



REPÚBLICA FEDERATIVA DO BRASIL

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



CARTA PATENTE N.º PI 0317290-2

Patente de Invenção

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

(21) Número do Depósito : PI 0317290-2

(22) Data do Depósito : 01/12/2003

(43) Data da Publicação do Pedido : 01/07/2004

(51) Classificação Internacional : C07D 231/14; C07D 333/38; C07D 327/06; C07D 307/68; C07D 277/20; C07D 213/82; C07D 207/34; A01N 43/02; A01N 43/08; A01N 43/10; A01N 43/18; A01N 43/56

(30) Prioridade Unionista : 13/12/2002 DE 102 58 314.5

(54) Título : BIFENILCARBOXAMIDAS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, MÉTODO E COMPOSIÇÃO PARA CONTROLAR MICROORGANISMOS INDESEJADOS, PROCESSO PARA PREPARAÇÃO DA DITA COMPOSIÇÃO, E DERIVADOS DE ANILINA E DE ÁCIDO BORÔNICO.

(73) Titular : Bayer Cropscience AG, Sociedade Alemã. Endereço: Alfred-Nobel-Strasse 50, 40789 Monheim, Alemanha (DE).

(72) Inventor : Ralf Dunkel. Endereço: Krischer Str. 22,D- 40789 Monheim, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Hans-Ludwig Elbe, Químico(a). Endereço: Dasnöckel 59, D-42329 Wuppertal, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Heiko Rieck. Endereço: 9, Rue Claude Monet, F-69110 Ste. Foy-Les-Lyon, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Ulrike Wachendorff-Neumann, Técnico(a). Endereço: Oberer Markenweg 85, D-56566 Neuwied, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Peter Dahmen. Endereço: Altebrueckerstr. 61, D-41470 Neuss, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Peter Lösel. Endereço: Lohrstr. 90A, 51371 Leverkusen, Alemanha. Cidadania: Britânica.; Karl-Heinz Kuck, Biólogo(a). Endereço: Pastor-Loeh-Strasse 30 A, D-40764 Langenfeld, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Astrid Mauler-Machnik, Engenheira Agrônoma. Endereço: Neuenkamper Weg 46A, D-42799 Leichlingen, Alemanha. Cidadania: Alemã.; Jörg Nico Greul. Endereço: Am Sandberg 30A, 42799 Leichlingen, Alemanha. Cidadania: Alemã.

Prazo de Validade : 10 (dez) anos contados a partir de 01/07/2014, observadas as condições legais.

Expedida em : 1 de Julho de 2014.

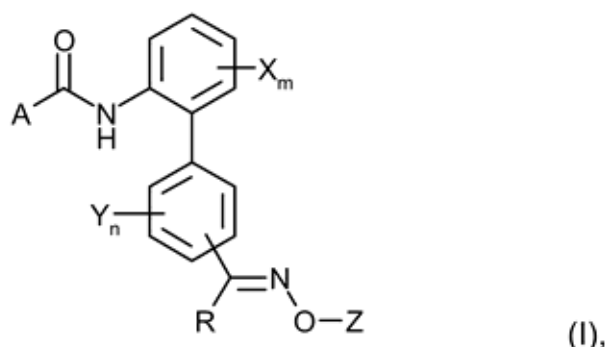
Assinado digitalmente por
Júlio César Castelo Branco Reis Moreira
Diretor de Patentes

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"BIFENIL-CARBOXAMIDAS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, MÉTODO E COMPOSIÇÃO PARA CONTROLAR MICROORGANISMOS INDESEJADOS, PROCESSO PARA PREPARAÇÃO DA DITA COMPOSIÇÃO, E DERIVADOS DE ANILINA E DE ÁCIDO BORÔNICO"**.

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

Já é conhecido que numerosas carboxanilidas têm propriedades fungicidas (comparar WO 93/11 117, WO 99/09 013, WO 00/14 071, EP A 0 545 099 e EP A 0 589 301). Em particular, WO 02/08195 e WO 02/08197 revelam carboxamidas oxiiminometil-substituídas. A atividade destes compostos é boa; porém, às vezes é insatisfatória.

Esta invenção agora fornece novas bifenilcarboxamidas da fórmula (I)



em que

R representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₃-haloalquila tendo em cada caso 1 a 7 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

Z representa C₃-C₈-alquenila, C₃-C₈-alquinila, C₃-C₈-haloalquenila, C₃-C₈-haloalquinila tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou (C₃-C₈-cicloalquil)(C₁-C₄-alquila),

X e Y independentemente um do outro representam halogênio, ciano, nitro, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alcóxi, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₆-haloalquila, C₁-C₆-haloalcóxi ou C₁-C₆-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

m representa 0, 1, 2, 3 ou 4, onde x representa os radicais i-

Segue-se folha 1a

1a

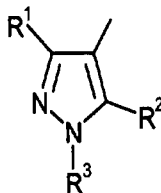
dênticos ou diferentes se m representar 2, 3 ou 4,

n representa 0, 1, 2, 3 ou 4, onde y representa os radicais
idênticos ou diferentes se n representar 2, 3 ou 4,

Segue-se folha 2

e

A representa um radical da fórmula



em que

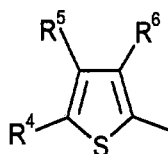
R¹ representa hidrogênio, ciano, halogênio, nitro, C₁-C₄-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, aminocarbonila, aminocarbonil-C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio, e

R² representa hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-alquiltio e

R³ representa hidrogênio, C₁-C₄-alquila, hidróxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, ou representa C₁-C₄-haloalquila, halo(C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquil), halo(C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquil) tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio ou representa fenila,

ou

A representa um radical da fórmula



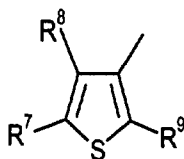
em que

R⁴ e R⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R⁶ representa halogênio, ciano ou C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



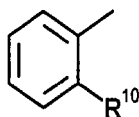
em que

R⁷ e R⁸ independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

5 R⁹ representa hidrogênio, halogênio ou C₁-C₄-alquila,

ou

A representa um radical da fórmula

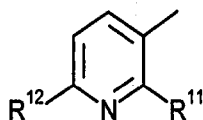


em que

R¹⁰ representa hidrogênio, halogênio, hidroxila, ciano, C₁-C₆-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



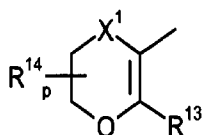
em que

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

R¹² representa hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila ou representa
20 C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



em que

R^{13} representa C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

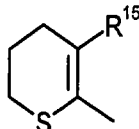
R^{14} representa C_1 - C_4 -alquila,

5 X^1 representa S (enxofre), representa SO, SO₂ ou CH₂ e

p representa 0, 1 ou 2,

ou

A representa um radical da fórmula

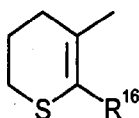


em que

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

ou

A representa um radical da fórmula

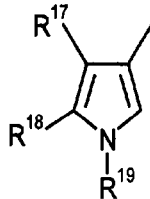


em que

15 R^{16} representa C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



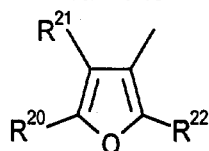
em que

20 R^{17} representa halogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

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

R^{19} representa hidrogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, hidróxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquissulfonila, di(C_1 - C_4 -alquil)aminossulfonila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila ou representa fenilsulfonila opcionalmente substituída ou benzoíla,
ou

A representa um radical da fórmula

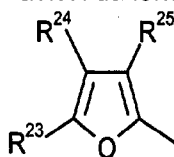


10 em que

R^{20} e R^{21} independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, amino, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

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

A representa um radical da fórmula

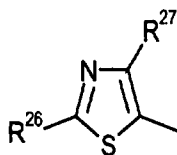


em que

R^{23} e R^{24} independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, amino, nitro, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R^{25} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,
ou

25 A representa um radical da fórmula

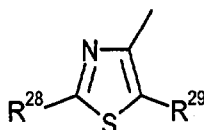


em que

R²⁶ representa hidrogênio, halogênio, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

- 5 R²⁷ representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,
ou

A representa um radical da fórmula



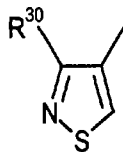
em que

- 10 R²⁸ representa hidrogênio, halogênio, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R²⁹ representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

- 15 ou

A representa um radical da fórmula

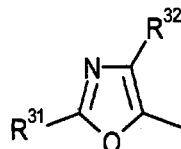


em que

R³⁰ representa halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

- 20 ou

A representa um radical da fórmula



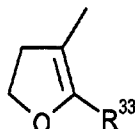
em que

R^{31} representa hidrogênio ou C_1 - C_4 -alquila e

R^{32} representa halogênio ou C_1 - C_4 -alquila,

ou

5 A representa um radical da fórmula

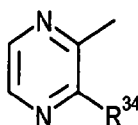


em que

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

ou

10 A representa um radical da fórmula



em que

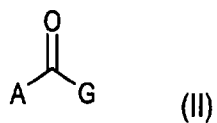
R^{34} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio.

Se apropriado, os compostos de acordo com a invenção podem
15 estar presentes como misturas de possíveis formas isoméricas diferentes, em particular de estereoisômeros, como, por exemplo, E e Z, treo e erito, e também isômeros ópticos, e, se apropriado, também de tautômeros. O que é reivindicado são ambos os isômeros E e Z, e o treo e erito, e também os isômeros ópticos, quaisquer misturas destes isômeros, e também as possí-
20 veis formas tautoméricas.

Em particular com referência à ligação dupla de oxima, isômeros de E/Z ocorrem quando R for C_1 - C_6 -alquila. Estes isômeros estão em geral presentes como uma mistura. A configuração dada abaixo nas fórmulas estruturais inclui sempre ambas as possibilidades. Por causa de simplicidade,
25 apenas um isômero é mostrado em cada caso.

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

a) derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)

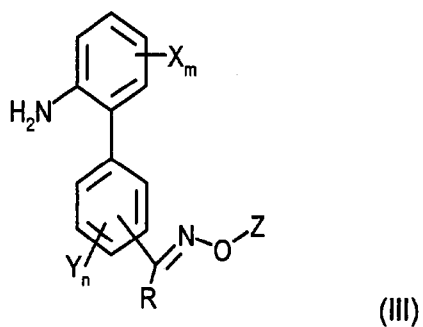


em que

A é como definido acima e

G representa halogênio, hidroxila ou C₁-C₆-alcóxi

5 são reagidos com derivados de anilina da fórmula (III)



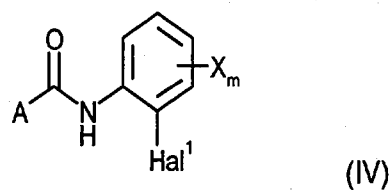
em que

R, Z, X, Y, m e n são como definidos acima,

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

10 ou

b) derivados de carboxamida da fórmula (IV)

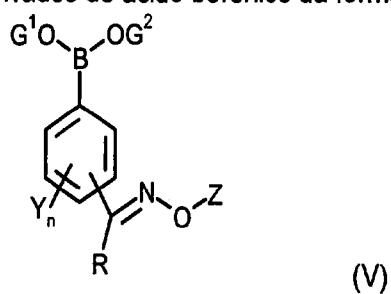


em que

A, X e m são como definidos acima,

Hal¹ representa bromo ou iodo,

15 são reagidos com derivados de ácido borônico da fórmula (V)



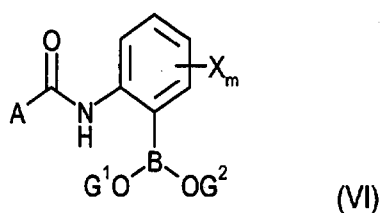
em que

R, Z, Y e n são como definidos acima e

G¹ e G² cada um representa hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno

- 5 na presença de um catalisador, se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na presença de um diluente,
ou

c) derivados de ácido borônico de carboxamida da fórmula (VI)

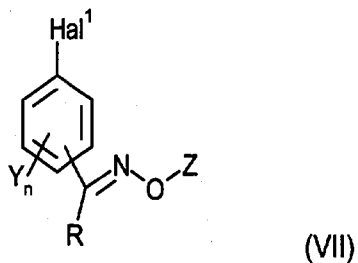


em que

- 10 A, X e m são como definidos acima e

G¹ e G² cada um representa hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno

são reagidos com derivados de oxima de fenila da fórmula (VII)



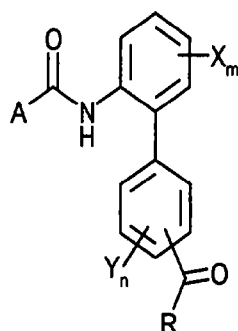
em que

- 15 R, Z, Y e n são como definidos acima,

Hal¹ representa bromo ou iodo,

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

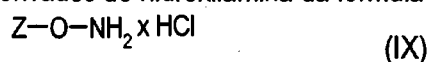
- 20 d) derivados de bifenilacila da fórmula (VIII)



(VIII)

em que

A, R, X, Y, m e n são como definidos acima,
são reagidos com derivados de hidroxilamina da fórmula (IX)

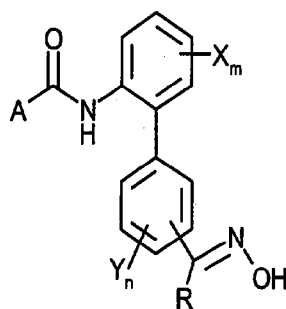


5 em que

Z é como definido acima,
se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na
presença de um diluente,

ou

10 e) derivados de hidroxilimino da fórmula (I-a)



(I-a)

em que

A, R, X, Y, m e n são como definidos acima
são reagidos com compostos da fórmula (X)



15 em que

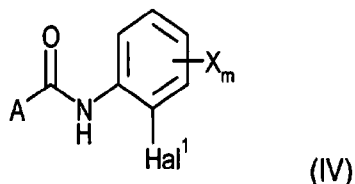
Z é como definido acima,

E representa cloro, bromo, iodo, metanossulfonila ou p-
toluenossulfonila,

se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na
20 presença de um diluente,

ou

f) derivados de carboxamida da fórmula (IV)

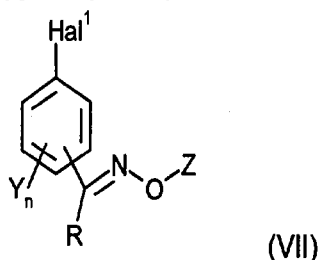


em que

A, X e m são como definidos acima,

5 Hal¹ representa bromo ou iodo,

são reagidos com derivados de oxima de fenila da fórmula (VII)



em que

R, Z, Y e n são como definidos acima,

Hal¹ representa bromo ou iodo

10 na presença de um catalisador de paládio ou platina e na presença de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na presença de um diluente.

15 Por fim, foi descoberto que as novas bifenilcarboxamidas da fórmula (I) têm propriedades microbicidas muito boas e podem ser usadas para controlar microorganismos indesejados tanto na proteção de plantação quanto na proteção de materiais.

20 Surpreendentemente, as bifenilcarboxamidas da fórmula (I) de acordo com a invenção têm atividade fungicida consideravelmente melhor do que a dos compostos ativos constitucionalmente mais similares da técnica anterior tendo a mesma direção de ação.

A fórmula (I) fornece uma definição geral das bifenilcarboxamidas de acordo com a invenção.

R preferivelmente representa hidrogênio, C₁-C₄-alkila ou C₁-

C₃-haloalquila tendo em cada caso 1 a 7 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

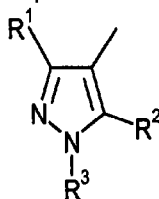
Z preferivelmente representa C₃-C₆-alquenila, C₃-C₆-alquinila, C₃-C₆-haloalquenila, C₃-C₆-haloalquinila tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou (C₃-C₆-cicloalquil)-(C₁-C₄-alquila).

- 5 X e Y independentemente um do outro preferivelmente representam flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₂-haloalquila, C₁-C₂-haloalcóxi ou C₁-C₂-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

- 10 m preferivelmente representa 0, 1, 2 ou 3, onde x representa os radicais idênticos ou diferentes se m representar 2 ou 3.

n preferivelmente representa 0, 1, 2 ou 3, onde y representa os radicais idênticos ou diferentes se n representar 2 ou 3.

A preferivelmente representa um radical da fórmula



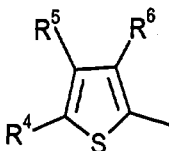
em que

- 15 R¹ representa hidrogênio, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, ciclopropila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, aminocarbonila, aminocarbonilmetila, aminocarboniletila, C₁-C₂-haloalquil C₁-C₂-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, trifluorometiltio ou difluorometiltio,

- 20 R² representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi, metiltio ou etiltio e

R³ representa hidrogênio, metila, etila, n-propila, isopropila, hidroximetila, hidroxietila, ciclopropila, ciclopentila, cicloexila, C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo ou representa fenila.

- 25 A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

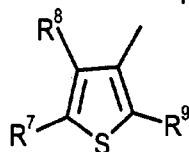


em que

R^4 e R^5 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

- 5 R^6 representa flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, metila, etila, trifluorometila ou C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

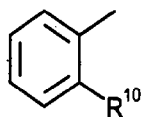


em que

- 10 R^7 e R^8 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^9 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

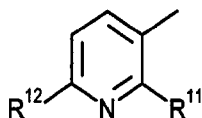
A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



- 15 em que

R^{10} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi, C_1 - C_2 -haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

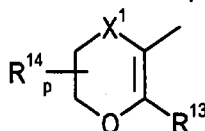


- 20 em que

R^{11} representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, trifluorometiltio, difluorometiltio e

R^{12} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, C_1 - C_2 -alquilsulfinila, C_1 - C_2 -alquilsulfonila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

5 A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

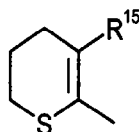
R^{13} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^{14} representa metila ou etila,

10 X^1 representa S (enxofre), representa SO, SO_2 ou CH_2 e

p representa 0, 1 ou 2.

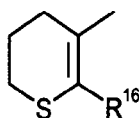
A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

15 R^{15} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

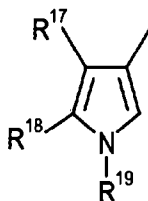
A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

R^{16} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

20 A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



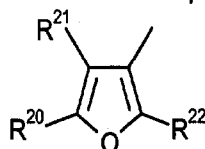
em que

R^{17} representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, isopropila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

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

R^{19} representa hidrogênio, metila, etila, C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C_1 - C_2 -alcóxi- C_1 - C_2 -alquila, hidroximetila, hidroxietila, metilsulfonila ou dimetilaminossulfonila.

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

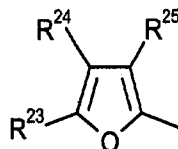


10 em que

R^{20} e R^{21} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

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

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

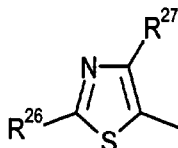


em que

R^{23} e R^{24} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -
20 haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^{25} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

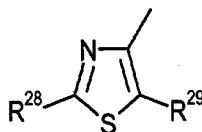


em que

R^{26} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, ciano, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

5 R^{27} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

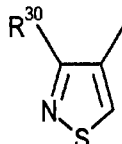


em que

R^{28} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, ciano, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^{29} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

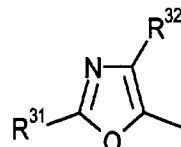
A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



15 em que

R^{30} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo.

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula

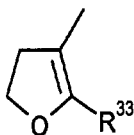


20 em que

R^{31} representa hidrogênio, metila ou etila e

R^{32} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

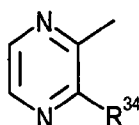
A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

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

A além disso preferivelmente representa um radical da fórmula



5 em que

R^{34} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou trifluorometila.

R particularmente de preferência representa hidrogênio, metila, etila, isopropila, terc-butila,

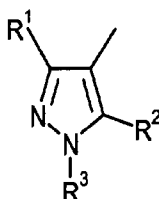
10 Z particularmente de preferência representa alila, 2-butenila, 2-metilalila, 1-metilalila, 3-metil-2-butenila, propargila, 2-butinila, 3-butinila, 2-metil-3-butinila, 3,3-difluoroalila, 3,3-dicloroalila, ciclopropilmetila, ciclopentilmetila, cicloexilmetila,

X e Y independentemente um do outro particularmente de preferência representam flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metila, etila, n-propila, 15 isopropila, n-butila, sec-butila, isobutila, terc-butila, metóxi, etóxi, metiltio, triclorometila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, difluorometóxi, trifluorometóxi, trifluorometiltio, difluoroclorometiltio,

m particularmente de preferência representa 0 ou 1.

