



República Federativa do Brasil

Ministério da Indústria, Comércio Exterior

e Serviços

Instituto Nacional da Propriedade Industrial

(11) PI 0617103-6 B1

(22) Data do Depósito: 12/09/2006

(45) Data de Concessão: 28/06/2016



* B R P I 0 6 1 7 1 0 3 B 1 *

(54) Título: COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, PROCESSOS PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS E MÉTODO PARA O CONTROLE DE INSETOS NOCIVOS

(51) Int.Cl.: C07C 257/12; C07D 295/195; A01N 37/52; A01N 43/40

(30) Prioridade Unionista: 13/09/2005 EP 05356159.3

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

(72) Inventor(es): KLAUS KUNZ, JÖRG GREUL, OLIVER GUTH, BENOIT HARTMANN, KERSTIN ILG, WAHED MORADI, THOMAS SEITZ, PETER DAHMEN, ARND VOERSTE, ULRIKE WACHENDORFF-NEUMANN, MARK DREWES, RALF DUNKEL, RONALD EBBERT, OLGA MALSAM, OLGA-MARIA FRANKEN

**“COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, PROCESSOS PARA A
PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, MÉTODO PARA O CONTROLE DE
FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS E MÉTODO PARA O
CONTROLE DE INSETOS NOCIVOS”**

5

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se aos derivados de fenil-amidina 4-benzilóxi e 4-(2-feniletil)-substituídos, seu processo de preparação, seu uso como agentes ativos fungicidas ou inseticidas, particularmente na forma de composições fungicidas ou inseticidas, e
10 métodos de controle de fungos fitopatogênicos ou insetos nocivos, notadamente de plantas, utilizando estes compostos ou composições.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

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

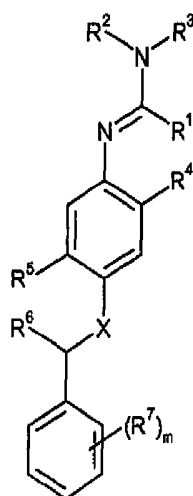
DESCRIÇÃO RESUMIDA DA INVENÇÃO

20

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

para controlar insetos nocivos ou outros organismos prejudiciais. Revelamos agora nova família de compostos que possui os efeitos ou vantagens mencionados acima.

Conseqüentemente, a presente invenção fornece derivados de bi-
5 fenil-amidina da fórmula (I):



(Ia): X = O - (Ib): X = CH₂

(I)

em que:

- X = O ou CH₂;
- R¹ representa H, alquila C₁-C₁₂ substituído ou não substituído, alquenila C₂-C₁₂ substituído ou não substituído, alquinila C₂-C₁₂ substituído ou não substituído, SH ou S-alquila C₁-C₁₂ substituído ou não substituído;
- R² representa alquila C₁-C₁₂ substituído ou não substituído;
- R³ representa alquila C₂-C₁₂ substituído ou não substituído, cicloalquila C₃-C₆ substituído ou não substituído, alquenila C₂-C₁₂ substituído ou não substituído, alquinila C₂-C₁₂ substituído ou não substituído, halogênio-
- 15 alquila C₁-C₁₂; ou
- R¹ e R², R¹ e R³ ou R² e R³ podem juntos formar heterociclo de 5 a 7 membros substituído ou não substituído;
- R⁴ representa alquila C₁-C₁₂ substituído ou não substituído,

átomo de halogênio, halogênio-alquila C₁-C₁₂, O-alquila C₁-C₁₂ substituído ou não substituído ou ciano;

- R⁵ representa H, alquila C₁-C₁₂ substituído ou não substituído, átomo de halogênio, halogênio-alquila C₁-C₁₂, O-alquila C₁-C₁₂ substituído ou
5 não substituído ou ciano;

- R⁶ representa H, alquila C₁-C₆ substituído ou não substituído, átomo de halogênio ou halogênio-alquila C₁-C₆;

- m representa 0, 1, 2, 3, 4 ou 5;

- R⁷, que pode ser idêntico ou diferente, representa H, átomo de
10 halogênio, nitro, ciano, trialkilsilila, alquila C₁-C₈, alquil-fenila C₁-C₄ substituído ou não substituído, fenila substituído ou não substituído, alcóxi C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄, alquiltio C₁-C₈, halogenioalquila C₁-C₆, halogenioalcóxi C₁-C₆ ou halogenioalquiltio C₁-C₆, alcóxi-fenila C₁-C₄ substituído ou não substituído como benzilóxi, fenóxi substituído ou não substituído, alquilamino-C₁-C₈-NR⁸R⁹
15 substituído ou não substituído, NR⁸R⁹ substituído ou não substituído, alquila C₁-C₈-S(O)_nR¹⁰, -S(O)_nR¹⁰, alquila C₁-C₈-SO₂NR⁸R⁹, -SO₂NR⁸R⁹, alquila C₁-C₈-C(O)R¹¹, -CR¹⁰=N-O-R¹²;

- dois substituintes R⁷ podem formar anel carbocíclico ou heterocíclico, que pode compreender um ou mais heteroátomos selecionados a
20 partir da lista que consiste de O, N, S;

- n representa 0, 1 ou 2;

- R⁸ e R⁹, que podem ser idênticos ou diferentes, representam H, alquila C₁-C₆ substituído ou não substituído;

- R⁸ e R⁹ podem formar anel heterocíclico, que pode compreender
25 um ou mais heteroátomos selecionados a partir da lista que consiste de O, N, S;

- R¹⁰ representa H, alquila C₁-C₈ linear ou ramificado, substituído ou não substituído, alquenila C₁-C₈, alquinila C₁-C₈;

- R¹¹ representa H, alquila C₁-C₈ linear ou ramificado, substituído

ou não substituído, alcóxi C₁-C₈, NR⁸R⁹;

- R¹² representa H, alquila C₁-C₈ linear ou ramificado, substituído ou não substituído, alquil-fenila C₁-C₄, alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄, alquil-fenila C₁-C₄ substituído ou não substituído, fenila substituído ou não substituído;

5 - R¹⁰ e R¹² podem formar anel heterocíclico, que pode compreender um ou mais heteroátomos selecionados a partir da lista que consiste de O, N, S;

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

10 Qualquer dos compostos de acordo com a presente invenção pode existir em uma ou mais formas de isômeros óticos, geométricos ou quirais, dependendo da quantidade de centros assimétricos no composto. A presente invenção refere-se igualmente, portanto, a todos os isômeros óticos e a suas misturas racêmicas ou escalêmicas (o termo "escalêmicas"

15 indica mistura de enantiômeros em diferentes proporções) e às misturas de todos os estereoisômeros possíveis, em todas as proporções. Os diaestereoisômeros e/ou os isômeros óticos podem ser separados de acordo com os métodos intrinsecamente conhecidos pelos técnicos comuns no assunto.

