono aos quais eles são ligados formam um anel de 5, 6 ou 7 membros, em que o referido anel é parcialmente saturado e em que o referido anel é não-substituído ou substituído por um ou mais substituintes selecionados de halogênio, C₁-C₆alcóxi e C₁-C₆halogenoalcóxi.

8. Composto de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que R₁ e R₂ independentemente um do outro significam hidrogênio, halogênio, ou C₁-C₆alquila.

9. Método de controle ou prevenção de infestação de plantas úteis por microorganismos fitopatogênicos, caracterizado pelo fato de que o Composto de fórmula I de acordo com a reivindicação 1 ou uma composição compreendendo este composto como ingrediente ativo, é aplicado às plantas, à partes destas ou o loco destas.

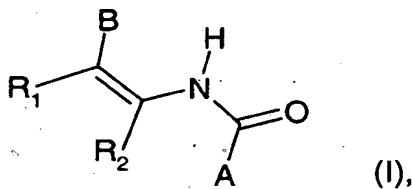
10. Composição para controle e proteção contra microorganismos fitopatogênicos, caracterizada pelo fato de que compreende o composto

de fórmula I como definido na reivindicação 1, e um veículo inerte.

RESUMO

Patente de Invenção: "COMPOSTOS DERIVADOS DE ETENILA CARBO-
XAMIDA ÚTEIS COMO MICROBIOCIDAS, MÉTODO DE CONTROLE OU
PREVENÇÃO DE INFESTAÇÃO DE PLANTAS ÚTEIS POR MICROOR-
GANISMOS FITOPATOGÊNICOS E COMPOSIÇÃO PARA CONTROLE E
5 PREVENÇÃO DOS REFERIDOS MICROORGANISMOS".

Compostos da fórmula I



na qual 1 são adequados para uso como microbiocidas, e na qual A é A₁ ou A é A₂, ou A é A₃ ou A é A₄ e B é um grupo fenila, naftila ou quinolinila.