20 n particularmente de preferência representa 0, 1 ou 2, onde y representa os radicais idênticos ou diferentes se n representar 2.

A particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

R^1 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, ciclopropila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, monofluorometila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, tri-
 5 clorometóxi, trifluorometiltio ou difluorometiltio e

R^2 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi, metiltio ou etiltio e

R^3 representa hidrogênio, metila, etila, hidroximetila, hidroxietila, trifluorometila, difluorometila ou fenila.

10 A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

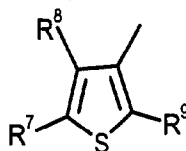


em que

R^4 e R^5 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e
 15

R^6 representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, trifluorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi ou triclorometóxi.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

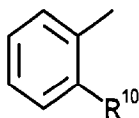


20 em que

R^7 e R^8 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^9 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

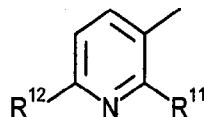
25 A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

R^{10} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi, triclorometóxi, trifluorometiltio, difluorometiltio, difluoroclorometiltio ou triclorometiltio.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

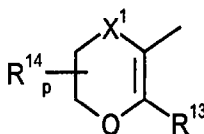


em que

R^{11} representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi, triclorometóxi, difluorometiltio, trifluorometiltio e

R^{12} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, metilsulfinila, metilsulforila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi ou triclorometóxi.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

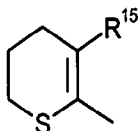
R^{13} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^{14} representa metila ou etila,

X^1 representa S (enxofre), representa SO, SO₂ ou CH₂ e

p representa 0, 1 ou 2.

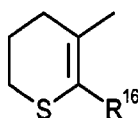
A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



5 em que

R^{15} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

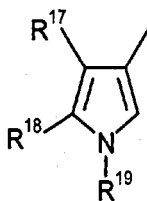
A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



10 em que

R^{16} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



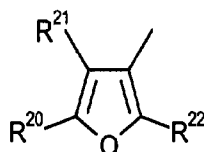
15 em que

R^{17} representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, isopropila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila,

R^{18} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila e

20 R^{19} representa hidrogênio, metila, etila, trifluorometila, metoximetila, etoximetila, hidroximetila ou hidroxietila.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

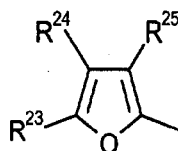


em que

R^{20} e R^{21} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

- 5 R^{22} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

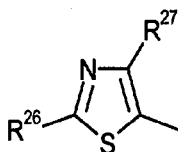


em que

- 10 R^{23} e R^{24} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, nitro, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^{25} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

- 15 A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



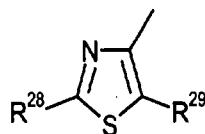
em que

R^{26} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

- 20 R^{27} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

A além disso particularmente de preferência representa um

radical da fórmula

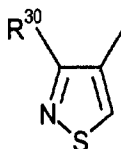


em que

R^{28} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluorocloro-
5 metila ou triclorometila e

R^{29} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila.

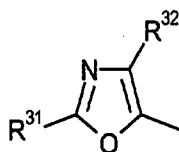
A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



10 em que

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

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

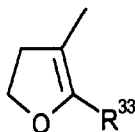


15 em que

R^{31} representa hidrogênio, metila ou etila e

R^{32} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula

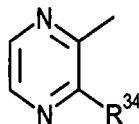


20 em que

R^{33} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluo-

roclorometila ou triclorometila.

A além disso particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

5 R^{34} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou trifluorometila.

R muito particularmente de preferência representa hidrogênio ou metila.

10 Z muito particularmente de preferência representa alila, 2-butenila, 2-metilalila, 1-metilalila, 3-metil-2-butenila, propargila, 2-butinila, 2-metil-3-butinila, 3,3-difluoroalila, ciclopropilmetila.

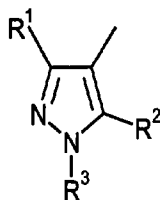
X muito particularmente de preferência representa flúor ou metila.

15 Y muito particularmente de preferência representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, metóxi, metiltio, triclorometila, trifluorometila, trifluorometóxi, trifluorometiltio.

m muito particularmente de preferência representa 0 ou 1.

n muito particularmente de preferência representa 0 ou 1.

20 A muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

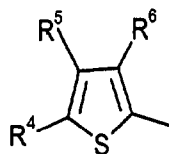
R^1 representa flúor, cloro, bromo, iodo, metila, isopropila, ciclopropila, monofluorometila, difluorometila ou trifluorometila e

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

25 R^3 representa metila.

A além disso muito particularmente de preferência representa

um radical da fórmula

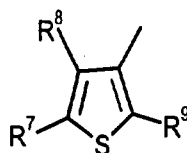


em que

R^4 e R^5 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor ou metila e

5 R^6 representa metila.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula

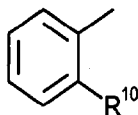


em que

10 R^7 e R^8 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor ou metila e

R^9 representa metila.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula

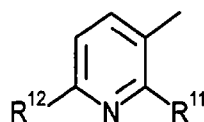


em que

15 R^{10} representa iodo, metila, difluorometila ou trifluorometila,

R^{10} além disso representa cloro ou bromo.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula

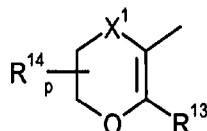


em que

20 R^{11} representa flúor, cloro, bromo, metila ou trifluorometila e

R^{12} representa hidrogênio.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

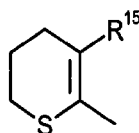
R^{13} representa metila ou trifluorometila e

5 R^{14} representa metila,

X^1 representa S (enxofre) ou CH_2 e

p representa 0 ou 1.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula

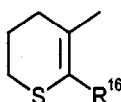


10

em que

R^{15} representa metila, trifluorometila ou difluorometila.

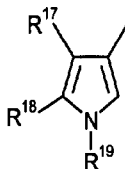
A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula



15 em que

R^{16} representa metila, trifluorometila ou difluorometila.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula



em que

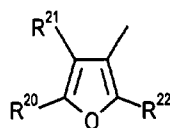
20 R^{17} representa flúor, metila ou trifluorometila,

R^{18} representa hidrogênio ou metila e

R^{19} representa metila ou metoximetila.

A além disso muito particularmente de preferência representa

um radical da fórmula

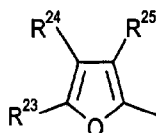


em que

R²⁰ e R²¹ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor ou metila e

5 R²² representa metila ou trifluorometila.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula

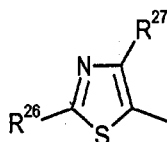


em que

10 R²³ e R²⁴ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor ou metila e

R²⁵ representa metila.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula

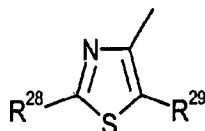


em que

15 R²⁶ representa flúor, cloro, amino ou metila e

R²⁷ representa cloro, metila, trifluorometila ou difluorometila.

A além disso muito particularmente de preferência representa um radical da fórmula



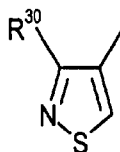
em que

20 R²⁸ representa flúor, cloro, amino ou metila e

R²⁹ representa cloro, metila, trifluorometila ou difluorometila.

A além disso muito particularmente de preferência representa

um radical da fórmula

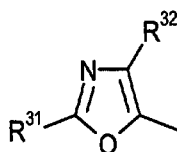


em que

R^{30} representa cloro, metila, trifluorometila ou difluorometila.

A além disso muito particularmente de preferência representa

5 um radical da fórmula



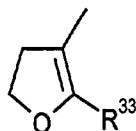
em que

R^{31} representa metila e

R^{32} representa cloro ou metila.

A além disso muito particularmente de preferência representa

10 um radical da fórmula

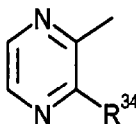


em que

R^{33} representa metila, trifluorometila ou difluorometila.

A além disso muito particularmente de preferência representa

um radical da fórmula



15 em que

R^{34} representa hidrogênio, cloro ou metila.

R especialmente preferivelmente representa hidrogênio ou metila.

Z especialmente preferivelmente representa alila, 2-metil-alila,

20 1-metil-alila, 3-metil-2-butenila, propargila, 2-butinila, 3,3-difluoroalila, ciclopropilmetila.

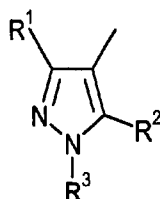
X especialmente preferivelmente representa flúor.

m especialmente preferivelmente representa 0 ou 1.

n especialmente preferivelmente representa 0.

A especialmente preferivelmente representa um radical da

5 fórmula



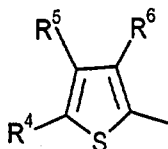
em que

R¹ representa metila, monofluorometila, difluorometila ou trifluorometila e

R² representa hidrogênio, flúor, cloro ou metila e

10 R³ representa metila.

A além disso especialmente preferivelmente representa um radical da fórmula

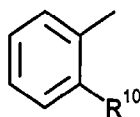


em que

R⁴ e R⁵ cada um representa hidrogênio e

15 R⁶ representa metila.

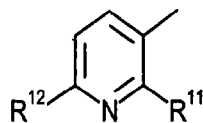
A além disso especialmente preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

R¹⁰ representa iodo, metila ou trifluorometila.

20 A além disso especialmente preferivelmente representa um radical da fórmula



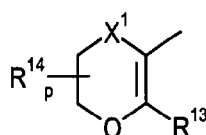
em que

R^{11} representa cloro ou trifluorometila e

R^{12} representa hidrogênio.

A além disso especialmente preferivelmente representa um

5 radical da fórmula



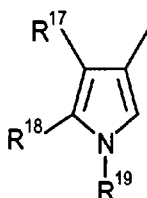
em que

R^{13} representa metila ou trifluorometila e

X^1 representa S (enxofre) e

p representa 0.

10 A além disso especialmente preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

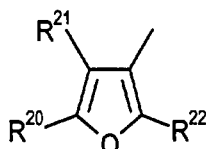
R^{17} representa metila ou trifluorometila,

R^{18} representa hidrogênio ou metila e

15 R^{19} representa metila.

A além disso especialmente preferivelmente representa um

radical da fórmula

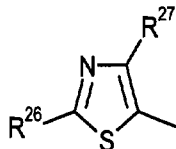


em que

R^{20} e R^{21} cada um representa hidrogênio e

20 R^{22} representa metila.

A além disso especialmente preferivelmente representa um radical da fórmula

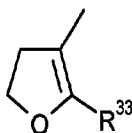


em que

R²⁶ representa amino ou metila e

5 R²⁷ representa metila, trifluorometila ou difluorometila.

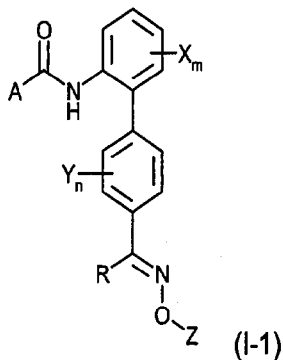
A além disso especialmente preferivelmente representa um radical da fórmula



em que

10 R³³ representa metila.

Preferência é dada além disso aos compostos da fórmula (I-1)



em que

R, Z, X, Y, m, n e A são como definidos acima. Adequadas são em cada caso todas as combinações dos significados gerais, preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos mencionados acima.

Preferência particular é dada aos compostos da fórmula (I-1) em que X é flúor e m é 0 ou 1.

Preferência particular é dada aos compostos da fórmula (I-1) em que n é 0.

Preferência particular é dada aos compostos da fórmula (I-1) em

que R é hidrogênio ou metila.

Preferência particular é dada além disso aos compostos da fórmula (I) em que X é flúor e m é 0 ou 1.

Preferência particular é dada além disso aos compostos da fórmula (I) em que n é 0.

Preferência particular é dada além disso aos compostos da fórmula (I) em que R é hidrogênio ou metila.

Preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos são os compostos que carregam os substituintes mencionados sob preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos, respectivamente.

Radicais de hidrocarboneto saturados e insaturados, como alquila ou alquênica, podem em cada caso ser de cadeia reta ou ramificada até onde isto for possível, incluindo em combinação com os heteroátomos, como, por exemplo, em alcóxi.

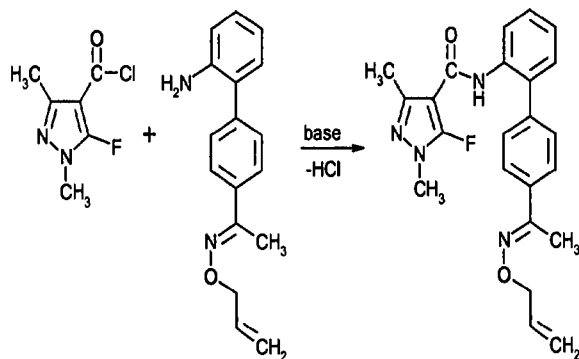
Radicais opcionalmente substituídos podem ser mono- ou polissubstituído onde no caso de polissubstituição os substituintes podem ser idênticos ou diferentes. Uma pluralidade de radicais tendo o mesmo índice, como, por exemplo, radicais m X para $m > 1$, podem ser idênticos ou diferentes.

Radicais halogênio-substituídos, como, por exemplo, haloalquila, são mono- ou poli-halogenados. No caso de poli-halogenação, os átomos de halogênio podem ser idênticos ou diferentes. Aqui, halogênio representa flúor, cloro, bromo e iodo, em particular flúor, cloro e bromo.

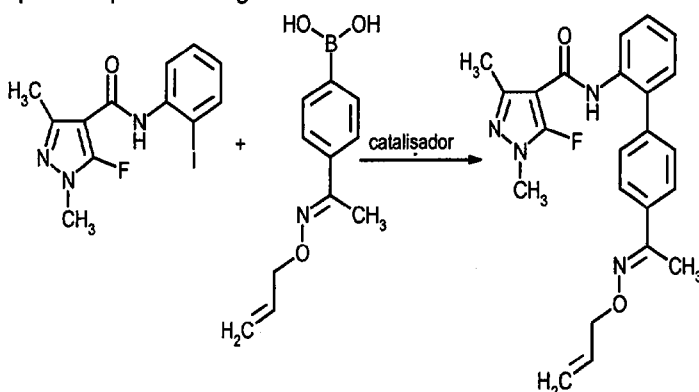
Porém, as definições de radicais gerais ou preferidos ou ilustrações dadas acima podem também ser combinadas entre si conforme desejado, isto é combinações incluindo entre as respectivas faixas e faixas preferidas. As definições se aplicam tanto para produtos finais quanto, correspondentemente, para precursores e intermediários. Além disso, definições individuais podem não se aplicar.

Usando cloreto de 5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonila e oxima de O-alila de 1-(2'-aminobifenil-4-il)etanona como materiais de parti-

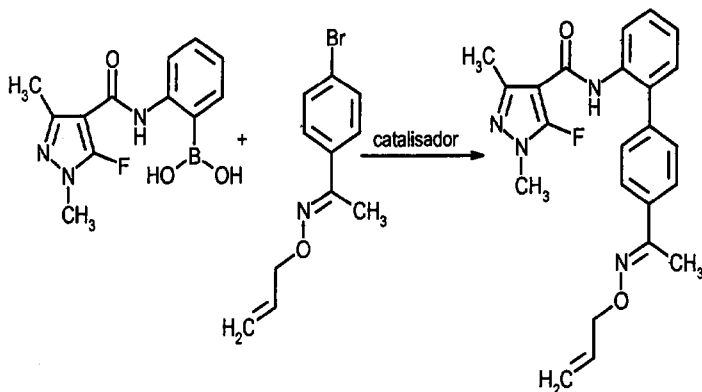
da, o curso do processo (a) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema da fórmula abaixo.



Usando *N*-(2-iodofenil)-5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida e ácido 4-[1-(aliloxiimino)etil]fenilborônico como materiais de partida e um catalisador, o curso do processo (b) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema a seguir abaixo.

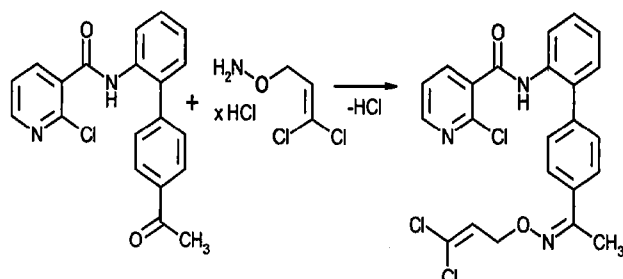


Usando ácido 2-[(5-flúor-1,3-dimetilpirazol-4-il)carbonilamino]fenilborônico e oxima de *O*-alila de 1-(4-bromofenil)etanona como materiais de partida e um catalisador, o curso do processo (c) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema da fórmula abaixo.

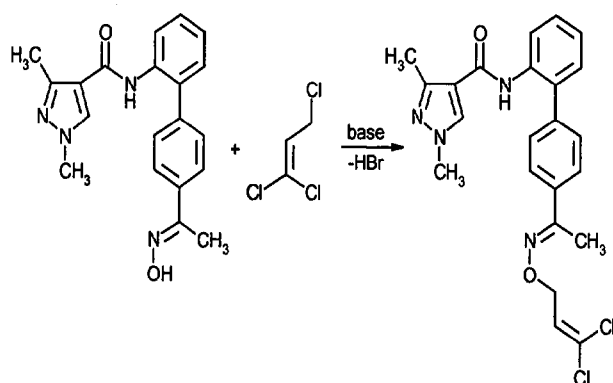


Usando *N*-(4'-acetilbifenil-2-il)-2-cloronicotinamida e hidrocloreto

de *O*-(3,3-dicloroalil)hidroxilamina como materiais de partida, o curso do processo (d) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema da fórmula abaixo.



Usando *N*-(4'-{1-[hidroxiimino]etil}bifenil-2-il) 1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida e 1,1,3-tricloropropeno como materiais de partida, o curso do processo (e) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema da fórmula abaixo.



Usando *N*-(2-bromofenil)-5-fluor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida e oxima de *O*-alila de 1-(4-bromofenil)etanona como materiais de partida e um catalisador e 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, o curso do processo (f) de acordo com a invenção pode ser ilustrado pelo esquema da fórmula abaixo.

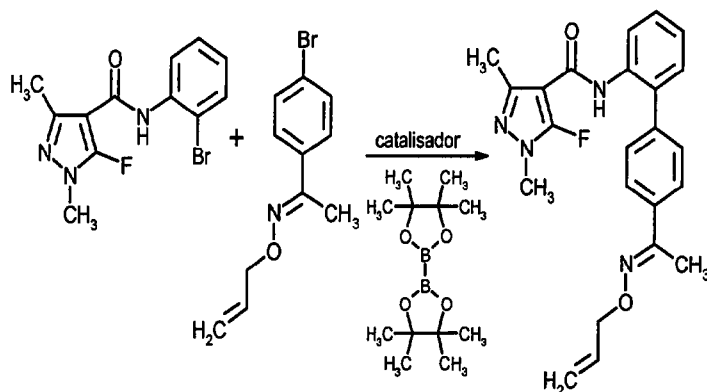


Ilustração dos Processos e Intermediários

A fórmula (II) fornece uma definição geral dos derivados de ácido carboxílico requeridos como materiais de partida para realizar o processo (a) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, A preferivelmente tem aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais. G preferivelmente representa cloro, bromo, hidroxila, metóxi ou etóxi, particularmente de preferência cloro, hidroxila ou metóxi.

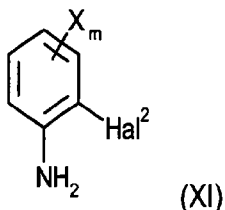
Os derivados de ácido carboxílico da fórmula (II) são conhecidos ou podem ser preparados por processos conhecidos (cf. WO 93/11 117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 e EP-A 0 589 313).

A fórmula (III) fornece uma definição geral dos derivados de anilina requeridos como componentes de reação para realizar o processo (a) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, R, Z, X, Y, m e n preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices.

Os derivados de anilina da fórmula (III) são novos. Alguns deles podem ser preparados por métodos conhecidos (cf. EP-A 0 545 099 e EP-A 0 589 301).