20 Qualquer dos compostos de acordo com a presente invenção pode também existir em uma ou mais formas de isômeros geométricos, dependendo da quantidade de uniões duplas no composto. A presente invenção refere-se igualmente, portanto, a todos os isômeros geométricos e a todas as misturas possíveis, em todas as proporções. Os isômeros

25 geométricos podem ser separados de acordo com métodos gerais, que são intrinsecamente conhecidos pelos técnicos comuns no assunto.

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

nitrogênio, oxigênio ou enxofre.

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

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

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

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

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

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

25 Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^6 representa H ou alquila C_1-C_6 não substituído tal como metila e etila.

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

presente invenção são aqueles em que m representa 1, 2, 3 ou 4; de preferência ainda maior, m representa 1, 2 ou 3.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^7 , que pode ser idêntico ou diferente, representa H, F, Cl, Br, I; nitro; ciano; alquila C_1-C_6 ; alquil-fenila C_1-C_4 que pode ser não substituído ou substituído por halogênio, alquila C_1-C_4 ou halogenioalquila C_1-C_4 ; fenila, que pode ser não substituído ou substituído por halogênio, alquila C_1-C_4 ou halogenioalquila C_1-C_4 ; alcóxi C_1-C_6 ; alcóxi C_1-C_4 -alquila C_1-C_4 ; alquiltio C_1-C_6 ; halogenioalquila C_1-C_6 ; halogenioalcóxi C_1-C_6 ; halogenioalquiltio C_1-C_6 ; alcóxi C_1-C_6 ; alcóxi C_1-C_4 -alquila C_1-C_4 ; alquiltio C_1-C_6 ; benzilóxi, que pode ser não substituído ou substituído por halogênio; fenóxi, que pode ser não substituído ou substituído por átomo de halogênio ou CF_3 ; NR^8R^9 ; alquila C_1-C_4 - NR^8R^9 ; $S(O)_nR^{10}$; alquila C_1-C_4 - $S(O)_nR^{10}$; OR^{11} ; alquila C_1-C_4 - COR^{11} ; $-CR^{10}=N-O-R^{12}$.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^8 e R^9 que podem ser idênticos ou diferentes representam H, alquila C_1-C_6 ou R^8 e R^9 podem formar anel heterocíclico que compreende heteroátomos adicionais selecionados a partir da lista que consiste de O, S, N.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^{10} representa H, metila ou etila.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^{11} representa H; alquila C_1-C_4 ; alcóxi C_1-C_4 ; NR^8R^9 .

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R^{12} representa H; alquila C_1-C_4 ; halogenioalquila C_1-C_4 ; alquil-fenila C_1-C_4 em que fenila pode ser substituído por F, Cl, Br, I, alquila C_1-C_4 , halogenioalquila C_1-C_4 ou halogenioalcóxi C_1-C_4 ;

alcóxi C₁-C₄-alquila C₁-C₄; fenóxi; benzilóxi.

Ainda outros compostos preferidos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R¹⁰ e R¹² podem formar anel heterocíclico de 5 ou 6 membros que compreende heteroátomo adicional
5 selecionado a partir da lista que consiste de O, S, N.

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

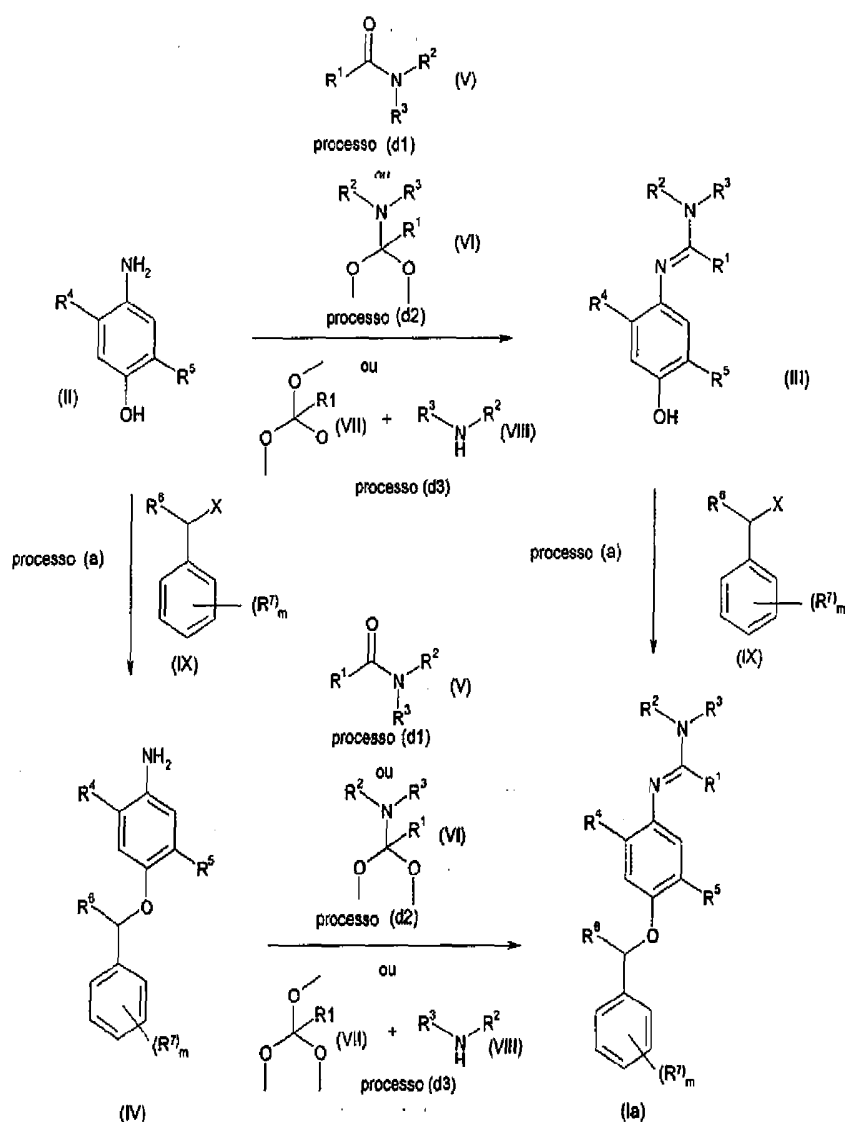
- características preferidas de R¹ com características preferidas de R² a R⁷ ou a R¹², quando aplicável;
- características preferidas de R² com características preferidas
15 de R¹ a R⁷ ou a R¹², quando aplicável;
- características preferidas de R³ com características preferidas de R¹ a R⁷ ou a R¹², quando aplicável;
- características preferidas de R⁴ com características preferidas de R¹ a R⁷ ou a R¹², quando aplicável;
- 20 - características preferidas de R⁵ com características preferidas de R¹ a R⁷ ou a R¹², quando aplicável;
- características preferidas de R⁶ com características preferidas de R¹ a R⁷ ou a R¹², quando aplicável.