Derivados de anilina da fórmula (III) são obtidos além disso quando

g) derivados 2-haloanilina da fórmula geral (XI)

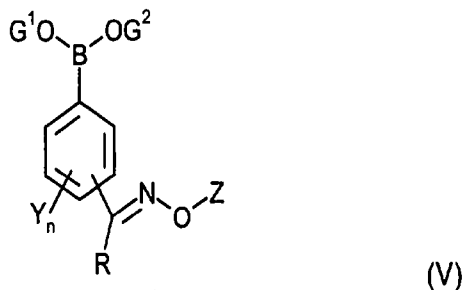


em que

X e m são como definidos acima e

Hal^2 representa halogênio

são reagidos com derivados de ácido borônico da fórmula (V)

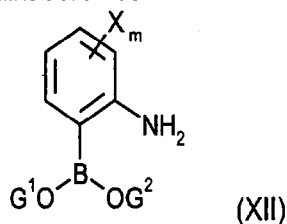


em que R, Z, Y, n, G^1 e G^2 são como definidos acima,

se apropriado na presença de um aglutinante de ácido, se apropriado na

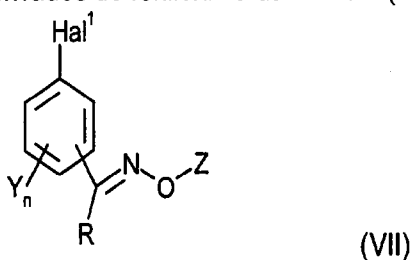
5 presença de um diluente orgânico inerte e se apropriado na presença de catalisador, ou

h) ácidos anilina-borônicos da fórmula (XII)



em que X, m, G^1 e G^2 são como acima definidos

são reagidos com derivados de feniloxima da fórmula (VII)



10 em que R, Z, Y, n e Hal^1 são como definidos acima,

se apropriado na presença de um aglutinante de ácido, se apropriado na

presença de um diluente orgânico inerte e se apropriado na presença de um catalisador.

A fórmula (XI) fornece uma definição geral dos derivados de 2-
 15 haloanilina requeridos como componentes de reação para realizar os processos (g) e (I) (ver abaixo) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, X e m preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção

como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices. Hal preferivelmente representa flúor, cloro ou bromo, particularmente de preferência cloro ou bromo.

- 5 Os derivados de 2-haloanilina da fórmula (XI) estão comercialmente disponíveis ou podem ser preparados dos compostos de nitro correspondentes através de redução.

A fórmula (XII) fornece uma definição geral dos ácidos anilinaborônicos requeridos como componentes de reação para realizar os processos (h) e (j) (ver abaixo) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, X e m preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices. G¹ e G² preferivelmente cada um representa hidrogênio.

Ácidos anilinaborônicos da fórmula (XII) estão comercialmente disponíveis.

A fórmula (IV) fornece uma definição geral dos derivados de carboxamida requeridos como materiais de partida para realizar os processos (b) e (f) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, A, X e m preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices.

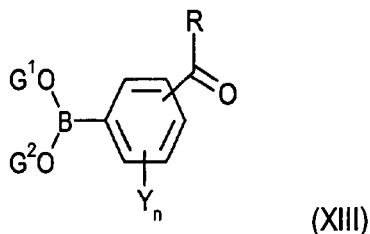
- 25 Os derivados de carboxamida da fórmula (IV) são conhecidos ou podem ser preparados através de processos conhecidos (cf. WO 91/01311, EP-A 0 371 950).

A fórmula (V) fornece uma definição geral dos derivados de ácido borônico requeridos para preparar os componentes de reação ao realizar o processo (b) de acordo com a invenção e o processo (g). Nesta fórmula, R, Z, Y e n preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com

a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices. G^1 e G^2 preferivelmente cada um representa hidrogênio.

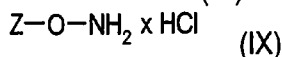
Os derivados de ácido borônico da fórmula (V) são novos e podem ser preparados por

i) reagindo ácidos fenilborônicos da fórmula (XIII)



em que R, Y, n, G^1 e G^2 são como definidos acima

com derivados de hidroxilamina da fórmula (IX)



em que Z é como definido acima,
se apropriado na presença de um aglutinante de ácido, se apropriado na presença de um diluente orgânico inerte e se apropriado na presença de um catalisador.

A fórmula (XIII) fornece uma definição geral dos ácidos fenilborônicos requeridos como componentes de reação para realizar os processos (i) e (l) (ver abaixo) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, R, Y e n preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices. G^1 e G^2 preferivelmente cada um representa hidrogênio.

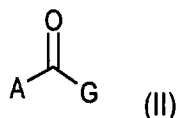
Os ácidos fenilborônicos da fórmula (XIII) estão comercialmente disponíveis.

A fórmula (VI) fornece uma definição geral dos derivados de ácido borônico de carboxamida requeridos como componentes de reação para realizar o processo (c) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, A, X e m preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção

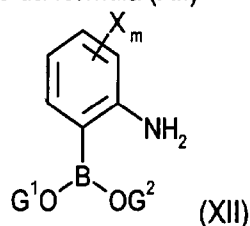
como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices. G^1 e G^2 preferivelmente cada um representa hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno.

- 5 Os derivados de ácido borônico de carboxamida da fórmula (VI) são novos. Eles podem ser preparados

j) reagindo derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)



em que A e G são como definidos acima
com ácidos anilina-borônicos da fórmula (XII)



- 10 em que X, m, G^1 e G^2 são como definidos acima,
se apropriado na presença de um aglutinante de ácido, se apropriado na
presença de um diluente orgânico inerte e se apropriado na presença de um
catalisador.

- A fórmula (VII) fornece uma definição geral dos derivados de
15 feniloxima requeridos como componentes de reação para realizar os processos (c) e (f) de acordo com a invenção e o processo (h). Nesta fórmula, R, Z, Y e n preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices.

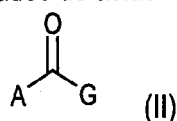
Os derivados de feniloxima da fórmula (VII) são conhecidos e/ou podem ser preparados por processos conhecidos (cf. Synth. Commun. 2000, 30, 665-669, Synth. Commun. 1999, 29, 1697-1701).

- 25 A fórmula (VIII) fornece uma definição geral dos derivados de bifenilacila requeridos como materiais de partida para realizar o processo (d)

de acordo com a invenção. Nesta fórmula, A, R, X, Y, m e n têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices.

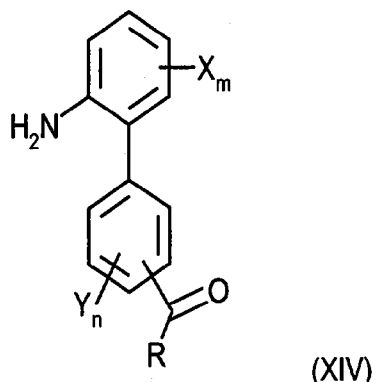
Os derivados de bifenilacila da fórmula (VIII) são novos. Eles podem ser preparados

k) reagindo derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)



em que A e G são como definidos acima

com derivados de 2-benzaldeídoanilina da fórmula (XIV)



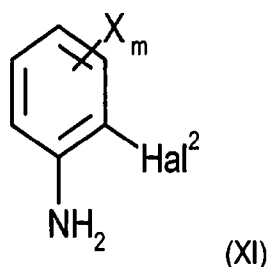
em que R, X, Y, m e n são como definidos acima,

se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na presença de um diluente orgânico inerte.

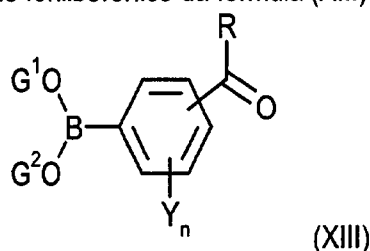
A fórmula (XIV) fornece uma definição geral dos derivados 2-benzaldeídoanilina requeridos como componentes de reação para realizar o processo (k) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, R, X, Y, m e n preferivelmente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices.

Os derivados de 2-benzaldeídoanilina da fórmula (XIV) são novos. Eles podem ser preparados

l) reagindo derivados de anilina da fórmula (XI)



em que X, m e Hal² são como definidos acima e
com derivados de ácido fenilborônico da fórmula (XIII)



em que R, Y, n, G¹ e G² são como definidos acima,
se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na
5 presença de um diluente orgânico inerte.

A fórmula (IX) fornece uma definição geral dos derivados de hidroxilamina requeridos como componentes de reação para realizar o processo (d) de acordo com a invenção e o processo (i). Nesta fórmula, Z preferivelmente tem aqueles significados que já foram mencionados com relação
10 à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para este radical. Preferência é dada usar os hidrocloreto mencionados na descrição. Porém, é também possível usar os derivados de hidroxilamina livres no processo de acordo com a invenção.

15 Derivados de hidroxilamina da fórmula (IX) estão comercialmente disponíveis.

A fórmula (I-a) fornece uma definição geral dos derivados de hidroxiimino requeridos como materiais de partida para realizar o processo (e) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, A, R, X, Y, m e n preferivel-
20 mente têm aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para estes radicais ou estes índices.

Os derivados de hidroxiimino da fórmula (I-a) de acordo com a invenção podem ser preparados por um dos processos (a), (b), (c), (d) ou (f) de acordo com a invenção acima descrita.

A fórmula (X) fornece uma definição geral dos compostos requeridos como componentes de reação para realizar o processo (e) de acordo com a invenção. Nesta fórmula, Z preferivelmente tem aqueles significados que já foram mencionados com relação à descrição dos compostos da fórmula (I) de acordo com a invenção como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos e especialmente preferidos para este radical. E preferivelmente representa cloro, bromo, iodo, metanossulfonila ou p-toluenossulfonila. E particularmente de preferência representa cloro ou bromo.

Compostos da fórmula (X) estão comercialmente disponíveis.

Aglutinantes de ácido adequados para realizar os processos (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção são em cada caso todos bases inorgânicas e orgânicas habituais para tais reações. Preferência é dada usar hidróxidos de metal alcalino terroso ou de metal alcalino, como hidróxido de sódio, hidróxido de cálcio, hidróxido de potássio, ou então hidróxido de amônio, carbonatos de metal alcalino, como carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio, acetatos de metal alcalino ou metal alcalino terroso, como acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio e também aminas terciárias, como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diazabicycloundeceno (DBU). Porém, é também possível operar sem aglutinante de ácido adicionado ou usar um excesso do componente de amina simultaneamente de forma que ele age como aglutinante de ácido.

Diluentes adequados para realizar os processos (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção são em cada caso todos solventes orgânicos inertes habituais. Preferência é dada usar hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos opcionalmente halogenados, como éter de petróleo, hexano, heptano, cicloexano, metilcicloexano, benzeno, tolueno, xileno

ou decalina; clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloreto ou tricloroetano; éteres, como éter dietílico, éter de diisopropila, éter de terc-butila de metila, éter de terc-amila de metila, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, como acetonitrila, propionitrila, n- ou isobutironitrila ou benzonitrila; amidas, como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; ésteres, como acetato de metila ou acetato de etila, sulfóxidos, como sulfóxido de dimetila, ou sulfonas, como sulfolano.

10 Ao realizar os processos (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção, as temperaturas de reação podem em cada caso ser variadas dentro um gama relativamente extensiva. Em geral, os processos são realizados em temperatura entre 0° C e 140° C, preferivelmente entre 10° C e 120° C.

15 O processo (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção é em geral em cada caso realizado sob pressão atmosférica. Porém, em cada caso é também possível operar sob pressão elevada ou reduzida.

Ao realizar o processo (a) de acordo com a invenção, em geral 1 mol ou então um excesso de derivado de anilina da fórmula (III) e de 1 a 3 moles de aglutinante de ácido são empregados por mol de haleto de ácido da fórmula (II). Porém, é também possível empregar os componentes de reação em outras razões. Processamento é realizado através de métodos habituais. Em geral, água é adicionada à mistura de reação e a fase orgânica é separada e, após secar, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo que fica pode, se requerido, ser liberado de qualquer impureza que ainda possa estar presente usando métodos habituais, como cromatografia ou recristalização.

30 Ao realizar o processo (b) de acordo com a invenção, em geral 1 mol ou então um excesso de derivado de ácido borônico da fórmula (V) e de 1 a 5 moles de aglutinante de ácido são empregados por mol de carboxamida da fórmula (IV). Porém, é também possível empregar os componentes de reação em outras razões. Processamento é realizado através de mé-

todos habituais. Em geral, água é adicionada à mistura de reação e o precipitado é separado e seco. O resíduo que fica pode, se requerido, ser liberado de qualquer impureza que ainda possa estar presente usando métodos habituais, como cromatografia ou recristalização.

- 5 Ao realizar o processo (c) de acordo com a invenção, em geral 1 mol ou então um excesso de derivado de feniloxima da fórmula (VII) e de 1 a 10 moles de aglutinante de ácido e de 0,5 a 5 % em mol de um catalisador são empregados por mol de derivado de ácido borônico de carboxamida da fórmula (VI). Porém, é também possível empregar os componentes de
- 10 reação em outras razões. Processamento é realizado através de métodos habituais. Em geral, água é adicionada à mistura de reação e o precipitado é separado e seco. O resíduo que fica pode, se requerido, ser liberado de qualquer impureza que ainda possa estar presente usando métodos habituais, como cromatografia ou recristalização.
- 15 Ao realizar o processo (d) de acordo com a invenção, em geral 1 mol ou então um excesso de derivado de hidroxilamina da fórmula (IX) e de 1 a 5 moles de aglutinante de ácido são empregados por mol de derivado de bifenilacila da fórmula (VIII). Porém, é também possível empregar os componentes de reação em outras razões. Processamento é realizado
- 20 através de métodos habituais. Em geral, água é adicionada à mistura de reação e o precipitado é separado, lavado com água e éter de diisopropila e depois seco. O resíduo que fica pode, se requerido, ser liberado de qualquer impureza que ainda possa estar presente usando métodos habituais, como cromatografia ou recristalização.
- 25 Ao realizar o processo (e) de acordo com a invenção, em geral 1 mol ou então um excesso de reagente da fórmula (X) e de 1 a 5 moles de aglutinante de ácido são empregados por mol de derivado de hidroxiimino da fórmula (I-a). Porém, é também possível empregar os componentes de reação em outras razões. Processamento é realizado através de métodos
- 30 habituais. Em geral, água é adicionada à mistura de reação e o precipitado é separado e seco. O resíduo que fica pode, se requerido, ser liberado de qualquer impureza que ainda possa estar presente usando métodos ha-

bituais, como cromatografia ou recristalização.

Ao realizar o processo (f) de acordo com a invenção, em geral 1 mol ou então um excesso de derivado de feniloxima da fórmula (VII) e de 1 a 5 moles de aglutinante de ácido e de 1 a 5 moles de um catalisador são empregados por mol de derivado de carboxamida da fórmula (IV). Porém, é também possível empregar os componentes de reação em outras razões. Processamento é realizado através de métodos habituais. Em geral, água é adicionada à mistura de reação e o precipitado é separado e seco. O resíduo que fica pode, se requerido, ser liberado de qualquer impureza que ainda possa estar presente usando métodos habituais, como cromatografia ou recristalização.

Os compostos ativos são adequados para proteger plantas e órgãos de planta, aumentar os rendimentos da colheita, melhorar a qualidade do material colhido e controlar pestes animais, em particular insetos, aracnídeos e nematódeos que são encontrados na agricultura em florestas, em jardins e em instalações desocupadas, na proteção de produtos armazenados e de materiais, e no setor de higiene e eles são bem tolerados pelas plantas, têm toxicidade homeotérmica favorável e compatibilidade ambiental boa. Eles podem preferivelmente ser empregados como agentes de proteção de plantação. Eles são ativos contra normalmente espécies sensíveis e resistentes e contra todos ou alguns estágios de desenvolvimento. As pestes acima mencionadas incluem:

Da ordem dos Isópodes, por exemplo, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare* e *Porcellio scaber*.

Da ordem dos Diplópodes, por exemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Da ordem dos Quilópodes, por exemplo, *Geophilus carpophagus* e *Scutigera* spp.

Da ordem dos Sinfilos, por exemplo, *Scutigera* spp.

Da ordem dos Tissanuros, por exemplo, *Lepisma saccharina*.

Da ordem dos Colêmbolos, por exemplo, *Onychiurus armatus*.

Da ordem dos Ortópteros, por exemplo, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp. e *Schisto-*

cerca gregaria.

Da ordem dos Blatários, por exemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae* e *Blattella germanica*.

Da ordem dos Dermápteros, por exemplo, *Forficula auricularia*.

5 Da ordem dos Isópteros, por exemplo, *Reticulitermes* spp.

Da ordem dos Ftirápteros, por exemplo, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp. e *Damalinia* spp.

10 Da ordem dos Tissanópteros, por exemplo, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi* e *Frankliniella accidentalis*.

Da ordem dos Heterópteros, por exemplo, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus* e *Triatoma* spp.

15 Da ordem dos Homópteros, por exemplo, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia*
20 *oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp. e *Psylla* spp.

Da ordem dos Lepidópteros, por exemplo, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis*
25 *chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephesia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila*
30 *pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp. e *Oulema oryzae*.

Da ordem dos Coleópteros, por exemplo, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp.,
 5 *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attageus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllioides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp.,
 10 *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica* e *Lissorhoptus oryophilus*.

Da ordem dos Himenópteros, por exemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis* e *Vespa* spp.

Da ordem dos Dípteros, por exemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*,
 20 *Hylemyia* spp. e *Liriomyza* spp.

Da ordem dos Sifonápteros, por exemplo, *Xenopsylla cheopis* e *Ceratophyllus* spp.

Da classe dos Araquenídeos, por exemplo, *Scorpio maurus*, *Latreutes mactans*, *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Hemitarsonemus* spp. e *Brevipalpus* spp.

30 Os nematódeos fitoparasitários incluem, por exemplo, *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides*

spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp.

Os compostos de acordo com a invenção têm atividade microbiana potente e podem ser empregados para controlar microorganismos indesejáveis, como fungos e bactérias, na proteção de plantação e na proteção dos materiais.

Fungicidas podem ser empregados na proteção de plantação para controlar *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* e *Deuteromycetes*.

10 Bactericidas podem ser empregados na proteção de plantação para controlar *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* e *Streptomycetaceae*.

Alguns patógenos que causam doenças fúngicas e bacterianas que vem sob os nomes genéricos listados abaixo podem ser mencionados como exemplos, mas de forma alguma de limitação:

espécies *Xanthomonas*, como, por exemplo, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

espécies *Pseudomonas*, como, por exemplo, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

20 espécies *Erwinia*, como, por exemplo, *Erwinia amylovora*;

espécies *Pythium*, como, por exemplo, *Pythium ultimum*;

espécies *Phytophthora*, como, por exemplo, *Phytophthora infestans*;

25 espécies *Pseudoperonospora*, como, por exemplo, *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*;

espécies *Plasmopara*, como, por exemplo, *Plasmopara viticola*;

espécies *Bremia*, como, por exemplo, *Bremia lactucae*;

espécies *Peronospora*, como, por exemplo, *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*;

30 espécies *Erysiphe*, como, por exemplo, *Erysiphe graminis*;

espécies *Sphaerotheca*, como, por exemplo, *Sphaerotheca fuliginea*;

espécies *Podosphaera*, como, por exemplo, *Podosphaera leuotricha*;

espécies *Venturia*, como, por exemplo, *Venturia inaequalis*;

espécies *Pyrenophora*, como, por exemplo, *Pyrenophora teres*

5 ou *P. graminea*

(forma de conídeo: *Drechslera*, syn: *Helminthosporium*);

espécies *Cochliobolus*, como, por exemplo, *Cochliobolus sativus*

(forma de conídio: *Drechslera*, syn: *Helminthosporium*);

espécies *Uromyces*, como, por exemplo, *Uromyces appendicula-*

10 tus;

espécies *Puccinia*, como, por exemplo, *Puccinia recondita*;

espécies *Sclerotinia*, como, por exemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*;

espécies *Tilletia*, como, por exemplo, *Tilletia caries*;

15 espécies *Ustilago*, como, por exemplo, *Ustilago nuda* ou *Ustilago avenae*;

espécies *Pellicularia*, como, por exemplo, *Pellicularia sasakii*;

espécies *Pyricularia*, como, por exemplo, *Pyricularia oryzae*;

espécies *Fusarium*, como, por exemplo, *Fusarium culmorum*;

20 espécies *Botrytis*, como, por exemplo, *Botrytis cinerea*;

espécies *Septoria*, como, por exemplo, *Septoria nodorum*;

espécies *Leptosphaeria*, como, por exemplo, *Leptosphaeria nodorum*;

espécies *Cercospora*, como, por exemplo, *Cercospora canes-*

25 cens;

espécies *Alternaria*, como, por exemplo, *Alternaria brassicae*; e

espécies *Pseudocercospora*, como, por exemplo, *Pseudocercospora herpotrichoides*

30 Os compostos ativos de acordo com a invenção também têm ação fortificante muito boas em plantas. Conseqüentemente, eles podem ser usados para mobilizar as defesas da planta contra ataque por microorganismos indesejáveis.

No presente contexto, substâncias fortalecedoras de planta (indutoras de resistência) serão entendidas como significando essas substâncias que são capazes de estimular o sistema de defesa das plantas de modo que, quando as plantas tratadas são subseqüentemente inoculadas com microorganismos indesejáveis, elas mostram resistência substancial a estes microorganismos.

No presente caso, microorganismos indesejáveis serão entendidos como significando fungos fitopatogênicos, bactérias e vírus. Conseqüentemente, as substâncias de acordo com a invenção podem ser usadas para proteger plantas durante um certo período após o tratamento contra ataque pelos patógenos mencionados. O período durante o qual a proteção é fornecida em geral estende mais de 1 a 10 dias, preferivelmente 1 a 7 dias, após o tratamento das plantas com os compostos ativos.

O fato que os compostos ativos são bem tolerados por plantas nas concentrações requeridas para controlar as doenças de planta permite o tratamento das partes acima do solo de plantas, de matéria-prima e sementes de propagação, e da terra.

Os compostos ativos de acordo com a invenção podem ser usados com resultados particularmente bons para controlar doenças em vitivinicultura e no cultivo de fruta e vegetais, como, por exemplo, contra espécies *Venturia*, *Botrytis*, *Sclerotinia*, *Rhizoctonia*, *Uncinula*, *Sphaerotheca*, *Podosphaera*, *Alternaria* e *Colletotrichum*. Doenças de arroz, como espécies *Pyricularia* e *Pellicularia*, são igualmente controladas com resultados bons.

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

Em certas concentrações e taxas de aplicação, os compostos ativos de acordo com a invenção podem também ser usados como herbicidas, para influenciar o crescimento da planta e para controlar pestes animais. Se apropriado, eles podem também ser usados como intermediários e precursores para a síntese de outros compostos ativos.

Todas as plantas e partes de planta podem ser tratadas acordo

com a invenção. Plantas serão entendidas como significando no presente contexto todas as plantas e populações de planta como plantas selvagens desejadas e indesejadas ou plantas de plantação (incluindo plantas de plantação de ocorrência natural). Plantas de plantação podem ser plantas que
5 podem ser obtidas por métodos de cultivo e de otimização de planta convencionais ou através de métodos biotecnológicos e recombinantes ou por combinações destes métodos, incluindo as plantas transgênicas e inclusive dos cultivars de planta protegíveis ou não protegíveis pelos direitos dos criadores de planta. Partes de planta serão entendidas como significando to-
10 das as partes e órgãos de plantas acima e abaixo do chão, como broto, folha, flor e raiz, exemplos que podem ser mencionados sendo folhas, ramificações, talos, troncos, flores, corpos de fruta, frutas, sementes, raízes, tubérculos e rizomas. As partes de planta também incluem material colhido, e material de propagação vegetativo e gerador, por exemplo mudas, tubércu-
15 los, rizomas, ramos e sementes.

Tratamento de acordo com a invenção das plantas e partes de planta com os compostos ativos é diretamente realizado ou permitindo os compostos agirem nos arredores, ambiente ou espaço de armazenamento pelos métodos de tratamento habituais, por exemplo através de imersão,
20 borrifação, evaporação, enevoamento, espalhamento, pintura, injeção, e, no caso de material de propagação, em particular no caso de sementes, também aplicando um ou mais revestimentos.

Na proteção de materiais, as substâncias de acordo com a invenção podem ser empregadas para proteger materiais industriais contra
25 infecção com, e destruição por, microorganismos indesejados.

Materiais industriais no presente contexto são entendidos como significando materiais não-vivos que foram preparados para o uso na indústria. Por exemplo, materiais industriais que são pretendidos ser protegidos pelos compostos ativos de acordo com a invenção de alteração ou destrui-
30 ção microbiana podem ser adesivos, colas, papel e papelão, tecidos, couro, madeira, pinturas e artigos de plástico, lubrificantes refrescantes e outros materiais com os quais podem ser infetados, ou destruídos pelos microorga-

nismos. Partes de plantas de produção, por exemplo circuitos de água de refrigeração que podem ser prejudicadas pela proliferação dos microorganismos podem também ser mencionadas dentro do escopo dos materiais a ser protegido. Materiais industriais que podem ser mencionados dentro do

5 escopo da presente invenção são preferivelmente adesivos, colas, papel e papelão, couro, madeira, pinturas, lubrificantes refrescantes e líquidos de transferência de calor, particularmente de preferência madeira.

Microorganismos capazes de degradar ou alterar os materiais industriais que podem ser mencionados são, por exemplo, bactérias, fungos,

10 leveduras, algas e organismos de lodo. Os compostos ativos de acordo com a invenção preferivelmente agem contra fungos, em particular mofos, fungos de descoloração de madeira e destruição de madeira (Basidiomycetes), e contra organismos de lodo e algas.

Os microorganismos dos gêneros a seguir podem ser mencionados como exemplos:

15

Alternaria, tal como *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, tal como *Aspergillus niger*,
Chaetomium, tal como *Chaetomium globosum*,
Coniophora, tal como *Coniophora puetana*,
20 Lentinus, tal como *Lentinus tigrinus*,
Penicillium, tal como *Penicillium glaucum*,
Polyporus, tal como *Polyporus versicolor*,
Aureobasidium, tal como *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, como *Sclerophoma pityophila*,
25 Trichoderma, como *Trichoderma viride*,
Escherichia, como *Escherichia coli*,
Pseudomonas, como *Pseudomonas aeruginosa*, e
Staphylococcus, como *Staphylococcus aureus*.

Dependendo das suas propriedades físicas e/ou químicas particulares, os compostos ativos podem ser convertidos nas formulações habituais, como soluções, emulsões, suspensões, pós, espumas, pastas, grânulos, aerossóis e microencapsulações em substâncias poliméricas e nas

30

composições de revestimento para sementes, e refrigeração de ULV e formulações de enevoamento mornas.

Estas formulações são produzidas de uma maneira conhecida, por exemplo misturando os compostos ativos com extensores, ou seja, sol-
5 ventes líquidos, gases liquidificados sob pressão e/ou veículos sólidos, op-
cionalmente com o uso de tensoativos que são emulsificantes e/ou disper-
santes e/ou formadores de espuma. Se o extensor usado for água, é tam-
bém possível empregar, por exemplo, solventes orgânicos como solventes
auxiliares. Essencialmente, os solventes líquidos adequados são: aromáti-
10 cos como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, aromáticos clorados ou hidro-
carbonetos alifáticos clorados como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto
de metileno, hidrocarbonetos alifáticos como cicloexano ou parafinas, por
exemplo frações de petróleo, álcoois como butanol ou glicol e seus éteres e
ésteres, cetonas como acetona, cetona de etila de metila, cetona de isobuti-
15 la de metila ou cicloexanona, solventes fortemente polares como dimetilfor-
mamida ou sulfóxido de dimetila, ou então água. Extensores ou veículos
gasosos liquidificados serão entendidos como significando líquidos que são
gasosos em temperatura padrão e sob pressão atmosférica, por exemplo
propulsores de aerossol como hidrocarbonetos halogenados, ou então buta-
20 no, propano, nitrogênio e dióxido de carbono. Veículos sólidos adequados
são: por exemplo, minerais naturais moídos tais como caulins, argila, talco,
giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terra diatomácea, e minerais sin-
téticos moídos como sílica finamente dividida, alumina e silicatos. Veículos
sólidos adequados para grânulos são: por exemplo, pedras naturais esma-
25 gadas e fracionadas como calcita, mármore, púmice, sepiolita e dolomita, ou
então grânulos sintéticos de refeições inorgânicas e orgânicas, e grânulos
de material orgânico como serragem, casca de coco, espigas de milho e
talos de tabaco. Emulsificantes e/ou formadores adequados de espuma são:
por exemplo emulsificantes não-iônicos e aniônicos, como ésteres de ácido
30 graxo de polioxietileno, éteres de álcool graxos de polioxietileno, por exem-
plo éteres de poliglicol de alquilarila, alquilsulfonatos, sulfatos de alquila, a-
rilsulfonatos, ou então hidrolisados de proteína. Dispersantes adequados

são: por exemplo líquidos residuais de lignossulfeto e metilcelulose.

Aderentes como carboximetilcelulose e polímeros naturais e sintéticos na forma de pós, grânulos ou látices, como goma arábica, álcool de polivinila e acetato de polivinila, ou então fosfolipídeos naturais como cefalinas e lecitinas e fosfolipídeos sintéticos podem ser usados nas formulações. Outros possíveis aditivos são minerais e óleos vegetais.

É possível usar corantes como pigmentos inorgânicos, por exemplo óxido de ferro, óxido de titânio e matéria corante Azul prussiano, e orgânicos como matéria corante de alizarina, matéria corante de azo e matéria corante de ftalocianina de metal, e nutrientes de rastro como sais de ferro, manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

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

Os compostos ativos de acordo com a invenção podem ser usados como tal ou em suas formulações, também em uma mistura com fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas ou inseticidas conhecidos, para alargar, por exemplo, o espectro de atividade ou impedir o desenvolvimento de resistência. Em muitos casos, efeitos sinérgicos são obtidos, isto é a atividade da mistura é maior que a atividade dos componentes individuais.

Exemplos de componentes de mistura adequados são os compostos a seguir:

Fungicidas:

2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; acibenzolar-S-metila; aldimorf; amidoflumet; ampropilfos; ampropilfos-potássio; andoprim; anilazina; azaconazol; azoxistrobina; benalaxila; benodanila; benomila; bentiavalicarb-isopropila; benzamacrila; benzamacril-isobutila; bilanafos; binapacril; bifenila; bitertanol; blastidín-S; bromuconazol; bupirimato; butiobato; butilamina; polissulfeto de cálcio; capsimicina; captafol; captan; carbendazim; carboxina; carpropamida; carvona; quinometionat; clobentiazona; clorfenazol; cloroneb; clorotalonila; clozolinato; clozilacon; ciazofamida; ciflufenamida; cimoxanila; ciproconazol; ciprodinila; ciprofuram; Dagger G; debacarb; diclofluanida; diclona; diclorofeno; diclocimet; diclomezina; dicloran; dieto-

fencarb; difenoconazol; diflumentorim; dimetirimol; dimetomorf; dimoxistrobina; diniconazol; diniconazol-M; dinocap; difenilamina; dipiritiona; ditalinfos; ditianon; dodina; drazoxolon; edifenfos; epoxiconazol; etaboxam; etirimol; etridiazol; famoxadona; fenamidona; fenapanila; fenarimol; fenbuconazol;

5 fenfuram; fenexamida; fenitropan; fenoxanila; fempiclonila; fenpropidina; fenpropimorf; ferbam; fluazinam; flubenzimina; fludioxonila; flumetover; flumorf; fluoromida; fluoxastrobina; fluquinconazol; flurprimidol; flusilazol; flussulfamida; flutolanila; flutriafol; folpet; fosetil-Al; fosetil-sódio; fuberidazol; furalaxila; furametpir; furcarbanila; furmeciclox; guazatina; hexaclorobenzeno; hexaconazol;

10 himexazol; imazalila; imibenconazol; triacetato de iminoctadina; tris(albesil) de iminoctadina; iodicarb; ipconazol; iprobenfos; iprodiona; iprovalicarb; irumamicina; isoprotiolano; isovalediona; cassugamicina; cresoximetila; mancozeb; maneb; meferimzona; mepanipirim; mepronila; metalaxila; metalaxil-M; metconazol; metassulfocarb; metfuroxam; metiram; metomino-

15 estrobina; metsulfovax; mildiomicina; miclobutanila; miclozolin; natamicina; nicobifen; nitrotal-isopropila; noviflumuron; nuarimol; ofurace; onissastrobina; oxadixila; ácido oxolínico; oxpoconazol; oxicarboxin; oxifentiin; paclobutrazol; pefurazoato; penconazol; pencicuron; fosdifeno; ftalida; picoxiestrobina; piperalin; polioxinas; polioxorim; probenazol; procloraz; procimidona; propamocarb; propanosina-sódio; propiconazol; propineb; proquinazid; protiiconazol; piraclostrobina; pirazofos; pirifenox; pirimetanila; piroquilon; piroxifur; pirrolenitrina; quinconazol; quinoxifeno; quintozeno; simeconazol; espiroxamina; enxofre; tebuconazol; tecloftalam; tecnazeno; tetciclacis; tetraconazol; tiabendazol; ticiofeno; tifulzamida; tiofanato-metila; tiram; tioximid; tolclofos-

20 metila; toliifluanida; triadimefon; triadimenol; triazbutila; triazóxido; triciclami- da; triciclazol; tridemorf; trifloxistrobina; triflumizol; triforina; triticonazol; uni- conazol; validamicina A; vinclozolina; zineb; ziram; zoxamida; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metil-sulfonil)a-

25 mino]butanamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracloro-4- (metilsulfonil)piridina; 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida; 2-cloro-N-(2,3-diidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridinacarboxamida; 3,4,5-tricloro-2,6-piridinadicarbonitrila; actinovato; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-

30

- il)cicloheptanol; 1-(2,3-diidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metila; carbonato de monopotássio; N-(6-metóxi-3-piridinil)ciclopropano-carboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaespíro[4.5]decano-3-amina; tetratiocarbonato de sódio; e sais de cobre e preparações, como mistura de Bordeaux; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclreto de cobre; sulfato de cobre; cufraneb; óxido cuproso; mancobre; oxina-cobre.

Bactericidas:

- bronopol, diclorofeno, nitrapirin, dimetilditiocarbamato de níquel, cassugamicina, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

Inseticidas/Acaricidas/Nematicidas:

- abamectina, ABG-9008, acefato, acequinocila, acetamiprida, acetoprol, acrinatrina, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aletrin, isômeros de 1R de aletrin, alfa-cipermetrina (alfametrina), amidoflumet, aminocarb, amitraz, avermectina, AZ-60541, azadiractina, azametifos, azinfos-metila, azinfos-etila, azociclotina, *Bacillus popilliae*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, EG-2348 de cepa de *Bacillus thuringiensis*, GC-91 de cepa de *Bacillus thuringiensis*, NCTC-11821 de cepa de *Bacillus thuringiensis*, baculovírus, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, benzoximato, betaciflutrina, beta-cipermetrina, bifenazato, bifentrina, binapacril, bioaletrin, isômero de bioaletrin-S-ciclopentila, bioetanometrina, biopermetrina, biorresmetrina, bistrifluron, BPMC, brofenprox, bromofos-etila, bromopropilato, bronfenvinfos (-metil), BTG-504, BTG-505, bufencarb, buprofezina, butatíofos, butocarboxima, butoxicarboxima, butilpiridabeno, cadussafos, canfeclor, carbarila, carbofurano, carbofenotiona, carbossulfan, cartap, CGA-50439, quinometionat, clordano, clordimeform, cloetocarb, cloretoxifos, clorfenapir, clorfenvinfos, clorfluazuron, clormefos, clorobenzilato, cloropicrina, clorproxifeno, clorpirifos-metila, clorpirifos (-etil), clovaoptrina, cromafenozida, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cloetocarb, clofentezina, clotianidina, clotiazobeno, codlemona, coumafos, cianofenos, cianofos,

ciclopreno, cicloprotrina, *Cydia pomonella*, ciflutrina, cialotrina, ciexatina, cipermetrina, cifenotrina (isômero de 1R), ciromazina, DDT, deltametrina, demeton-S-metila, demeton-S-metilsulfona, diafentiuron, dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos, dicofol, dicrotofos, diciclanila, diflubenzuron, dimetoato,

5 dimetilvinfos, dinobuton, dinocap, dinotefuran, diofenolan, dissulfoton, docusat-sódio, dofenapin, DOWCO-439, eflussilanato, emamectina, emamectina-benzoato, empentrina (isômero de 1R), endossulfano, *Entomoptora* spp., EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etiprol, etion, etoprofos, etofenprox, etoxazol, etrinfos, fanfur, fenamifos, fenazaquin, óxido de fenbutatina, fenflutrina,

10 fenitrotrion, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpirad, fenpiritrina, fenpiroximato, fensulfotion, fention, fentrifanila, fenvalerato, fipronila, flonicamid, fluacripirim, fluazuron, flubenzimina, flubrocitrinato, flucicloxuron, flucitrinato, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox, flumetrina, flupirazofos, flutenzina (flufenzina), fluvalinato, fonofos, formetanato, formotion,

15 fosmetilan, fostiazato, fubfenprox (fluproxifeno), furatiocarb, gama-HCH, gossiplure, grandlure, vírus de granulose, halfenprox, halofenozida, HCH, HCN-801, heptenofos, hexaflumuron, hexitiazox, hidrametilnona, hidropreno, IKA-2002, imidacloprid, imiprotrina, indoxacarb, iodofenfos, iprobenfos, isazofos, isofenfos, isoprocarb, isoxation, ivermectina, japonilure, cadertrina,

20 vírus de poliedrose nuclear, cinopreno, lambda-cialotrina, lindano, lufenuron, malation, mecarbam, messulfenfos, metaldeído, metam-sódio, metacrifos, metamidofos, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, metidation, metiocarb, metomila, metopreno, metoxiclor, metoxifenoazida, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, milbemectina, milbemicina, MKI-245, MON-45700,

25 monocrotofos, moxidectina, MTI-800, naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, niclossamida, nicotina, nitenpiram, nitiazina, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, novaluron, noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, ometoato, oxamila, oxidometon-metila, *Paecilomyces fumosoroseus*, paration-metila, paration (-etila), permetrina (cis-, trans-), petróleo, PH-6045, fenotrina (trans isômero de 1R), fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, butóxido de piperonila, pirimicarb, pirimifos-metila, pirimifos-etila, praletrina, profenofos, pro-

30

mecarb, propafos, propargita, propetanfos, propoxur, protiofos, protoato, protrifenbute, pimetrozina, piraclofos, piresmetrina, piretrum, piridabeno, piri-dalila, piridafention, piridation, pirimidifeno, piriproxifeno, quinalfos, resmetri-na, RH-5849, ribavirina, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, salition, se-
 5 bufos, SI-0009, silafluofeno, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, sulfluramid, sulfotep, sulprofos, SZI-121, tau-fluvalinato, tebufenozida, tebu-fenpirad, tebupirinfos, teflubenzuron, teflutrina, temefos, temivinfos, terbam, terbufos, tetraclorvinfos, tetradifon, tetrametrina, tetrametrina (isomer de 1R), tetrassul, teta-cipermetrina, tiaclopid, tiametoxam, tiapronila, tiatrifos, oxala-
 10 to de hidrogênio de tiociclam, tiodicarb, tiofanox, tiometon, tiossultap-sódio, turingiensina, tolfenpirad, tralocitrina, tralometrina, transflutrina, triaratenó, triazamato, triazofos, triazuron, triclofenidina, triclorfon, triflumuron, trimeta-carb, vamidotion, vaniliprol, verbutina, *Verticillium lecanii*, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, xililcarb, ZA-3274, zeta-
 15 cipermetrina, zolaprofos, ZXI-8901, o composto propilcarbamato de 3-metilfenila (tsumacida Z), o composto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoroetil)-8-azabicyclo[3.2.1]-octano-3-carbonitrila (CAS-Reg. Nº 185982-80-3) e o 3-endo-isômero correspondente (CAS-Reg. Nº 185984-60-5) (cf. WO-96/37494, WO-98/25923) e também preparações que compreendem
 20 extratos de planta inseticidamente ativa, nematódeos, fungos ou vírus.