Nestas combinações de características preferidas dos substituintes dos compostos de acordo com a presente invenção, as
25 mencionadas características preferidas podem também ser selecionadas dentre as características de maior preferência de cada um dentre m, n e R¹ a R¹², de maneira a formar as subclasses de maior preferência de compostos de

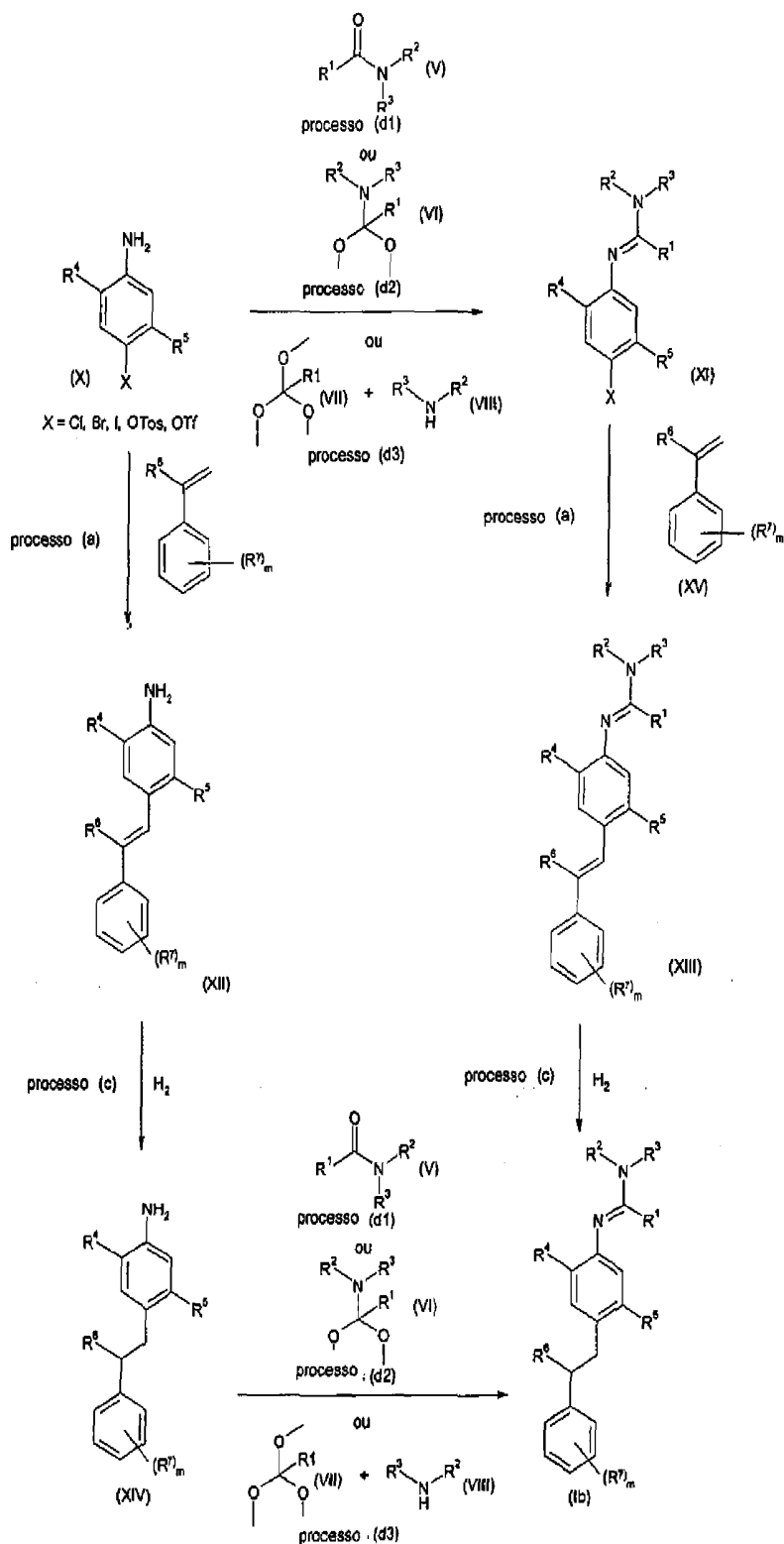
acordo com a presente invenção.

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

ESQUEMA 1

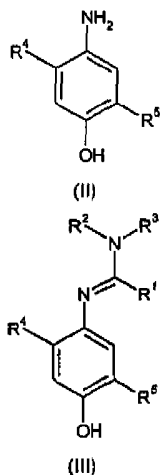


A presente invenção também se refere a processo para a preparação de composto de fórmula (Ib). Geralmente, a preparação de
10 composto de fórmula (Ib) de acordo com a presente invenção pode ser conduzida conforme ilustrado pelo Esquema 2.

Esquema 2

Desta forma, de acordo com um aspecto adicional da presente invenção,
 é fornecido processo (a) de preparação de derivados de anilina das fórmulas (Ia) ou

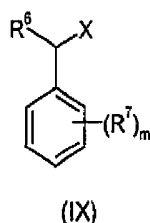
(IV) por meio de reação de derivados de anilina das fórmulas (II) ou (III):



em que:

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme definidos no presente;

com derivado benzílico (IV):



5

em que:

- m , R^6 e R^7 são conforme definidos no presente;

- X representa Cl , Br , I , tosilato, $SOMe$, mesilato ou triflato.