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

Além disso, os compostos da fórmula (I) de acordo com a inven-
 25 ção também têm atividade antimicótica muito boa. Eles têm um espectro de atividade antimicótica muito vasto em particular contra dermatofitos e leveduras, mofo e fungos bifásicos (por exemplo, contra espécies de *Candida*, como *Candida albicans*, *Candida glabrata*), e *Epidermophyton floccosum*, espécies de *Aspergillus*, como *Aspergillus niger* e *Aspergillus fumigatus*, es-
 30 pécies de *Trichophyton*, como *Trichophyton mentagrophytes*, espécies de *Microsporon* como *Microsporon canis* e *audouinii*. A lista destes fungos de forma alguma limita o espectro micótico abrangido, mas é apenas para ilus-

tração.

Os compostos ativos podem ser usados como tais, na forma de suas formulações ou formas de uso preparadas dele, tais como soluções, suspensões, pós intumescíveis, pastas, pós solúveis, pós e grânulos prontos-para-usar. Aplicação é realizada de uma maneira habitual, por exemplo mediante hidratação, borrifação, atomização, difusão, polvilhamento, espumação, esparramamento, etc. É além disso possível aplicar os compostos ativos pelo método de volume ultrabaixo ou injetar a preparação do composto ativo ou o próprio composto ativo na terra. É também possível tratar as sementes das plantas.

Quando usar os compostos ativos de acordo com a invenção como fungicidas, as taxas de aplicação podem ser variadas dentro de uma gama relativamente extensiva, dependendo do tipo de aplicação. Para o tratamento de partes de plantas, as taxas de aplicação do composto ativo são em geral entre 0,1 e 10 000 g/ha, preferivelmente entre 10 e 1000 g/ha. Para adubação de semente, as taxas de aplicação do composto ativo são em geral entre 0,001 e 50 g por quilograma de semente, preferivelmente entre 0,01 e 10 g por quilograma de semente. Para o tratamento da terra, as taxas de aplicação do composto ativo são em geral entre 0,1 e 10 000 g/ha, preferivelmente entre 1 e 5000 g/ha.

As composições usadas para proteger os materiais industriais em geral compreendem os compostos ativos em uma quantidade de 1 a 95 %, preferivelmente de 10 a 75 %.

As concentrações de aplicação dos compostos ativos de acordo com a invenção dependem da natureza e da ocorrência dos microorganismos a ser controlados e na composição do material a ser protegido. A quantidade ótima para aplicação pode ser determinada através de uma série de testes. Em geral, as concentrações de aplicação são na faixa de 0,001 a 5 % em peso, preferivelmente de 0,05 a 1,0 % em peso, com base no material a ser protegido.

A atividade e o espectro da atividade dos compostos ativos a serem usados de acordo com a invenção na proteção de materiais, ou das

composições, concentrados ou, bem em geral, formulações preparáveis deles, podem ser aumentados, se apropriado, pela adição de outros compostos de forma antimicrobiana ativos, fungicidas, bactericidas, herbicidas, insecticidas ou outros compostos ativos para alargar o espectro de atividade ou efeitos especiais obtendo como, por exemplo, proteção adicional contra insetos. Estas misturas podem ter um espectro de atividade mais amplo que os compostos de acordo com a invenção.

Quando usado como inseticidas em suas formulações comercialmente disponíveis e nas formas de uso preparadas com estas formulações, os compostos ativos de acordo com a invenção podem estar além disso presentes na forma de uma mistura com sinergistas. Sinergistas são compostos através dos quais a atividade dos compostos ativos é aumentada sendo necessário para o sinergista adicionado ser ativo em si.

Quando usado como inseticidas em suas formulações comercialmente disponíveis e nas formas de uso preparadas com estas formulações, os compostos ativos de acordo com a invenção podem além disso estar presentes na forma de uma mistura com inibidores que reduzem a degradação do composto ativo após aplicação no habitat da planta, na superfície das partes das plantas ou nos tecidos das plantas.

O teor de composto ativo das formas de uso preparados das formulações comercialmente disponíveis pode variar dentro de faixas vastas. A concentração do composto ativo das formas de uso pode ser de 0,0000001 até 95 % em peso de composto ativo, preferivelmente entre 0,0001 e 1 % em peso.

Eles são aplicados de uma maneira habitual adaptada para adequar às formas de uso.

Quando usado contra pestes de higiene e pestes de produtos armazenados, o composto ativo é distinguido pela ação residual excelente em madeira e argila como também boa estabilidade a álcali em substratos tratados com cal.

Como já mencionado acima, é possível tratar todas as plantas ou suas partes de acordo com a invenção. Em uma modalidade preferida,

espécies de planta selvagens ou variedades de planta e cultivars de planta que foram obtidos através de métodos de procriação biológica tradicionais, como hibridação ou fusão de protoplasto, e as partes destas variedades e cultivars são tratadas. Em uma outra modalidade preferida, plantas transgê-
5 nicas e cultivars de planta que foram obtidos através de métodos recombinantes, se apropriado em combinação com os métodos convencionais (organismos geneticamente modificados), e suas partes que são tratadas. O termo "partes" ou "partes de plantas" ou "partes de planta" foi explicado acima.

10 Plantas que são tratadas particularmente de preferência de acordo com a invenção são aquelas dos cultivars de planta que estão em cada caso comercialmente disponíveis ou em uso. Cultivars de planta são entendidos como significando plantas com características novas que ou foram criadas por procriação convencional, por mutagênese ou por técnicas de
15 DNA recombinantes. Eles podem ter a forma de cultivars, biótipos e genótipos.

Dependendo das espécies de planta ou cultivars de planta, sua localização e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, nutrição), o tratamento de acordo com a invenção pode também resultar em
20 efeitos de superaditivos ("sinérgicos"). Desse modo, por exemplo, as taxas de aplicação reduzidas e/ou um espectro de atividade alargado e/ou um aumento na atividade das substâncias e composições que podem ser usadas de acordo com a invenção, crescimento de planta melhor, tolerância aumentada em temperaturas altas ou baixas, tolerância aumentada à seca
25 ou à salinidade na água ou solo, desempenho de florescência aumentada, colheita facilitada, maturação acelerada, rendimentos mais altos, qualidade mais alta e/ou valor nutricional melhor dos produtos colhidos, características de armazenamento melhores e/ou processabilidade dos produtos colhidos são possíveis que excedam os efeitos que de fato seriam esperados.

30 As plantas transgênicas ou cultivars de planta preferidos (aqueles obtidos através de métodos recombinantes) a serem tratados de acordo com a invenção incluem todas essas plantas que, devido ao processo de

modificação recombinante, foram material genético dado que confere características particulares, vantajosas, valiosas a estas plantas. Exemplos de tais propriedades são crescimento de planta melhor, tolerância aumentada em temperaturas altas ou baixas, tolerância aumentada à seca ou à salinidade

5 na água ou solo, desempenho de florescência aumentada, colheita facilitada, maturação acelerada, rendimentos mais altos, qualidade mais alta e/ou valor nutricional mais alto dos produtos colhidos, características de armazenamento melhores e/ou processabilidade melhor dos produtos colhidos. Outros exemplos de tais características, exemplos que especialmente devem

10 ser mencionados, são defesa melhor das plantas contra pestes animais e microbianas, como contra insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e/ou vírus e uma tolerância aumentada das plantas a certos compostos ativos herbicidas. Exemplos de plantas transgênicas que podem ser mencionadas são as plantas de plantaço importantes, como cereais (trigo, arroz),

15 milho, feijões-sojas, batata, algodão, tabaco, óleo de colza e plantas de fruta (com as frutas maçãs, pêras, frutas cítricas e uvas), com ênfase particular em milho, feijões-sojas, batatas, algodão, tabaco e óleo de colza. Características que especialmente são enfatizadas são a defesa aumentada das plantas contra insetos, aracnídeos, nematódeos e lesmas e caracóis devido

20 às toxinas que são formadas nas plantas, em particular toxinas que são geradas nas plantas pelo material genético de *Bacillus thuringiensis* (por exemplo, pelos genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb e CryIF e suas combinações; "plantas de Bt" mais abaixo). Outras características que são particularmente enfatizadas são a

25 defesa aumentada de plantas contra fungos, bactérias e vírus pela resistência adquirida sistêmica (SAR), sistemina, fitoalexinas, eliciadores e genes de resistência, proteínas e toxinas correspondentemente expressas. Outras características que são especialmente enfatizadas são a tolerância aumentada das plantas a certos compostos ativos herbicidas, por exemplo imidazolinonas, sulfoniluréias, glifosato ou fosfinotricina (por exemplo, gene de

30 "PAT"). Os genes que conferem as características desejadas em cada caso podem também estar presentes nas plantas transgênicas em combinação

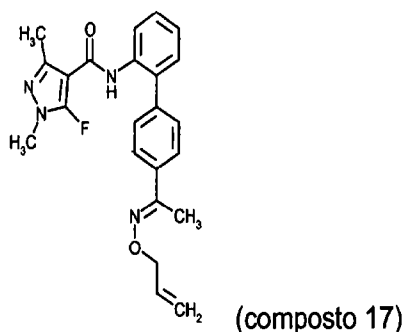
uns com os outros. Exemplos de "plantas de Bt" que podem ser mencionados são cultivars de milho, cultivars de algodão, cultivars de feijão-soja e cultivars de batata que estão comercialmente disponíveis sob os nomes comerciais YIELD GARD® (por exemplo milho, algodão, feijão-soja), KnockOut® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), Nucotn® (algodão) e NewLeaf® (batata). Exemplos de plantas tolerantes a herbicidas que podem ser mencionados são cultivars de milho, cultivars de algodão e cultivars de feijão-soja que estão comercialmente disponíveis sob os nomes comerciais Roundup Ready® (tolerância a glifosato, por exemplo milho, algodão, feijão-soja), Liberty Link® (tolerância a fosfotricina, por exemplo óleo de colza), IMI® (tolerância a imidazolinonas) e STS® (tolerância a sulfoniluréias, por exemplo, milho). Plantas resistentes a herbicidas (plantas criadas de uma maneira convencional para tolerância a herbicida) que podem ser mencionadas incluem também as variedades comercialmente disponíveis sob o nome Clearfield® (por exemplo milho). Naturalmente, estas declarações também se aplicam aos cultivars de planta tendo estas características genéticas ou características genéticas ainda a serem desenvolvidas cujos cultivars de planta serão desenvolvidas e/ou comercializados no futuro.

As plantas listadas podem ser tratadas particularmente de forma vantajosa de acordo com a invenção com os compostos da fórmula geral (I) ou as misturas de compostos ativos de acordo com a invenção. As faixas preferidas declaradas acima para os compostos ativos e misturas também se aplicam ao tratamento destas plantas. Especificamente pode ser dada ênfase particular ao tratamento de plantas com os compostos ou misturas mencionadas no texto presente.

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

Exemplos de Preparação

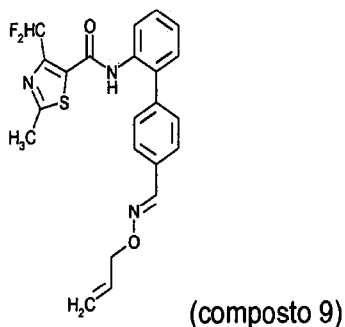
Exemplo 1



Processo (a)

- 0,300 g (1,126 mmol) de oxima de *O*-alila de 1-(2'-aminobifenil-4-il)etanona e 0,114 g (1,126 mmol) de trietilamina são inicialmente carregados em 20 ml de tolueno. Em temperatura ambiente, 0,199 g (1,126 mmol)
- 5 de cloreto de 5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carbonila é adicionado à mistura de reação, e a mistura é agitada a 50° C durante 2 h. Para processamento, a mistura de reação é esfriada em temperatura ambiente, lavada duas vezes com em cada caso 100 ml de água, seca em sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo é recristalizado de *n*-hexano.
- 10 Isto dá 0,44 g (94,4 % de teoria) de *N*-(4'-{1-(aliloxiimino)-etil}-bifenil-2-il)-5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (composto 17, Tabela 1) de ponto de fundição 118° C.

Exemplo 2



Processo (a)

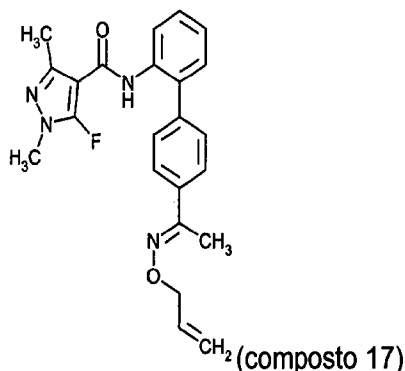
- 0,300 g (1,000 mmol) de oxima de *O*-alila de 2'-aminobifenil-4-carbaldeído (III-1) e 0,120 g (1,000 mmol) de trietilamina são inicialmente carregados em 15 ml de tolueno. Em temperatura ambiente, 0,251 g (1,000 mmol) de cloreto de 4-difluorometil-2-metiltiazol-5-carbonila, dissolvido em 5 ml de tolueno, é adicionado à mistura de reação, e a mistura é aquecida a 50° C e agitada durante 3 h. Para processamento, a mistura de
- 20

reação é esfriada para temperatura ambiente e lavada duas vezes com em cada caso 80 ml de água, e a fase orgânica é seca em sulfato de magnésio e depois concentrada sob pressão reduzida. O resíduo é purificado através de cromatografia de coluna em sílica-gel (hexano/éter de terc-butila de metila 3:1).

Isto dá 0,30 g (49,6 % de teoria) de N-[4'-(aliloxiimino-metil)-bifenil-2-il]-4-difluorometil-2-metiltiazol-5-carboxamida (composto 9, Tabela 1).

$^1\text{H-RMN}$ (DMSO-D_6): $\delta = 2,71$ ppm (s, 3H)

10 Exemplo 3



Processo (b)

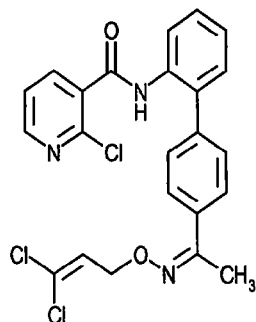
Em temperatura ambiente, 1,00 g (2,75 mmoles) de N-(2-iodofenil)-5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 0,61 g (2,78 mmoles) de ácido 4-[1-(aliloxiimino)etil]fenilborônico e 0,20 g de tetraquis(trifenilfosfina)paládio(0) são inicialmente carregados em 15 ml de dimetoxietano.

Em temperatura ambiente, uma solução de 1,18 g (11,14 mmoles) de carbonato de sódio em 15 ml de água é adicionada com agitação. A mistura é aquecida para temperatura de refluxo e agitada durante 15 h. Para processamento, a mistura é esfriada para temperatura ambiente e extraída duas vezes com em cada caso 50 ml de éter dietílico. As fases orgânicas são lavadas com água, secas em sulfato de sódio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo é purificado através de cromatografia de coluna em sílica-gel (hexano/éter de terc-butila de metila 3:1).

Isto dá 0,13 g (10,5 % de teoria) de N-(4'-[1-(aliloxiimino)etil]-

til)bifenil-2-il)-5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (composto 17, Tabela 1) de $\log P$ (pH 2,3) = 3,80.

Exemplo 4

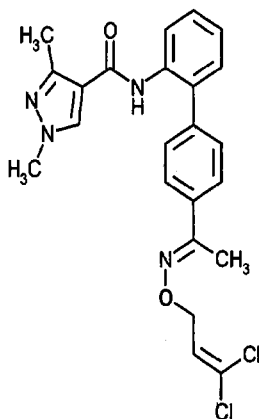


(composto 63)

Processo (d)

- 5 0,79 g (2,24 mmoles) de *N*-(4'-acetilbifenil-2-il)-2-cloronicotinamida (VIII-1), 0,40 g (2,24 mmoles) de hidrocloreto de *O*-(3,3-dicloroalil)hidroxilamina e 0,22 g de acetato de sódio são inicialmente carregados em uma mistura de 5 ml de metanol e 2 ml de água e agitados em temperatura ambiente durante 15 h. Para processamento, a mistura é agitada em 30 ml de água e depois extraída com 30 ml de diclorometano. A fase orgânica é lavada com 15 ml de água, e as fases são separadas. A fase orgânica é seca em sulfato de sódio e depois concentrada sob pressão reduzida. O resíduo é triturado em um pouco de hexano quente e é esfriado, e o resíduo é separado por filtração com sucção.
- 15 Isto dá 0,68 g (63,9 % de teoria) de 2-cloro-*N*-{4'-[1-(3,3-dicloroalil)oxiimino]etil}-bifenil-2-il}nicotinamida (composto 63, Tabela 1) de $\log P$ (pH 2,3) = 4,43.

Exemplo 5



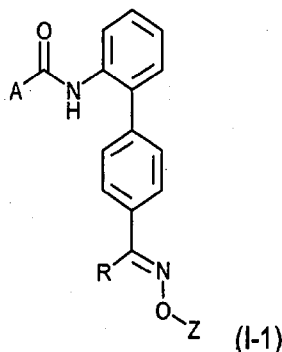
(composto 54)

Processo (e)

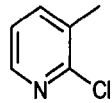
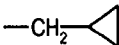
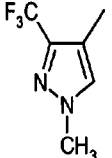
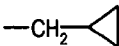
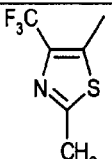
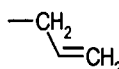
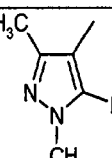
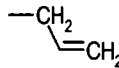
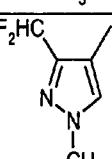
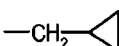
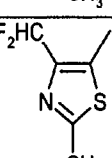
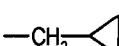
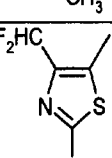
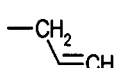
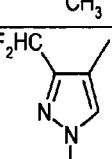
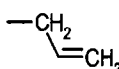
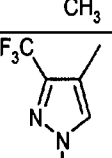
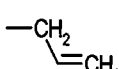
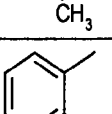
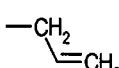
Em temperatura ambiente, 1,00 g (2,87 mmoles) de N-{4'-[1-(hidroxiimino)etil]bifenil-2-il}-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida e 0,60 g de carbonato de potássio (4,31 mmoles) são inicialmente carregados em 50 ml de acetonitrila e 0,417 g de 1,1,3-tricloropropeno (2,870 mmoles), dissolvidos em 5 ml de acetonitrila, é depois adicionado. A mistura é aquecida para temperatura de refluxo e agitada durante 15 h. Para processamento, a mistura é esfriada e separada por filtração com sucção através de um filtro de Nutsche, e o líquido mãe é concentrado sob pressão reduzida. O resíduo

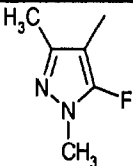
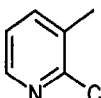
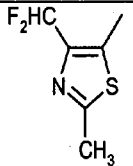
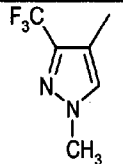
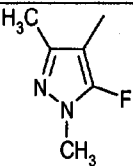
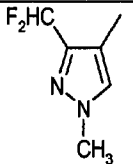
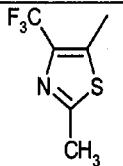
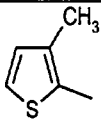
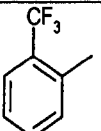
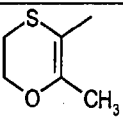
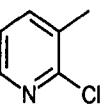
Isto dá 0,66 g (47,1 % de teoria) de N-(4'-[1-[3,3-dicloroaliloxiimino]etil]bifenil-2-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (composto 54, Tabela 1) como um sólido de logP (pH 2,3) = 3,97.

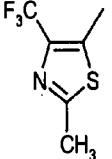
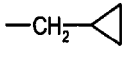
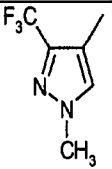
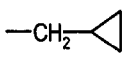
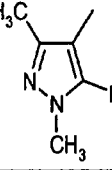
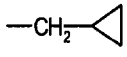
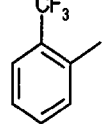
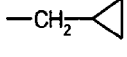
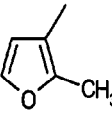
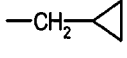
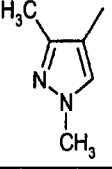
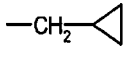
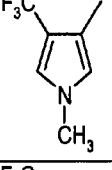
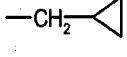
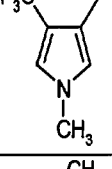
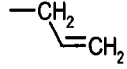
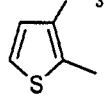
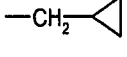
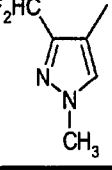
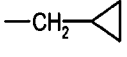
As bifenilcarboxamidas da fórmula (I 1) listadas na tabela abaixo são igualmente preparadas de acordo com os Exemplos 1 a 5 e de acordo com as descrições e métodos de processo gerais.

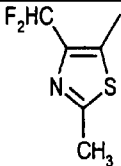
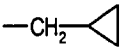
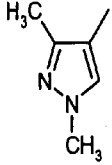
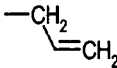
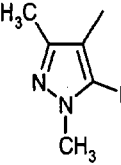
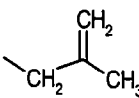
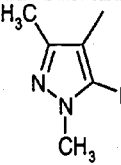
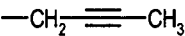
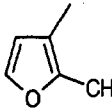
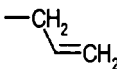
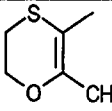
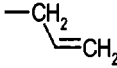
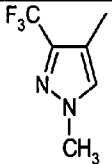
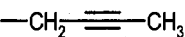
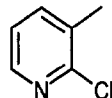
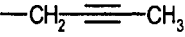
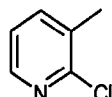
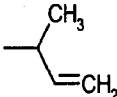
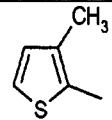
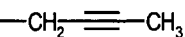
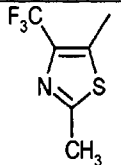
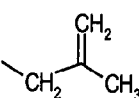
Tabela 1

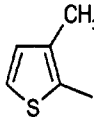
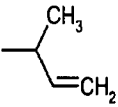
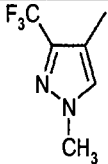
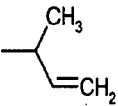
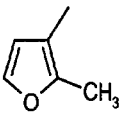
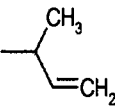
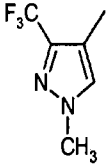
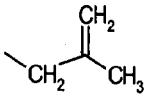
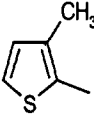
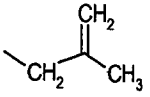
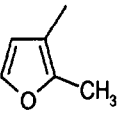
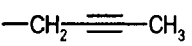
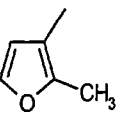
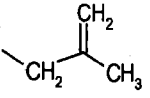
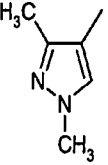
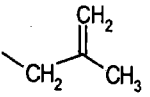
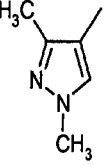
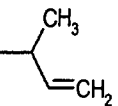
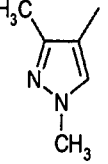
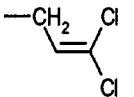
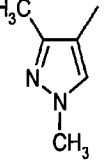
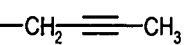
Nº	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
1		H		3,77	
2		H		4,16	

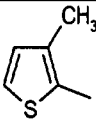
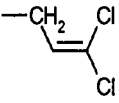
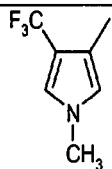
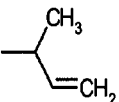
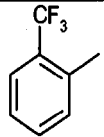
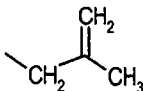
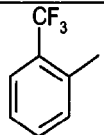
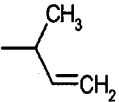
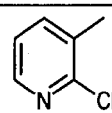
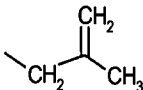
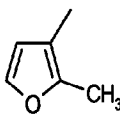
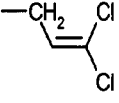
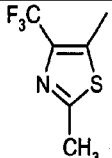
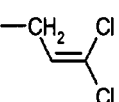
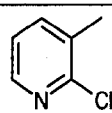
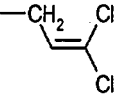
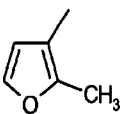
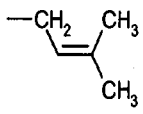
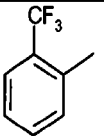
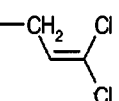
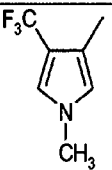
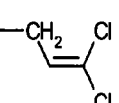
Nº	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
3		H		3,57	
4		H		3,77	
5		H		3,91	107-109
6		H		3,47	88-90
7		H		3,53	
8		H		3,87	
9		H		3,65	
10		H		3,32	
11		H		3,53	126
12		H		3,30	88-90

N°	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
13		H	$-\text{CH}_2\equiv\text{CH}$	3,04	
14		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3,61	78-80
15		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3,92	104-106
16		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3,81	155
17		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3,80	118
18		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	3,57	135-137
19		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	4,19	126-128
20		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	4,54	76
21		CH ₃	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	4,31	118-120
22		CH ₃	$-\text{CH}_2$ 	4,69	78-79
23		CH ₃	$-\text{CH}_2$ 	3,86	96-97

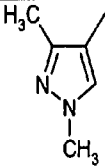
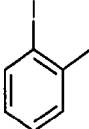
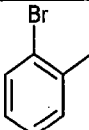
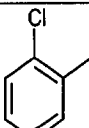
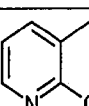
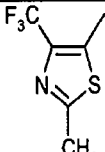
N°	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
24		CH ₃		4,45	122-124
25		CH ₃		4,05	149-150
26		CH ₃		4,09	141-142
27		CH ₃		4,56	115-116
28		CH ₃		4,43	116-117
29		CH ₃		3,42	142-144
30		CH ₃		3,82	154-155
31		CH ₃		4,06	152
32		CH ₃		4,87	137-138
33		CH ₃		3,82	170-171

Nº	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
34		CH ₃		4,19	132-133
35		CH ₃		3,16	108-110
36		CH ₃		4,18	
37		CH ₃		3,63	
38		CH ₃		4,14	
39		CH ₃		4,38	
40		CH ₃		3,67	
41		CH ₃		3,48	
42		CH ₃		2,89	
43		CH ₃		4,33	
44		CH ₃		3,49	

N°	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
45		CH ₃		4,90	
46		CH ₃		4,15	
47		CH ₃		4,52	
48		CH ₃		4,14	
49		CH ₃		4,92	
50		CH ₃		3,95	
51		CH ₃		4,51	
52		CH ₃		3,52	
53		CH ₃		3,53	
54		CH ₃		3,97	
55		CH ₃		3,06	

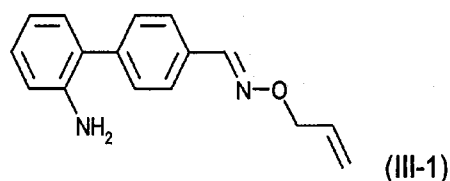
N°	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
56		CH ₃		5,39	
57		CH ₃		4,41	
58		CH ₃		4,64	
59		CH ₃		4,65	
60		CH ₃		3,95	
61		CH ₃		4,98	
62		CH ₃		3,81	
63		CH ₃		4,43	
64		CH ₃		4,84	
65		CH ₃		5,05	
66		CH ₃		4,83	

Nº	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
67		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,72	108
68		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,16	130-132
69		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,45	113-115
70		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,36	137-138
71		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,27	109
72		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,14	107
73		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,83	140-142
74		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,81	108-110
75		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,6	131-133
76		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,94	109-110
77		CH ₃	$-\text{CH}_2-\equiv\text{CH}$	3,59	

Nº	A	R	Z	logP (pH 2,3)	p.f. (° C)
78		CH ₃	—CH ₂ —≡CH	2,75	98-101
79		CH ₃	—CH ₂ —≡CH	3,81	122
80		CH ₃	—CH ₂ —≡CH	3,74	116-118
81		CH ₃	—CH ₂ —≡CH	3,73	120
82		H	—CH ₂ —≡CH	2,92	126-128
83		H	—CH ₂ —≡CH	3,48	

Preparação de Materiais de Partida da Fórmula (III)

Exemplo (III-1)



- 16,50 g (80,48 mmoles) de ácido 4-aliloxiiminometilfenil-borônico (V-1) e 13,84 g (80,48 mmoles) de 2-bromoanilina juntos com 0,50 g (0,43 mmol) de tetraquis(trifenilfosfina)paládio são inicialmente carregados em uma mistura de 100 ml de 1,2-dimetoxietano e 100 ml de água. Após adição de 34,12 g (321,92 mmoles) de carbonato de sódio, a mistura é aquecida em refluxo por 12 h. Para processamento, a mistura de reação é esfriada para temperatura ambiente e extraída duas vezes com em cada caso 200 ml de éter dietílico. As fases de éter combinadas são lavadas com 400 ml de água e depois secas em sulfato de magnésio e concentradas sob

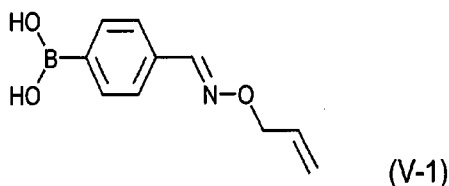
pressão reduzida. O resíduo é cromatografado em sílica-gel (hexano/éter de terc-butila de metila 3:1).

Isto dá 4,3 g (15 % de teoria) de oxima de O-alila de 2'-aminobifenil-4-carbaldeído.

5 $^1\text{H-RMN}$ (DMSO-D_6): $\delta = 8,33$ ppm (s, 1H)

Preparação de Materiais de Partida da Fórmula (V)

Exemplo (V-1)



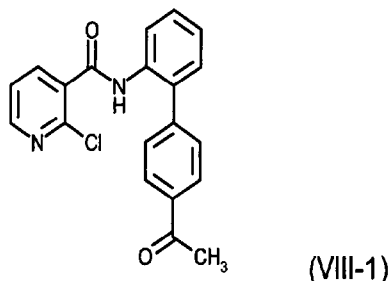
Em uma mistura de 100 ml de metanol e 40 ml de água, 13,69 g (91,28 mmoles) de ácido formilfenilborônico, 10,0 g de hidrocloreto de O-alilidroxilamina (91,28 mmoles) e 9,36 g (114,10 mmoles) de acetato de sódio são agitados em temperatura ambiente por 12 h. Para processamento, a mistura é concentrada sob pressão reduzida e o resíduo é triturado com 150 ml de água, separado por filtração com sucção através de uma frita de vidro, lavado com uma pouca água e seco em um disco de argila.

15 Isto dá 16,5 g (84,6 % de teoria) de ácido 4-aliloxiiminometilfenilborônico.

$^1\text{H-RMN}$ (DMSO-d_6): $\delta = 8,27$ ppm (s, 1H)

Preparação dos Materiais de Partida da Fórmula (VIII)

Exemplo (VIII-1)



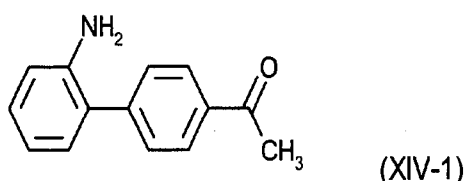
20 Em temperatura ambiente, 8,33 g (47,33 mmoles) de cloreto de 2-cloronicotinoíla, dissolvido em 20 ml de tolueno, são adicionados em um período de 5 minutos a 10,00 g (47,33 mmoles) de 1-(2'-aminobifenil-4-il)etanona (XIV-1) e 4,79 g (47,33 mmoles) de trietilamina, dissolvidos em 150 ml de tolueno. A mistura é aquecida para 50° C e deixada reagir por

10 h. Para processamento, a mistura é esfriada, 100 ml de água são adicionados e as fases são separadas. A fase orgânica é seca em sulfato de sódio e concentrada sob pressão reduzida. O resíduo é recristalizado de n-hexano.

- 5 Isto dá 13,7 g (82,3 % de teoria) de *N*-(4'-acetil-bifenil-2-il)-2-cloronicotinamida de logP (pH 2,3) = 2,12.

Preparação de Materiais de Partida da Fórmula (XIV)

Exemplo (XIV-1)



- 15,74 g (91,48 mmoles) de 2-bromoanilina, 15,00 g de ácido 4-acetilfenilborônico (91,48 mmoles) e 0,529 g de tetraquis(trifenilfosfina)-paládio(0) (0,457 mmol) são inicialmente carregados em 150 ml de dimetoxietano. 38,78 g (365,93 mmoles) de carbonato de sódio, dissolvido em 150 ml de água, são adicionados em um período de 5 minutos. A mistura é aquecida para temperatura de refluxo e agitada durante 15 h. Para processamento, a mistura é esfriada e extraída duas vezes com em cada caso 150 ml de éter. As fases orgânicas combinadas são lavadas com água, secas em sulfato de sódio e concentradas sob pressão reduzida. O resíduo é purificado através de cromatografia de coluna em sílica-gel (ciclohexano/acetato de etila 3:1).

- 20 Isto dá 15,0 g (72,6 % de teoria) de 1-(2'-aminobifenil-4-il)etanona de logP (pH 2,3) = 1,80.

Os valores de logP dados na Tabela 1 foram determinados com Anexo de Diretiva de EEC 79/831 V.A8 por HPLC (Cromatografia líquida de alto desempenho) em uma coluna de fase reversa (C 18). Temperatura: 43°

- 25 C.

Fases móveis para a determinação na faixa ácida (pH 2,3): 0,1 % de ácido fosfórico aquoso, acetonitrila; gradiente linear de 10 % de acetonitrila a 90 % de acetonitrila.

Calibração foi realizada usando alcan-2-onas não-ligadas (tendo

3 a 16 átomos de carbono) com valores de logP conhecidos (determinação dos valores de logP pelos tempos de retenção usando interpolação linear entre duas alcanonas sucessivas).

- 5 Os valores de λ máximos foram determinados nos máximos dos sinais cromatográficos usando os espectros de UV de 200 nm a 400 nm.

Exemplos de Uso

Exemplo A

Teste de Venturia (maçã) / Protetor

- 10 Solventes: 24,5 partes em peso de acetona
24,5 partes em peso de dimetilacetamida
Emulsificante: 1,0 parte em peso de éter de poliglicol de alquilarila

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

- Para testar a atividade protetora, plantas jovens são borrifadas com a preparação de composto ativo na taxa de aplicação declarada. Após o revestimento por pulverização ter seco, as plantas são inoculadas com
20 uma suspensão de conídeo aquosa do patógeno de sarna em maçã *Venturia inaequalis* e depois permanecem em uma cabine de incubação em cerca de 20° C e 100 % de umidade atmosférica relativa por 1 dia.

As plantas são depois colocadas em uma estufa a cerca de 21° C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 90 %.

- 25 Avaliação é realizada 10 dias após a inoculação. 0 % significa uma eficácia que corresponde ao controle, enquanto que uma eficácia de 100 % significa que nenhuma infecção é observada.

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir de acordo com a invenção dos Exemplos de Preparação mostram atividade boa:

Tabela A:

Teste de Venturia (Maçã) / Protetor

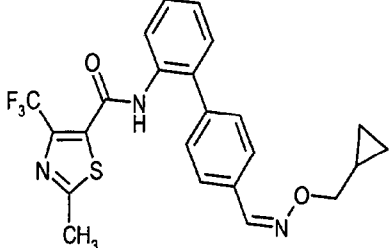
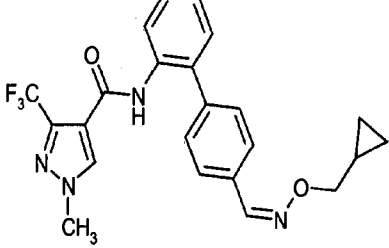
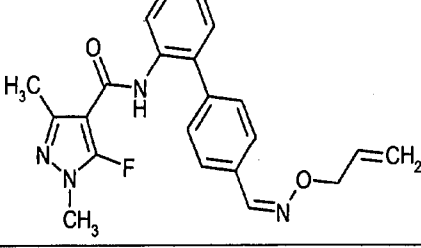
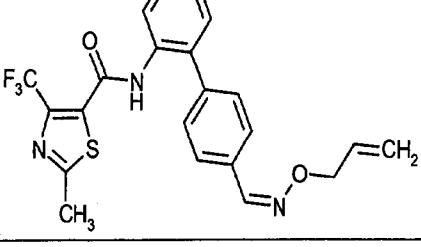
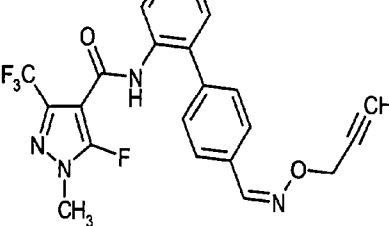
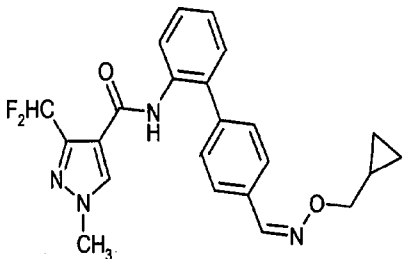
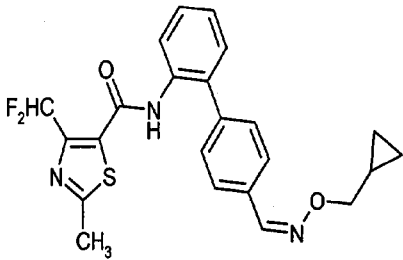
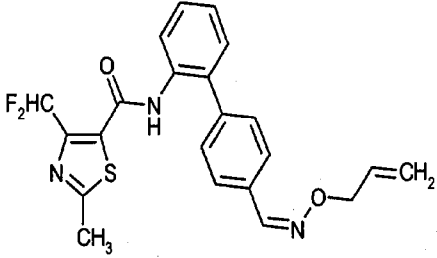
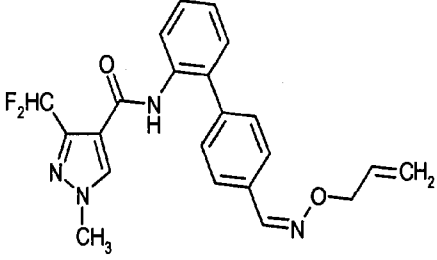
Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
2 	100	98
4 	100	91
6 	100	97
5 	100	100
13 	100	100

Tabela A:

Teste de Venturia (Maçã) / Protetor

Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
7 	100	100
8 	100	100
9 	100	100
10 	100	100

Exemplo BTeste de Botrytis (Feijão) / Protetor

Solventes: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

5 Emulsificante: 1,0 parte em peso de éter de poliglicol de alquilarila

Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1

parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades declaradas de solventes e emulsificante, e o concentrado é diluído com água na concentração desejada.

- 5 Para testar a atividade protetora, as plantas jovens são borrifadas com a preparação de composto ativo na taxa de aplicação declarada. Após o revestimento por pulverização ter seco, são colocados 2 pedaços pequenos de ágar colonizados por *Botrytis cinerea* sobre cada folha. As plantas inoculadas são colocadas em uma câmara escura em cerca de 20° C e 100 % umidade atmosférica relativa.
- 10 2 dias após a inoculação, o tamanho das áreas infectadas nas folhas é avaliado. 0 % significa uma eficácia que corresponde a do controle, enquanto que uma eficácia de 100 % significa que nenhuma infecção é observada.