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

10

- presença de base;

- presença de diluente orgânico inerte.

15

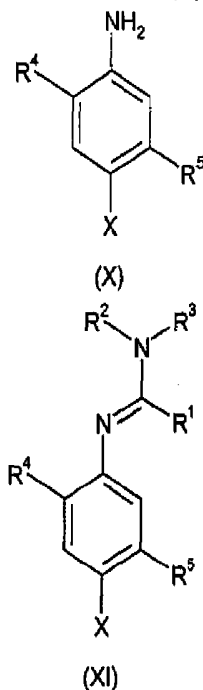
Para a condução do processo (a) de acordo com a presente invenção, derivados de anilina ou amidina das fórmulas (II) ou (III), respectivamente, podem ser utilizados como materiais de partida. Os materiais de partida preferidos para o processo (a) de acordo com a presente invenção são compostos das fórmulas (II) ou (III), em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5

representam substituintes conforme definidos no presente para o composto preferido da fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

Derivados de anilina da fórmula (II) e compostos benzílicos da fórmula (IX), bem como o processo correspondente de sua preparação, são conhecidos.

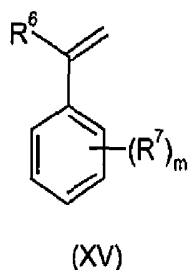
A Fórmula (IX) fornece definição geral dos compostos benzílicos que podem ser utilizados como materiais de partida para a condução do processo (a) de acordo com a presente invenção. Na fórmula (IX), R^6 , R^7 e m representam preferencialmente substituintes que já tenham sido descritos como preferidos com relação a compostos da fórmula (I).

Aspecto adicional da presente invenção repousa em processo (b) de preparação de derivados de anilina das fórmulas (XII) ou (XIII) por meio de reação de derivados de anilina das fórmulas (X) ou (XI):



em que:

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme definidos no presente;
 - X representa Cl, Br, I, triflato, mesilato, SMe ou tosilato;
- com derivado de estireno da fórmula (XV):



em que:

- m, R⁶ e R⁷ são conforme definidos no presente.

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

- 5 - presença de base;
- presença de diluente orgânico inerte;
- presença de catalisador;
- presença de ligante;
- presença de aditivos.

10 Para a condução do processo (b) de acordo com a presente invenção, derivados de anilina ou amidina das fórmulas (VI) ou (VII), respectivamente, podem ser utilizados como materiais de partida.

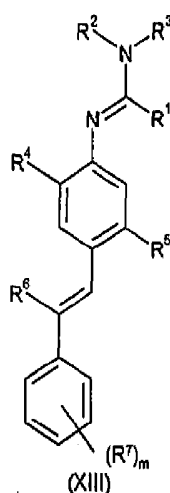
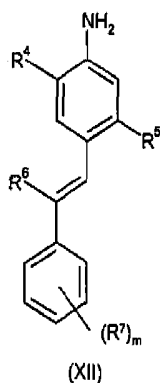
 Materiais de partida preferidos para o processo (b) de acordo com a presente invenção são compostos das fórmulas (X) ou (XI) em que R¹, R²,
15 R³, R⁴ e R⁵ representam substituintes conforme definidos no presente para o composto preferido da fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

 Derivados de anilina da fórmula (X) e derivados de estireno da fórmula (XV), bem como o processo correspondente de sua preparação, são conhecidos.

20 A Fórmula (XV) fornece definição geral dos derivados de estireno que podem ser utilizados como materiais de partida para a condução do processo (a) de acordo com a presente invenção. Na fórmula (XV), R⁶, R⁷ e m representam preferencialmente substituintes que já foram descritos como

preferidos com relação aos compostos da fórmula (I).

Aspecto adicional da presente invenção repousa em processo (c) de preparação dos derivados de anilina das fórmulas (XIV) ou (Ib) por meio de reação dos derivados de anilina das fórmulas (XII) ou (XIII):



5 em que:

- m, R⁶ e R⁷ são conforme definidos no presente;
- com fonte de hidrogênio, preferencialmente o próprio hidrogênio.

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

- 10
- presença de diluente orgânico inerte;
 - presença de ácido ou base;
 - presença de catalisador.

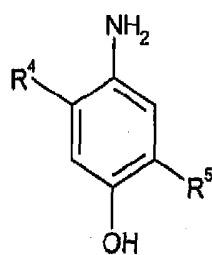
Para a condução do processo (c) de acordo com a presente invenção, derivados de anilina ou amidina das fórmulas (XII) ou (XIII),

respectivamente, podem ser utilizados como materiais de partida.

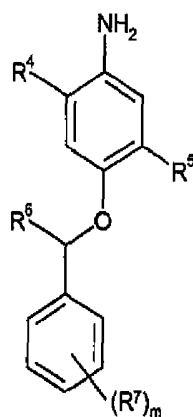
Os materiais de partida preferidos para o processo (c) de acordo com a presente invenção são compostos das fórmulas (XII) ou (XIII) em que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 e R^7 representam substituintes conforme definidos no presente para o composto preferido da fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

Os derivados de amidina das fórmulas (Ia), (Ib), (III) e (XI) podem ser obtidos por processo adicional de acordo com a presente invenção. Várias alternativas de processo (d) de acordo com a presente invenção podem ser consideradas, elas são definidas como processo (d1), processo (d2) e processo (d3) de acordo com a presente invenção.

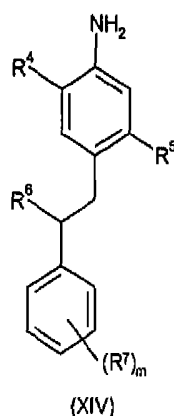
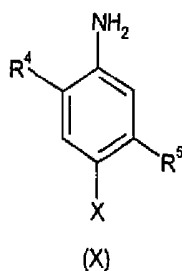
O processo (d) de acordo com a presente invenção compreende a reação de derivados de anilina das fórmulas (II), (IV), (X) ou (XIV) com diferentes reagentes, de forma a definir os processos (d1), (d2) e (d3), respectivamente.



(II)



(IV)

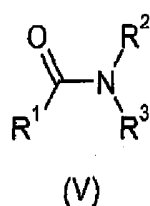


em que:

- R^4 , R^5 , R^6 , R^7 e m são conforme definidos no presente;
- X representa halogênio, triflato, SMe, mesilato ou tosilato.