- 15 Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir de acordo com a invenção dos Exemplos de Preparação mostram atividade boa:

Tabela B:

Teste de Botrytis (Feijão) / Protetor

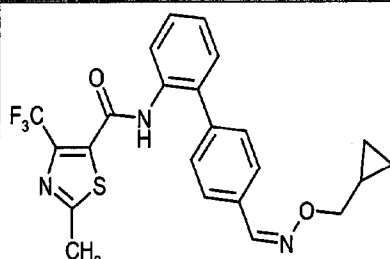
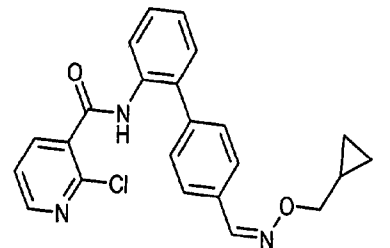
Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
2 	500	98
3 	500	95

Tabela B:

Teste de Botrytis (Feijão) / Protetor

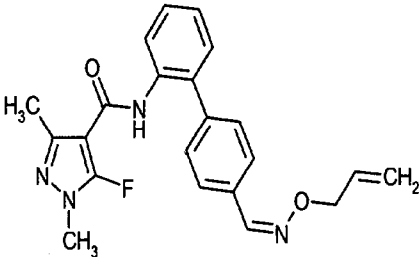
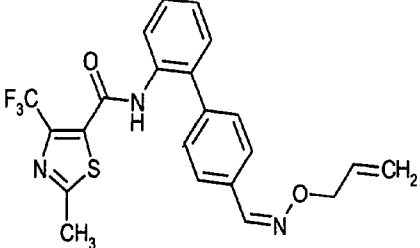
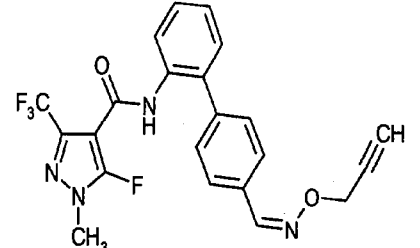
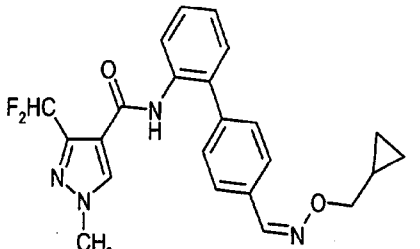
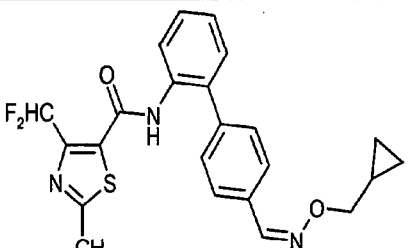
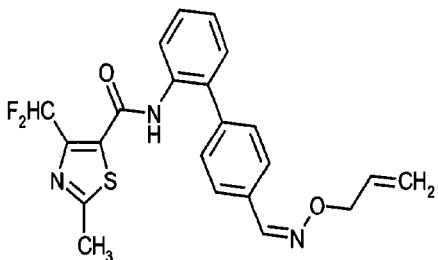
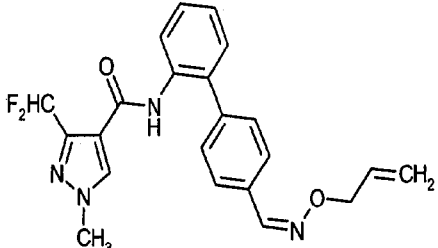
Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
6 	500	98
5 	500	83
13 	500	100
7 	500	96
8 	500	85

Tabela B:

Teste de Botrytis (Feijão) / Protetor

Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
9 	500	95
10 	500	95

Exemplo C

Teste de Alternaria (Tomate) / Protetor

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

Emulsificante: 1 parte em peso de éter de poliglicol de alquila

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

10 Para testar a atividade protetora, plantas de tomate jovens são borrifadas com a preparação de composto ativo na taxa de aplicação declarada. 1 dia após o tratamento, as plantas são inoculadas com uma suspensão de esporo de *Alternaria solani* e depois permanecem a 100 % de umidade atmosférica relativa e 20° C durante 24 horas. As plantas depois permanecem a 96 % de umidade atmosférica relativa e uma temperatura de 20° C.

15 Avaliação é realizada 7 dias após a inoculação. 0 % significa

uma eficácia que corresponde a do controle, enquanto que uma eficácia de 100 % significa que nenhuma infecção é observada.

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir de acordo com a invenção dos Exemplos de Preparação mostram atividade boa:

Tabela C:

Teste de *Alternaria* (Tomate) / Protetor

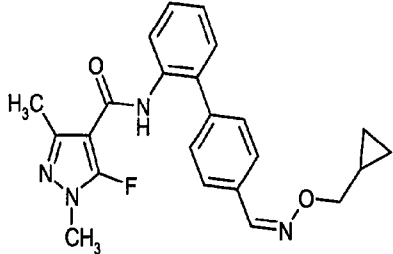
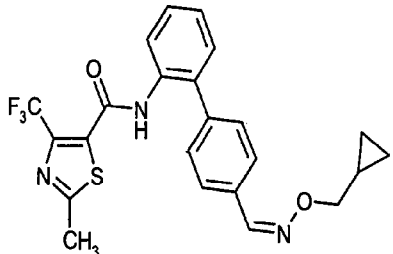
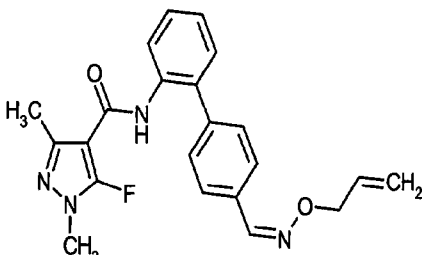
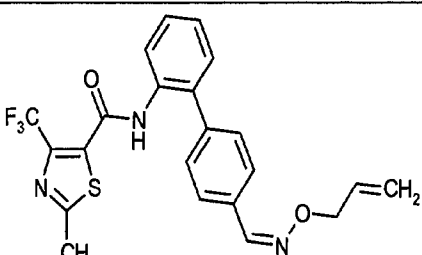
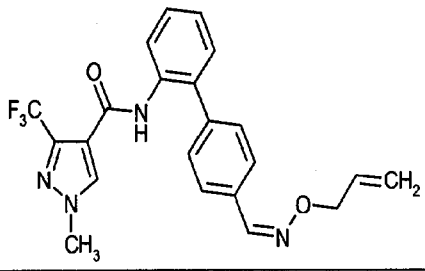
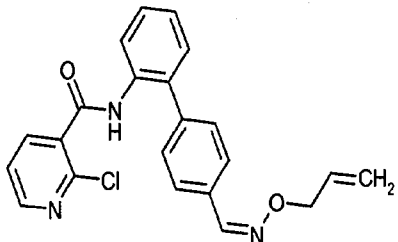
Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
1 	750	90
2 	750	90
6 	750	100
5 	750	100

Tabela C:

Teste de *Alternaria* (Tomate) / Protetor

Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
11 	750	100
12 	750	100

Exemplo DTeste de *Puccinia* (Trigo) / Protetor

Solventes: 25 partes em peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsificante: 0,6 partes em peso de éter de poliglicol de alquilarila

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

- 10 As plantas jovens são inoculadas com uma suspensão de esporo de *Puccinia recondita* em uma solução de 0,1% de intensidade de ágar aquosa para testar a atividade protetora. Após o revestimento por pulverização ter sido seco, as plantas são borrifadas com a preparação de composto ativo na taxa de aplicação declarada. As plantas permanecem em uma câmara de incubação a 20° C e 100 % de umidade atmosférica relativa por 24
- 15 horas.

As plantas são depois colocadas em uma estufa em uma tempe-

ratura de cerca de 20° C e uma umidade atmosférica relativa de 80 % para promover o desenvolvimento de pústulas ferruginosas.

Avaliação é realizada 10 dias após a inoculação. 0 % significa uma eficácia que corresponde a do controle, enquanto que uma eficácia de 100 % significa que nenhuma infecção é observada.

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir de acordo com a invenção dos Exemplos de Preparação mostram atividade boa:

Tabela D:

Teste de Puccinia (Trigo) / Protetor

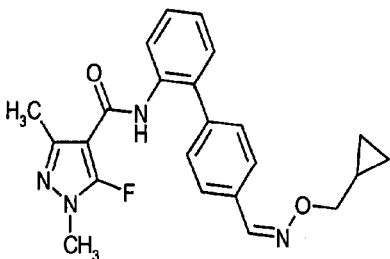
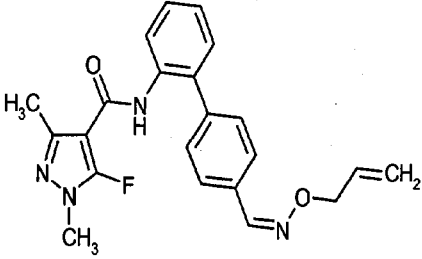
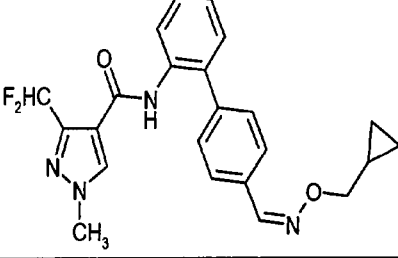
Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
1 	500	100
6 	500	100
7 	500	100

Tabela D:

Teste de Puccinia (Trigo) / Protetor

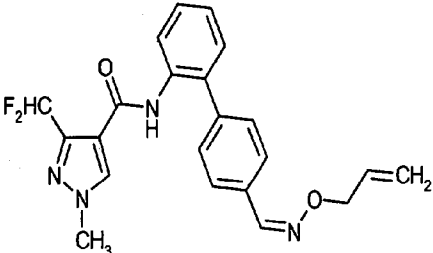
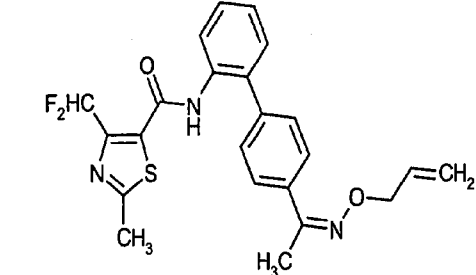
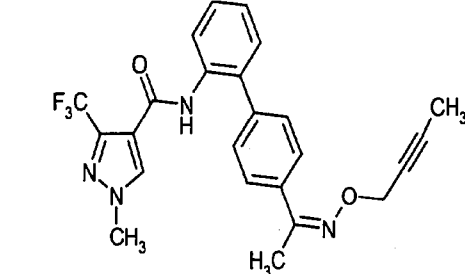
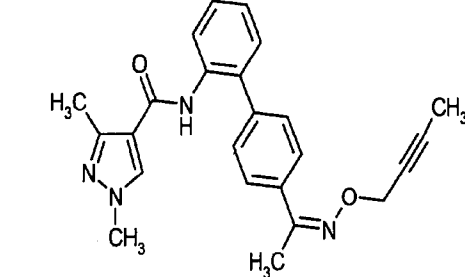
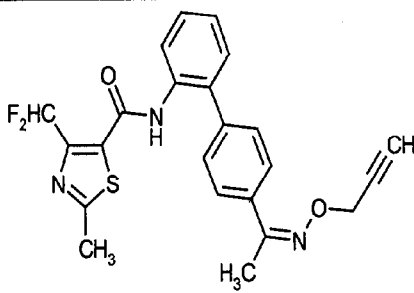
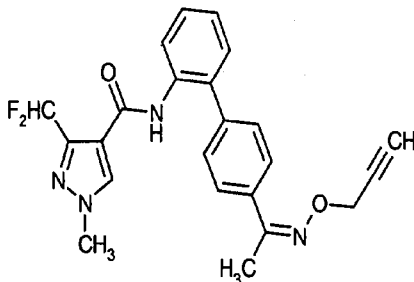
Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
10 	500	100
15 	500	100
40 	500	100
55 	500	100

Tabela D:

Teste de Puccinia (Trigo) / Protetor

Composto ativo	Taxa de aplicação do composto ativo em g/ha	Eficácia em %
69 	500	100
72 	500	100

Exemplo ETeste de Plutella

Solventes: 100 partes em peso de acetona

1900 partes em peso de metanol

- 5 Para produzir uma preparação adequada de composto ativo, 1 parte em peso de composto ativo é misturada com a quantidade declarada de solvente, e o concentrado é diluído com metanol nas concentrações desejadas.

- Uma quantidade declarada da preparação de composto ativo da
- 10 concentração desejada é pipetada em uma quantidade unificada de alimentação sintética. Após o metanol ter evaporado, aproximadamente 200-300 ovos da mariposa costa de diamante (*Plutella xylostella*) são colocados sobre a alimentação.

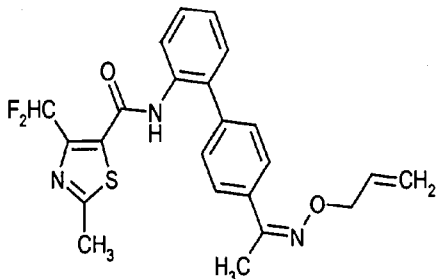
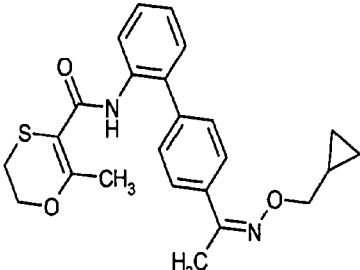
- Após o período desejado de tempo, a matança dos ovos em % é
- 15 determinada. 100 % significa que todos os animais foram mortos; 0% signifi-

ca que nenhum dos animais foram mortos.

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir dos Exemplos de Preparação mostram atividade boa:

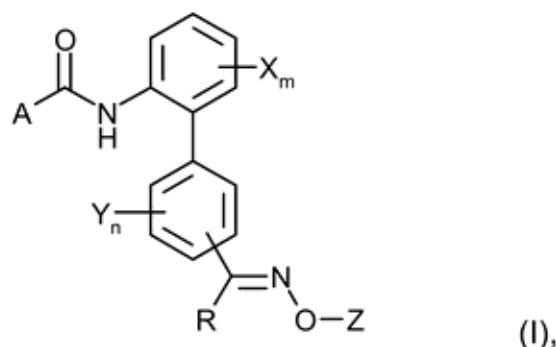
Tabela E:

Teste de Plutella

Composto ativo	Concentração do composto ativo em ppm	Taxa de Matança em % após 7d
15 	1000	95
22 	1000	95

REIVINDICAÇÕES

1. Bifenilcarboxamida, caracterizada pelo fato de que apresenta a fórmula (I)



na qual

R representa hidrogênio, C₁-C₆-alquila ou C₁-C₃-haloalquila tendo em cada caso 1 a 7 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

Z representa C₃-C₈-alquenila, C₃-C₈-alquinila, C₃-C₈-haloalquenila, C₃-C₈-haloalquinila tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou (C₃-C₈-cicloalquil)(C₁-C₄-alquila),

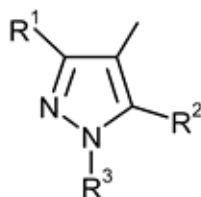
10 X e Y independentemente um do outro representam halogênio, ciano, nitro, C₁-C₈-alquila, C₁-C₈-alcóxi, C₁-C₈-alquiltio, C₁-C₆-haloalquila, C₁-C₆-haloalcóxi ou C₁-C₆-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

m representa 0, 1, 2, 3 ou 4, onde x representa radicais idênticos
15 ou diferentes se m representar 2, 3 ou 4,

n representa 0, 1, 2, 3 ou 4, onde y representa radicais idênticos ou diferentes se n representar 2, 3 ou 4,

e

A representa um radical da fórmula



20 na qual

R¹ representa hidrogênio, ciano, halogênio, nitro, C₁-C₄-alquila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, aminocarbonila, aminocarbo-

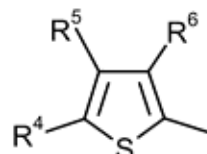
nil-C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio, e

R² representa hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-alquiltio e

- 5 R³ representa hidrogênio, C₁-C₄-alquila, hidróxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, ou representa C₁-C₄-haloalquila, halo(C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquila), halo(C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila) tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio ou representa fenila,

10 ou

A representa um radical da fórmula



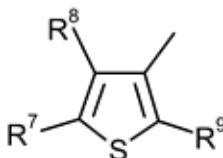
na qual

- R⁴ e R⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R⁶ representa halogênio, ciano ou C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

- 20 A representa um radical da fórmula

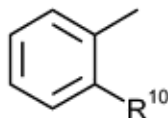


na qual

- R⁷ e R⁸ independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

- 25 R⁹ representa hidrogênio, halogênio ou C₁-C₄-alquila,
ou

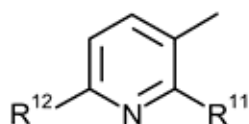
A representa um radical da fórmula



na qual

R^{10} representa hidrogênio, halogênio, hidroxila, ciano, C₁-C₆-alquila, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio,
ou

A representa um radical da fórmula

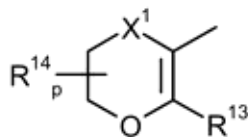


na qual

R^{11} representa halogênio, hidroxila, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi, C₁-C₄-haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio e

R^{12} representa hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-alquilsulfinila, C₁-C₄-alquilsulfonila ou representa C₁-C₄-haloalquila, C₁-C₄-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de halogênio,
ou

A representa um radical da fórmula



na qual

R^{13} representa C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

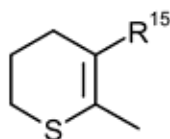
R^{14} representa C₁-C₄-alquila,

X^1 representa S (enxofre), representa SO, SO₂ ou CH₂ e

p representa 0, 1 ou 2,

ou

A representa um radical da fórmula

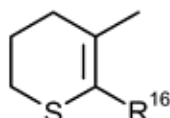


na qual

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

ou

5 A representa um radical da fórmula

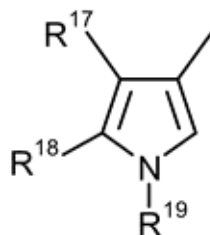


na qual

R^{16} representa C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

10 A representa um radical da fórmula



na qual

R^{17} representa halogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

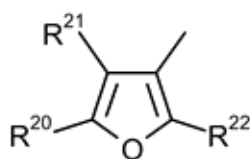
15 R^{18} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

R^{19} representa hidrogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, hidróxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, di(C_1 - C_4 -alquil)aminossulfonila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila ou representa fenilsulfonila opcionalmente substituída ou benzoíla,

20

ou

A representa um radical da fórmula

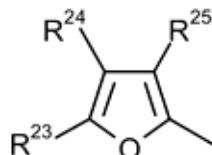


na qual

R²⁰ e R²¹ independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, amino, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

- 5 R²² representa hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio, ou

A representa um radical da fórmula



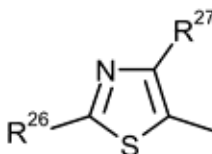
na qual

- 10 R²³ e R²⁴ independentemente um do outro representam hidrogênio, halogênio, amino, nitro, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R²⁵ representa hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

- 15 ou

A representa um radical da fórmula



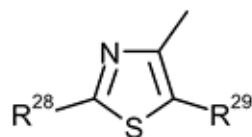
na qual

- 20 R²⁶ representa hidrogênio, halogênio, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R²⁷ representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula

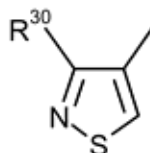


na qual

R^{28} representa hidrogênio, halogênio, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio e

R^{29} representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio, ou

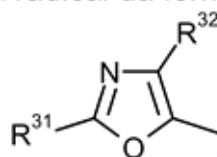
A representa um radical da fórmula



na qual

R^{30} representa halogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio, ou

A representa um radical da fórmula

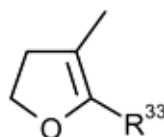


na qual

R^{31} representa hidrogênio ou C₁-C₄-alquila e R^{32} representa halogênio ou C₁-C₄-alquila,

ou

A representa um radical da fórmula



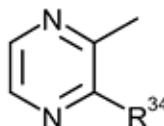
na qual

R^{33} representa C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-haloalquila tendo 1 a 5

átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



na qual

- 5 R^{34} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de halogênio.