O processo (d1) é conduzido utilizando adicionalmente derivados

5 de amida da fórmula (V):



em que:

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

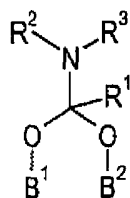
O processo (d1) de acordo com a presente invenção pode compreender ainda uma ou mais das características a seguir:

10 - presença de agente de halogenação, tal como PCl_5 , PCl_3 , $POCl_3$, $SOCl_2$;

- presença de diluente.

O processo (d2) é conduzido utilizando adicionalmente derivados

de aminoacetal da fórmula (VI):



(VI)

em que:

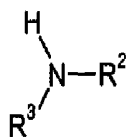
- R^1 , R^2 e R^3 são conforme definidos no presente;
- B^1 e B^2 representam independentemente alquila ou juntos

5 cicloalquila.

O processo (d2) de acordo com a presente invenção pode compreender adicionalmente uma ou mais das características a seguir:

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

10 O processo (d3) é conduzido utilizando adicionalmente derivados de amida da fórmula (VIII):

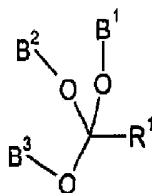


(VIII)

em que:

- R^2 e R^3 são conforme definidos no presente;

na presença de derivados de ortoéster da fórmula (VII):



(VII)

15

em que:

- R^1 é conforme definido no presente;

- B¹, B² e B³ representam independentemente alquila.

As Fórmulas (II), (IV), (X) ou (XIV) fornecem definições gerais dos derivados de anilina úteis como materiais de partida para a condução dos processos (d1), (d2) e (d3) de acordo com a presente invenção. Nestas fórmulas, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ e m representam preferencialmente substituintes ou valores conforme definidos no presente com relação à descrição de compostos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

Os processos (d), (d1), (d2) ou (d3) de acordo com a presente invenção podem compreender adicionalmente uma ou mais das características a seguir:

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

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

Os diluentes apropriados para condução do processo (b) de acordo com a presente invenção são todos solventes orgânicos inertes costumeiros. Dá-se preferência ao uso de hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno,

xileno ou decalin; hidrocarbonetos halogenados, tais como clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como dietil éter, diisopropil éter, metil terc-butil éter, metil terc-amil éter, dioxano, tetraidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; ésteres, tais como acetato de metila ou acetato de etila; sulfóxidos, tais como sulfóxido de dimetila; ou sulfonas, tais como sulfolano; álcoois, tais como metanol, etanol, n ou iso-propanol, n, iso, sec ou terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, dietilenoglicolmonometiléter, dietilenoglicolmonoetiléter; suas misturas com água ou água pura.

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

Diluentes apropriados para condução dos processos (d1), (d2) e

(d3) de acordo com a presente invenção são, em cada caso, todos solventes orgânicos inertes costumeiros. Dá-se preferência ao uso de hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalin; éteres, tais como dietil éter, diisopropil éter, metil terc-butil éter, metil terc-amil éter, dioxano, tetraidrofuran, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n ou iso-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N, N-dimetilformamida, N, N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; ésteres, tais como acetato de metila ou acetato de etila; sulfóxidos, tais como sulfóxido de dimetila; ou sulfonas, tais como sulfolano; álcoois, tais como metanol, etanol, n ou iso-propanol, n, iso, sec ou terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, dietileno-glicolmonometiléter, dietilenoglicolmonoetiléter; suas misturas com água ou água pura.

15 Aglutinantes ácidos apropriados para condução do processo (a) de acordo com a presente invenção são todas bases orgânicas e inorgânicas costumeiras para estas reações. Dá-se preferência ao uso de hidretos de metais alcalino-terrosos ou metais alcali, carbonatos ou carbonatos de hidrogênio, fosfatos ou fluoretos, tais como hidreto de sódio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, carbonato de cézio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio, fosfato de sódio, fosfato de potássio ou carbonato de amônio; e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N, N-dimetilanilina, N, N-dimetil-benzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N, N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano
20 (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou di-azabicycloundeceno (DBU).
25

 Aglutinantes ácidos apropriados para a condução do processo (b) são todas bases orgânicas e inorgânicas costumeiras para estas reações. Dá-se preferência ao uso de alcoolatos de metais alcali ou metais alcalino-

terrosos, carbonatos ou fosfatos, tais como terc-butanolato de potássio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, carbonato de cézio, fosfato de sódio, fosfato de potássio e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, dicitclohexilamina, dicitcloheximetilamina ou
5 diazabicyclooctano (DABCO).

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

Ácidos apropriados para a condução do processo (d3) de acordo com a presente invenção são todos ácidos orgânicos e inorgânicos costumeiros para estas reações. Dá-se preferência ao uso de ácido para-tolueno sulfônico, ácido metano sulfônico, ácido clorídrico (solução de gás,
25 aquosa ou orgânica) ou ácido sulfúrico.

Agentes de condensação apropriados para a condução do processo (d1) de acordo com a presente invenção são todos agentes de condensação costumeiros para essas reações de amidação. Dá-se

preferência ao uso de formador de haletos ácidos, tal como fosgênio, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, tricloreto óxido de fósforo ou cloreto de tionila; formador de anidrido, tal como cloroformato de etila, cloroformato de metila, cloroformato de isopropila, cloroformato de isobutila ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidas, tais como N, N'-díciclo-hexilcarbodiimida (DCC) ou outros agentes de condensação costumeiros, tais como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N, N'-carbonildiimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EDDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano ou hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfônio.

O processo (b) de acordo com a presente invenção pode ser conduzido na presença de catalisador. Dá-se preferência a sais ou complexos de paládio, tais como cloreto de paládio, acetato de paládio, bis(dibenzilidenoacetona)paládio, tris(dibenzilidenoacetona)bispaládio, tetraquis(trifenilfosfino)paládio, cloreto de bis(trifenilfosfino)paládio ou cloreto de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocenopaládio (II).

Também é possível gerar complexo de paládio diretamente na mistura de reação por meio de adição separada à mistura de reação de sal de paládio e ligante de complexos, tais como trietilfosfano, tri-terc-butilfosfano, triclohexilfosfano, 2-(diclohexilfosfano)bifenila, 2-(di-terc-butilfosfano)bifenila, 2-(diclohexilfosfano)-2'-(N, N-dimetilamino)-bifenila, trifenilfosfano, tris-(o-tolil)fosfano, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sódio, tris-2-(metoxifenil)fosfano, 2,2'-bis-(difenilfosfino)-1,1'-binaftila, 1,4-bis-(difenilfosfino)butano, 1,2-bis-(difenilfosfino)etano, 1,4-bis-(diclohexilfosfino)butano, 1,2-bis-(diclohexilfosfino)etano, 2-(diclohexilfosfino)-2'-(N, N-dimetilamino)-bifenila, bis(difenilfosfino)ferroceno ou tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito.

O processo (b) de acordo com a presente invenção pode ser

conduzido na presença de aditivo tal como sais de metais alcali como cloreto de lítio, cloreto de sódio ou cloreto de potássio, ou sal de prata tal como carbonato de prata, fosfato de prata, nitrato de prata, acetato de prata ou triflato de prata, ou sal de tálio, tal como carbonato de tálio ou acetato de tálio, ou catalisador de transferência de fases, tal como brometo de tetrabutilamônio ou acetato de tetrabutilamônio.

O processo (c) de acordo com a presente invenção pode ser conduzido na presença de catalisador. Dá-se preferência a metais como platina, paládio, níquel, ródio, irídio e rutênio, preferencialmente adsorvidos sobre suporte sólido como carbono, alumina, sulfato de cálcio ou sulfato de bário; óxidos ou hidróxidos de platina, paládio, níquel, ródio, irídio e rutênio ou seus complexos solúveis, tais como catalisador de Wilkinson ou catalisador de Vaska.

Ao conduzir-se os processos (a), (b), (c) e (d) de acordo com a presente invenção, as temperaturas de reação podem variar, em cada caso, dentro de faixa relativamente ampla. Geralmente, os processos são conduzidos sob temperaturas de 0 °C a 180 °C, preferencialmente de 10 °C a 150 °C, de preferência específica de 20 °C a 120 °C.

Ao conduzir-se o processo (a) de acordo com a presente invenção, geralmente 0,5 a 15 moles, preferencialmente 0,8 a 8 moles, de derivado benzílico da fórmula (IX) e de 1 a 5 mol de aglutinante ácido são empregados por mol de amina ou amidina da fórmula (II) ou (III). Também é possível, entretanto, empregar os componentes de reação em outras razões. O trabalho é conduzido por meio de métodos costumeiros. Geralmente, adiciona-se água à mistura de reação e o precipitado é separado e seco. O resíduo que permanece pode, se apropriado, ser liberado de quaisquer impurezas que possam ainda estar presentes utilizando métodos costumeiros, tais como cromatografia ou recristalização.

Ao conduzir-se o processo (b) de acordo com a presente

invenção, geralmente 0,8 a 15 moles, preferencialmente 0,8 a 8 moles, de estireno (XV), 1 a 10 mol de aglutinante ácido, 0,5 a 10% molar de catalisador e de 0,5 a 20% molar de ligante são empregados por mol de amina ou amidina da fórmula (X) ou (XI). Também é possível, entretanto, empregar os
5 componentes de reação em outras razões. O trabalho é conduzido por meio de métodos costumeiros. Geralmente, adiciona-se água à mistura de reação e o precipitado é separado e seco. O resíduo que permanece pode, se apropriado, ser liberado de quaisquer impurezas que possam ainda estar presentes utilizando métodos costumeiros, tais como cromatografia ou recristalização.

10 Ao conduzir-se o processo (c) de acordo com a presente invenção, geralmente de 0,5 a 10% molar de catalisador são empregados por mol de amina ou amidina da fórmula (XII) ou (XIII). Também é possível, entretanto, empregar os componentes de reação em outras razões. O trabalho é conduzido por meio de métodos costumeiros. Geralmente, o catalisador é
15 filtrado e o resíduo que permanece pode, se apropriado, ser liberado de quaisquer impurezas que possam ainda estar presentes utilizando métodos costumeiros, tais como cromatografia ou recristalização.

Ao conduzir-se o processo (d1) de acordo com a presente invenção, por mol da amina da fórmula (II), (IV), (X) ou (XIV), geralmente de 0,8
20 a 50 moles, preferencialmente, 1 a 10 moles de amida da fórmula (V) e 1 a 10 moles de agente de halogenação são empregados. Também é possível, entretanto, empregar os componentes de reação em outras razões. O trabalho é conduzido por meio de métodos costumeiros.

Ao conduzir-se o processo (d2) de acordo com a presente
25 invenção, por mol da amina da fórmula (II), (V), (VI) ou (XI), geralmente de 0,8 a 50 moles, preferencialmente, 1 a 10 moles de aminoacetal da fórmula (VI) são empregados. Também é possível, entretanto, empregar os componentes de reação em outras razões. O trabalho é conduzido por meio de métodos

costumeiros.

Ao conduzir-se o processo (d3) de acordo com a presente invenção, por mol da amina da fórmula (II), (IV), (X) ou (XIV), geralmente de 0,8 a 50 moles, preferencialmente 1 a 10 moles de ortoéster da fórmula (VI) e 0,8 a 50 moles, preferencialmente 1 a 10 moles de amina da fórmula (VIII) e quantidade catalítica de ácido são empregados. Também é possível, entretanto, empregar os componentes de reação em outras razões. O trabalho é conduzido por meio de métodos costumeiros.

Todos os processos de acordo com a presente invenção são geralmente conduzidos sob pressão atmosférica. Em cada caso, entretanto, também é possível operar sob pressão elevada ou reduzida, geralmente de 0,1 bar a 10 bar.

O processo (b) de acordo com a presente invenção é geralmente conduzido sob atmosfera de gás inerte tal como nitrogênio ou argônio, e o processo (c) sob atmosfera de hidrogênio.

DESCRIÇÃO DETALHADA DA INVENÇÃO

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

Em aspecto adicional, a presente invenção também se refere a composição fungicida ou inseticida que compreende quantidade eficaz e não fitotóxica de composto ativo da fórmula (I).