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

- 10 R representa hidrogênio, C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_3 -haloalquila tendo em cada caso 1 a 7 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

Z representa C_3 - C_6 -alquenila, C_3 - C_6 -alquinila, C_3 - C_6 -haloalquenila, C_3 - C_6 -haloalquinila tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou (C_3 - C_6 -cicloalquil)-(C_1 - C_4 -alquil),

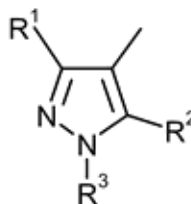
- 15 X e Y independentemente um do outro representam flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi ou C_1 - C_2 -haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

m representa 0, 1, 2 ou 3, onde x representa radicais idênticos ou diferentes se m representar 2 ou 3,

- 20 n representa 0, 1, 2 ou 3, onde y representa radicais idênticos ou diferentes se m representar 2 ou 3,

e

A representa um radical da fórmula



na qual

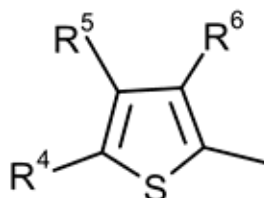
- 25 R^1 representa hidrogênio, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, ciclopropila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, aminocarbonila,

aminocarbonilmetila, aminocarboniletila, C₁-C₂-haloalquil C₁-C₂-haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, trifluorometiltio ou difluorometiltio,

5 R² representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi, metiltio ou etiltio e

R³ representa hidrogênio, metila, etila, n-propila, isopropila, hidroximetila, hidroxietila, ciclopropila, ciclopentila, cicloexila, C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo ou representa fenila, ou

10 A representa um radical da fórmula

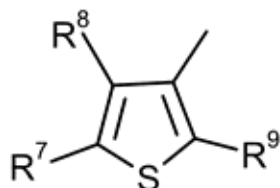


na qual

R⁴ e R⁵ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

15 R⁶ representa flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, metila, etila, trifluorometila ou C₁-C₂-haloalcóxi tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

A representa um radical da fórmula

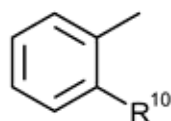


na qual

20 R⁷ e R⁸ independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R⁹ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila, ou

25 A representa um radical da fórmula

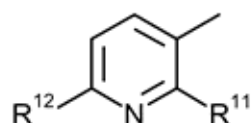


na qual

R^{10} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi, C_1 - C_2 -haloalquiltio tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

5 ou

A representa um radical da fórmula



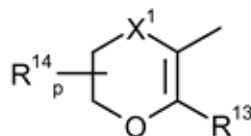
na qual

R^{11} representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, tri-
10 fluorometiltio, difluorometiltio e

R^{12} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, C_1 - C_4 -alquila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, C_1 - C_2 -alquilsulfinila, C_1 - C_2 -alquilsulfonila, C_1 - C_2 -haloalquila, C_1 - C_2 -haloalcóxi tendo em cada caso 1 a 5
15 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

A representa um radical da fórmula



na qual

R^{13} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo
20 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

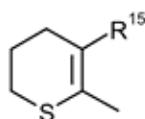
R^{14} representa metila ou etila,

X^1 representa S (enxofre), representa SO, SO₂ ou CH₂ e

p representa 0, 1 ou 2,

ou

25 A representa um radical da fórmula

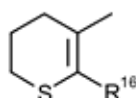


na qual

R^{15} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

5 A representa um radical da fórmula

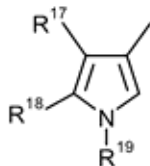


na qual

R^{16} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

10 A representa um radical da fórmula



na qual

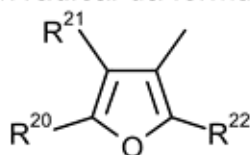
R^{17} representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, isopropila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

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

R^{19} representa hidrogênio, metila, etila, C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C_1 - C_2 -alcóxi- C_1 - C_2 -alquila, hidroximetila, hidroxietila, metilsulfonila ou dimetilaminossulfonila,

20 ou

A representa um radical da fórmula

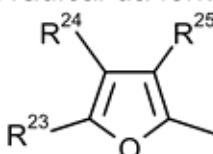


na qual

R^{20} e R^{21} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

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

A representa um radical da fórmula

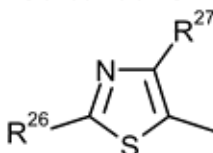


na qual

R^{23} e R^{24} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^{25} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou
representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

15 A representa um radical da fórmula

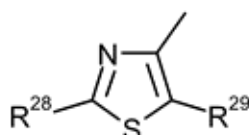


na qual

R^{26} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, ciano, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

20 R^{27} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

A representa um radical da fórmula

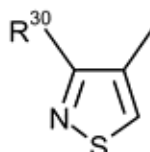


na qual

R^{28} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di- $(C_1$ - C_4 -alquil)amino, ciano, metila, etila ou representa C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^{29} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,
5 ou

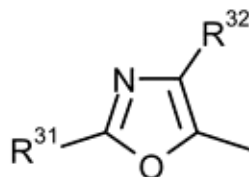
A representa um radical da fórmula



na qual

R^{30} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -haloalquila tendo 1 a 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,
10 ou

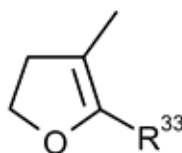
A representa um radical da fórmula



na qual

R^{31} representa hidrogênio, metila ou etila e
15 R^{32} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila,
ou

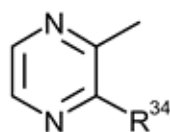
A representa um radical da fórmula



na qual

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

A representa um radical da fórmula



na qual

R^{34} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou trifluorometila.

3. Bifenilcarboxamida da fórmula (I) de acordo com a reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que:

R representa hidrogênio, metila, etila, isopropila, terc-butila,

Z representa alila, 2-butenila, 2-metilalila, 1-metilalila, 3-metil-2-butenila, propargila, 2-butinila, 3-butinila, 2-metil-3-butinila, 3,3-difluoroalila, 3,3-dicloroalila, ciclopropilmetila, ciclopentilmetila, cicloexilmetila,

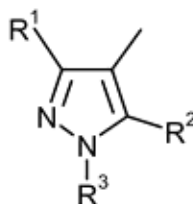
X e Y independentemente um do outro representam flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, sec-butila, isobutila, terc-butila, metóxi, etóxi, metiltio, triclorometila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, difluorometóxi, trifluorometóxi, trifluorometiltio, difluoroclorometiltio,

m representa 0 ou 1,

n representa 0, 1 ou 2, onde y representa radicais idênticos ou diferentes se n representar 2,

e

A representa um radical da fórmula



na qual

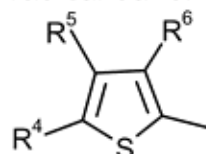
R^1 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, isopropila, ciclopropila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, monofluorometila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, triclorometóxi, trifluorometiltio ou difluorometiltio e

R^2 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi, metiltio ou etiltio e

R^3 representa hidrogênio, metila, etila, hidroximetila, hidroxietila, trifluorometila, difluorometila ou fenila,

ou

A representa um radical da fórmula

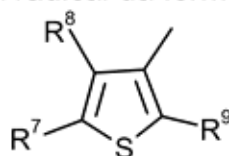


5 na qual

R^4 e R^5 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^6 representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, trifluorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi ou triclorometóxi,
10 ou

A representa um radical da fórmula

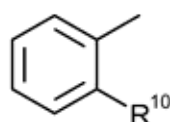


na qual

R^7 e R^8 independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e
15

R^9 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila,
ou

A representa um radical da fórmula

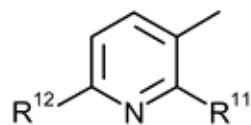


20 na qual

R^{10} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, difluorometila, trifluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi, triclorometóxi, trifluorometiltio,

difluorometiltio, difluoroclorometiltio ou triclorometiltio,
ou

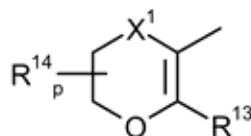
A representa um radical da fórmula



na qual

- 5 R¹¹ representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidroxila, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi, triclorometóxi, difluorometiltio, trifluorometiltio e
- 10 R¹² representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, metila, etila, n-propila, isopropila, n-butila, isobutila, sec-butila, terc-butila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, metilsulfinila, metilsulfonila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila, triclorometila, trifluorometóxi, difluorometóxi, difluoroclorometóxi ou triclorometóxi,
- 15 ou

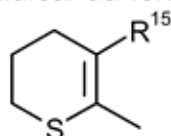
A representa um radical da fórmula



na qual

- R¹³ representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e
- 20 R¹⁴ representa metila ou etila,
 X¹ representa S (enxofre), representa SO, SO₂ ou CH₂ e
 p representa 0, 1 ou 2,
- ou

A representa um radical da fórmula

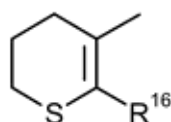


na qual

R^{15} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila,

ou

5 A representa um radical da fórmula

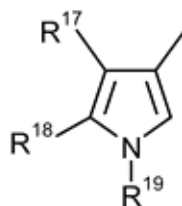


na qual

R^{16} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila,

ou

10 A representa um radical da fórmula



na qual

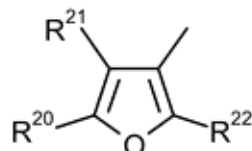
R^{17} representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, isopropila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila,

15 R^{18} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila ou triclorometila e

R^{19} representa hidrogênio, metila, etila, trifluorometila, metoximetila, etoximetila, hidroximetila ou hidroxietila,

ou

A representa um radical da fórmula

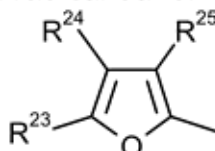


20 na qual

R^{20} e R^{21} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^{22} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila, ou

A representa um radical da fórmula

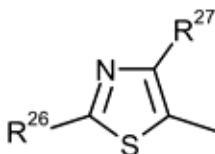


5 na qual

R^{23} e R^{24} independentemente um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, nitro, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^{25} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila, ou

A representa um radical da fórmula

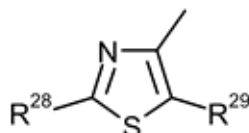


na qual

R^{26} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^{27} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila, ou

20 A representa um radical da fórmula

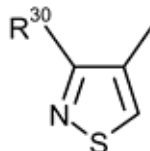


na qual

R^{28} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila e

R^{29} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila, ou

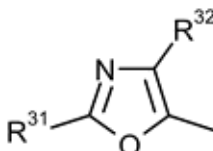
A representa um radical da fórmula



5 na qual

R^{30} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila, ou

A representa um radical da fórmula



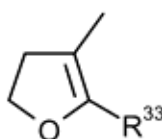
10 na qual

R^{31} representa hidrogênio, metila ou etila e

R^{32} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila,

ou

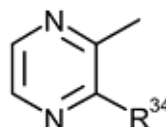
A representa um radical da fórmula



15 na qual

R^{33} representa metila, etila, trifluorometila, difluorometila, difluoroclorometila ou triclorometila, ou

A representa um radical da fórmula

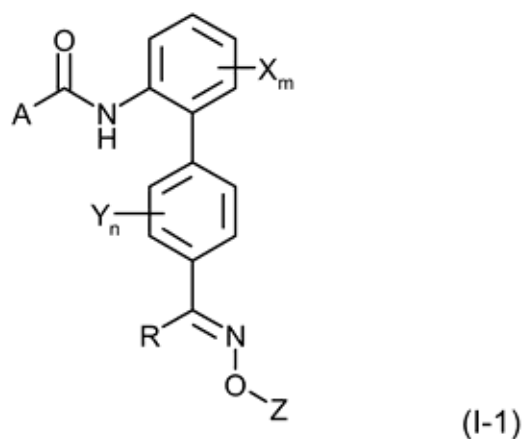


20 na qual

R^{34} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou

trifluorometila.

4. Bifenilcarboxamida, caracterizada pelo fato de que apresenta a fórmula (I-1)

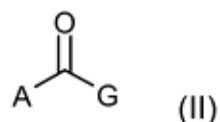


na qual

- 5 R, Z, X, Y, m, n e A são de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 3.

5. Processo para preparar bifenilcarboxamidas da fórmula (I), como definidas em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que:

- 10 (a) derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)

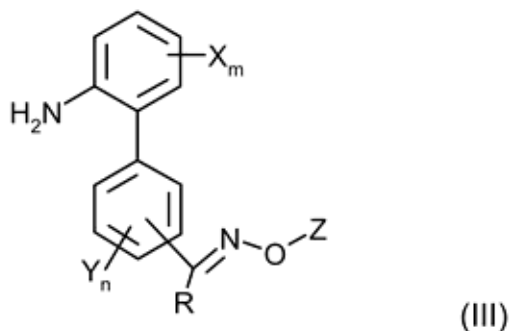


na qual

A é como definido na reivindicação 1 e

G representa halogênio, hidroxila ou C₁-C₆-alcóxi

são reagidos com derivados de anilina da fórmula (III)



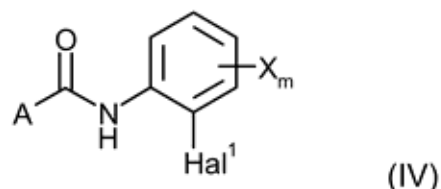
- 15 na qual

R, Z, X, Y, m e n são como definidos na reivindicação 1,

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

ou

5 (b) derivados de carboxamida da fórmula (IV)

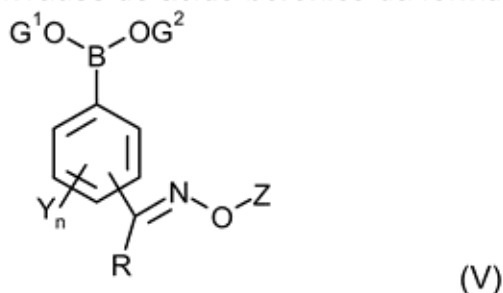


na qual

A, X e m são como definidos na reivindicação 1,

Hal¹ representa bromo ou iodo,

são reagidos com derivados de ácido borônico da fórmula (V)



10 na qual

R, Z, Y e n são como definidos na reivindicação 1 e

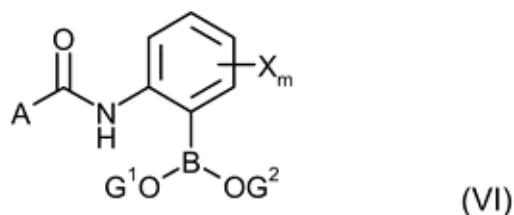
G¹ e G² cada um representa hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno

na presença de um catalisador, se apropriado na presença de um aglutinan-

15 te de ácido e se apropriado na presença de um diluente,

ou

(c) derivados de ácido borônico de carboxamida da fórmula (VI)



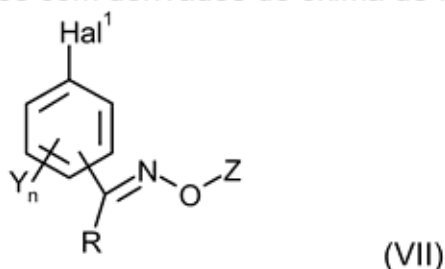
na qual

A, X e m são como definidos na reivindicação 1 e

20 G¹ e G² cada um representa hidrogênio ou juntos representam

tetrametiletileno

são reagidos com derivados de oxima de fenila da fórmula (VII)



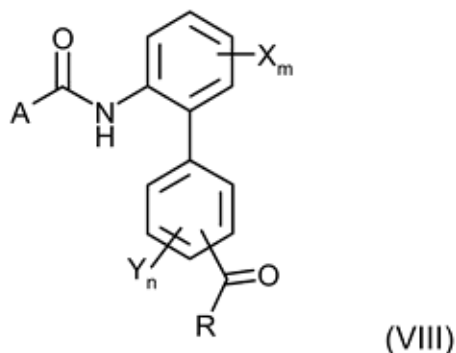
na qual

R, Z, Y e n são como definidos na reivindicação 1,

5 Hal¹ representa bromo ou iodo,

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

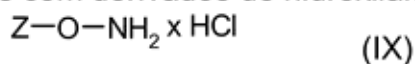
(d) derivados de bifenilacila da fórmula (VIII)



10 na qual

A, R, X, Y, m e n são como definidos na reivindicação 1

são reagidos com derivados de hidroxilamina da fórmula (IX)

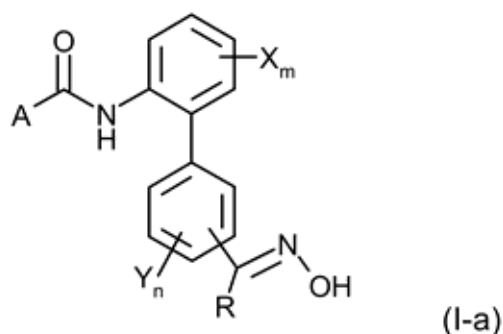


na qual

Z é como definido na reivindicação 1,

15 se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na presença de um diluente,
ou

(e) derivados de hidroxiiimino da fórmula (I-a)



na qual

A, R, X, Y, m e n são como definidos na reivindicação 1

são reagidos com compostos da fórmula (X)



na qual

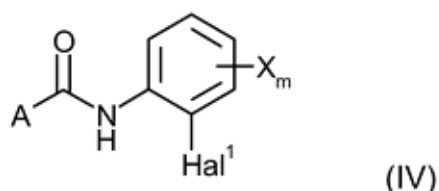
5 Z é como definido na reivindicação 1,

E representa cloro, bromo, iodo, metanossulfonila ou p-toluenossulfonila,

se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na presença de um diluente,

10 ou

(f) derivados de carboxamida da fórmula (IV)

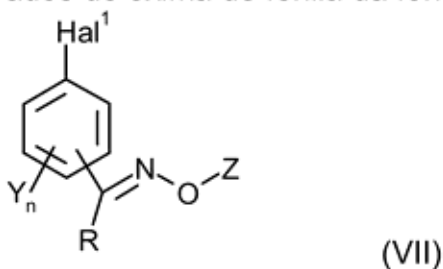


na qual

A, X e m são como definidos na reivindicação 1,

Hal¹ representa bromo ou iodo,

15 são reagidos com derivados de oxima de fenila da fórmula (VII)



na qual

R, Z, Y e n são como definidos na reivindicação 1,

Hal¹ representa bromo ou iodo

na presença de um catalisador de paládio ou platina e na presença de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, se apropriado na presença de um aglutinante de ácido e se apropriado na presença de um diluente.

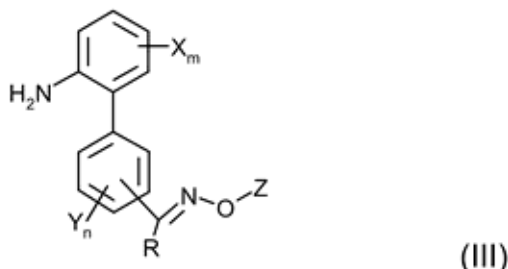
6. Composição para controlar microorganismos indesejados, caracterizada pelo fato de que compreende pelo menos uma bifenilcarboxamida da fórmula (I), como definida em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, além de extensores e/ou tensoativos.

7. Uso de bifenilcarboxamidas da fórmula (I), como definidas em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, para controlar microorganismos indesejados.

8. Método para controlar microorganismos indesejados, caracterizado pelo fato de que bifenilcarboxamidas da fórmula (I), como definidas em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, são aplicadas aos microorganismos e/ou seus habitats.

9. Processo para preparar composições para controlar microorganismos indesejados, caracterizado pelo fato de que bifenilcarboxamidas da fórmula (I), como definidas em qualquer uma das reivindicações 1 a 4, são misturadas com extensores e/ou tensoativos.

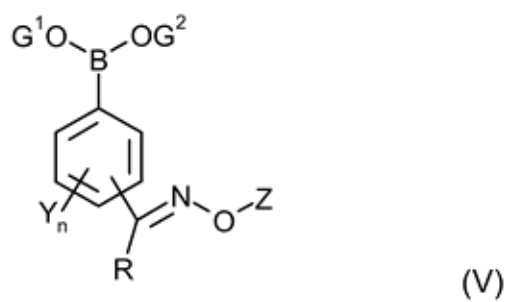
10. Derivado de anilina, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula (III)



na qual

R, Z, X, Y, m e n são como definidos na reivindicação 1.

11. Derivado de ácido borônico, caracterizado pelo fato de que apresenta a fórmula (V)



na qual

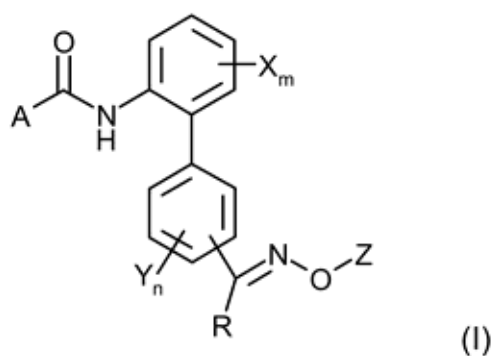
R, Z, Y e n são como definidos na reivindicação 1, e

G¹ e G² cada um representa hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno.

RESUMO

Patente de Invenção: **"BIFENILCARBOXAMIDAS, SEU USO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, MÉTODO E COMPOSIÇÃO PARA CONTROLAR MICROORGANISMOS INDESEJADOS, PROCESSO PARA PREPARAÇÃO DA DITA COMPOSIÇÃO, E DERIVADOS DE ANILINA E DE ÁCIDO BORÔNICO"**.

A presente invenção refere-se a novas bifenilcarboxamidas da fórmula (I)



em que

R, Z, X, Y, m, n e A são como definidos na descrição,
uma pluralidade de processos para preparar estes compostos e
seus usos para controlar microorganismos indesejados, e também novos
intermediários e sua preparação.