A expressão "quantidade eficaz e não fitotóxica" indica quantidade de composição de acordo com a presente invenção que é suficiente para controlar ou destruir os fungos presentes ou propensos a aparecer sobre as

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

- inibidor da respiração CI, como diflumetorim;
- inibidor da respiração CII, como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida;
- inibidor da respiração CIII, como azoxistrobin, ciazofamid,
- 5 dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, cresoxim-metil, metominostrobin, orisastrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin;
- b4. composto capaz de agir como desacoplador, como dinocap, fluazinam;
- b5. composto capaz de inibir a produção de ATP, como acetato
- 10 de fentin, cloreto de fentin, hidróxido de fentin, siltiofam;
- b6. composto capaz de inibir AA e a biossíntese de proteínas, como andoprim, blasticidin-S, ciprodinil, casugamicin, hidrato cloridrato de casugamicin, mepanipirim, pirimetanil;
- b7. composto capaz de inibir a transdução de sinais como
- 15 fempiclonil, fludioxonil, quinoxifen;
- b8. composto capaz de inibir a síntese de membranas e lipídios, como clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofós, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotiolano, tolclofós-metil, bifenila, iodocarb, propamocarb, cloridrato de propamocarb;
- 20 b9. composto capaz de inibir a biossíntese de ergosterol, como fenhexamid, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil,
- 25 paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,

aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

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

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

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

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

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

triclamida, zarilamid e 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-benzenossulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolocarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-di-hidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridinocarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-
 5 (4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 1-(2,3-di-hidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazolo-5-carboxilato de metila, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinocarbonitrila, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetileno)-benzenoacetato de metila, 4-cloro-alfa-propinilóxi-N-[2-[3-metóxi-4-(2-propinilóxi)fenil]etil]-benzenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-
 10 clorofenil)-2-propinil]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-
 15 [1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butóxi-6-iodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, N-[(Z)-[(ciclopropilmetóxi)imino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidróxi-benzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-
 20 feniletil)óxi]fenil]etilideno]amino]óxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-benzenoacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenóxi)-5-fluoropirimidin-4-il]óxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-
 25 metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazolo-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazolo-1-carbotiólico.

A composição de acordo com a presente invenção que compreende mistura de composto da fórmula (I) com composto bactericida

pode também ser particularmente vantajosa. Exemplos de parceiros de mistura bactericidas apropriados podem ser selecionados a partir da relação a seguir: bronopol, diclorofen, nitrapirin, dimetilditiocarbamato de níquel, casugamicin, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

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

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

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

como troncos, hastes ou caules, folhas, flores e frutos da planta em questão.

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

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

- doenças de míldew do pó, tais como:

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

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

- doenças de *Alternaria*, causadas, por exemplo, por *Alternaria solani*;
- doenças de *Cercospora*, causadas, por exemplo, por *Cercospora beticola*;
- 5 - doenças de *Cladosporium*, causadas, por exemplo, por *Cladosporium cucumerinum*;
- doenças de *Cochliobolus*, causadas, por exemplo, por *Cochliobolus sativus*;
- doenças de *Colletotrichum*, causadas, por exemplo, por
- 10 *Colletotrichum lindemuthianum*;
- doenças de *Cycloconium*, causadas, por exemplo, por *Cycloconium oleaginum*;
- doenças de *Diaporthe*, causadas, por exemplo, por *Diaporthe citri*;
- 15 - doenças de *Elsinoe*, causadas, por exemplo, por *Elsinoe fawcettii*;
- doenças de *Gloeosporium*, causadas, por exemplo, por *Gloeosporium laeticolor*;
- doenças de *Glomerella*, causadas, por exemplo, por
- 20 *Glomerella cingulata*;
- doenças de *Guignardia*, causadas, por exemplo, por *Guignardia bidwelli*;
- doenças de *Leptosphaeria*, causadas, por exemplo, por *Leptosphaeria maculans*, *Leptosphaeria nodorum*;
- 25 - doenças de *Magnaporthe*, causadas, por exemplo, por *Magnaporthe grisea*;
- doenças de *Mycosphaerella*, causadas, por exemplo, por *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola*, *Mycosphaerella*

fijiensis;

- doenças de *Phaeosphaeria*, causadas, por exemplo, por

Phaeosphaeria nodorum;

- doenças de *Pyrenophora*, causadas, por exemplo, por

5 *Pyrenophora teres*;

- doenças de *Ramularia*, causadas, por exemplo, por

Ramularia collo-cygni;

- doenças de *Rhynchosporium*, causadas, por exemplo, por

Rhynchosporium secalis;

10 - doenças de *Septoria*, causadas, por exemplo, por

Septoria apii ou *Septoria lycopersici*;

- doenças de *Typhula*, causadas, por exemplo, por *Typhula*

incarnata;

- doenças de *Venturia*, causadas, por exemplo, por

15 *Venturia inaequalis*;

- doenças das hastes e raízes, tais como:

- doenças de *Corticium*, causadas, por exemplo, por

Corticium graminearum;

- doenças de *Fusarium*, causadas, por exemplo, por

20 *Fusarium oxysporum*;

- doenças de *Gaeumannomyces*, causadas, por exemplo,

por *Gaeumannomyces graminis*;

- doenças de *Rhizoctonia*, causadas, por exemplo, por

Rhizoctonia solani;

25 - doenças de *Tapesia*, causadas, por exemplo, por *Tapesia*

acuformis;

- doenças de *Thielaviopsis*, causadas, por exemplo, por

Thielaviopsis basicola;

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

cinerea;

- doenças de *Penicillium*, causadas, por exemplo, por

Penicillium expansum;

- doenças de *Sclerotinia*, causadas, por exemplo, por

5 *Sclerotinia sclerotiorum*;

- doenças de *Verticilium*, causadas, por exemplo, por

Verticilium alboatrum;

- doenças de deterioração, fungos, murchar, podridão e apodrecimento de sementes e com base em solo:

10 - doenças de *Fusarium*, causadas, por exemplo, por

Fusarium culmorum;

- doenças de *Phytophthora*, causadas, por exemplo, por

Phytophthora cactorum;

- doenças de *Pythium*, causadas, por exemplo, por *Pythium*

15 *ultimum*;

- doenças de *Rhizoctonia*, causadas, por exemplo, por

Rhizoctonia solani;

- doenças de *Sclerotium*, causadas, por exemplo, por

Sclerotium rolfsii;

20 - doenças de *Microdochium*, causadas, por exemplo, por

Microdochium nivale;

- doenças de cancro, vassoura e queda, tais como:

- doenças de *Nectria*, causadas, por exemplo, por *Nectria*

galligena;

25 - doenças da ferrugem, tais como:

- doenças de *Monilinia*, causadas, por exemplo, por

Monilinia laxa;

- doenças de ondulação das folhas ou inchaço das folhas,

tais como:

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

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

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

- Stenotarsonemus* spp, *Tarsonemus* spp, *Tetranychus* spp, *Vasates lycopersici*;
- classe de *Bivalva*, tal como *Dreissena* spp;
 - ordem de *Chilopoda*, tal como *Geophilus* spp, *Scutigera* spp;
 - ordem de *Coleoptera*, tal como *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus*
- 5 spp, *Agelastica alni*, *Agriotes* spp, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*,
Anoplophora spp, *Anthonomus* spp, *Anthrenus* spp, *Apogonia* spp, *Atomaria* spp,
Attagenus spp, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp, *Ceuthorhynchus* spp, *Cleonus*
mendicus, *Conoderus* spp, *Cosmopolites* spp, *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp,
Cryptorhynchus lapathi, *Dermestes* spp, *Diabrotica* spp, *Epilachna* spp, *Faustinus*
- 10 *cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorphia elegans*, *Hylotrupes*
bajulus, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp, *Lachnosterna consanguinea*,
Leptinotarsa decemlineata, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp, *Lyctus* spp,
Meligethes aeneus, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp, *Monochamus* spp,
Naupactus xanthographus, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus*
- 15 *surinamensis*, *Otiornynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*,
Phyllophaga spp, *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp, *Psylliodes chrysocephala*,
Ptinus spp, *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp,
Sphenophorus spp, *Sternuchus* spp, *Symphyletes* spp, *Tenebrio molitor*, *Tribolium*
spp, *Trogoderma* spp, *Tychius* spp, *Xylotrechus* spp, *Zabrus* spp.
- 20 - ordem de *Collembola*, tal como *Onychiurus armatus*;
- ordem de *Dermaptera*, tal como *Forficula auricularia*;
 - ordem de *Diplopoda*, tal como *Blaniulus guttulatus*;
 - ordem de *Diptera*, tal como *Aedes* spp, *Anopheles* spp, *Bibio*
- hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp,
- 25 *Chochliomyia* spp, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp, *Cuterebra* spp, *Dacus*
oleae, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp, *Fannia* spp, *Gastrophilus* spp, *Hylemyia*
spp, *Hyppobosca* spp, *Hypoderma* spp, *Liriomyza* spp, *Lucilia* spp, *Musca* spp,
Nezara spp, *Oestrus* spp, *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp,

Stomoxys spp, *Tabanus* spp, *Tannia* spp, *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp;

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

- 5 - classe dos helmintos, tais como *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp, *A. scaris lubricoides*, *Ascaris* spp, *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp, *Chabertia* spp, *Clonorchis* spp, *Cooperia* spp, *Dicrocoelium* spp, *Dictyocaulus filaria*, *Diphylobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*,
10 *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Fasciola* spp, *Haemonchus* spp, *Heterakis* spp, *Hymenolepis nana*, *Hyostrogylus* spp, *Loa Loa*, *Nematodirus* spp, *Oesophagostomum* spp, *Opisthorchis* spp, *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp, *Paragonimus* spp, *Schistosoma* spp, *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp, *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*,
15 *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp, *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*;

- protozoários, tais como *Eimeria*;

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

- ordem de Homoptera, tal como *Acyrtosiphon* spp, *Aeneolamia* spp, *Agonosceana* spp, *Aleurodes* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp, *Amrasca* spp, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp,

- Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp, *Aspidiotus* spp, *Atanus* spp, *Aulacorthum solani*,
Bemisia spp, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp, *Brevicoryne brassicae*,
Calligypona marginata, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*,
Ceroplastes spp, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*,
5 *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccoxymytilus halli*,
Coccus spp, *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina* spp,
Diaspis spp, *Doralis* spp, *Drosicha* spp, *Dysaphis* spp, *Dysmicoccus* spp, *Empoasca*
spp, *Eriosoma* spp, *Erythroneura* spp, *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*,
Homalodisca coagulata, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp, *Idiocerus* spp,
10 *Idioscopus* spp, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp, *Lepidosaphes* spp, *Lipaphis*
erysimi, *Macrosiphum* spp, *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella*
spp, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp,
Nasonovia ribisnigri, *Nephotettix* spp, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp,
Orthezia praelonga, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp, *Parlatoria* spp,
15 *Pemphigus* spp, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp, *Phloeomyzus passerinii*,
Phorodon humuli, *Phylloxera* spp, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp,
Protopulvinaria pyriformis, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp, *Psylla*
spp, *Pteromalus* spp, *Pyrilla* spp, *Quadraspidiotus* spp, *Quesada gigas*,
Rastrococcus spp, *Rhopalosiphum* spp, *Saissetia* spp, *Scaphoides titanus*,
20 *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sogata* spp, *Sogatella furcifera*,
Sogatodes spp, *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis*
caryaefoliae, *Tomaspis* spp, *Toxoptera* spp, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp,
Typhlocyba spp, *Unaspis* spp, *Viteus vitifolii*;
- ordem de Hymenoptera, tais como *Diprion* spp, *Hoplocampa*
25 spp, *Lasius* spp, *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp;
- ordem de Isopoda, tal como *Armadillidium vulgare*, *Oniscus*
asellus, *Porcellio scaber*;
- ordem de Isoptera, tal como *Reticulitermes* spp, *Odontotermes* spp;

- ordem de *Lepidoptera*, tal como *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp, *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carbocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp, *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp, *Feltia* spp, *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp, *Heliothis* spp, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma* spp, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp, *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp, *Pseudaletia* spp, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp, *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp;
- ordem de *Orthoptera*, tal como *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blatella germanica*, *Gryllotalpa* spp, *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp, *Melanoplus* spp, *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*;
- ordem de *Siphonaptera*, tal como *Ceratophyllus* spp, *Xenopsylla cheopis*.
- ordem de *Symphyla*, tal como *Scutigera* spp;
- ordem de *Thysanoptera*, tal como *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp, *Heliothrips* spp, *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp, *Rhipiphorotherips cruentatus*, *Scirtothrips* spp, *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp;
- ordem de *Thysanura*, tal como *Lepisma saccharina*;
- nematóides fitoparasíticos, incluindo, por exemplo, *Anguina* spp, *Aphelenchoides* spp, *Belonoaimus* spp, *Bursaphelenchus* spp, *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp, *Heliocotylenchus* spp, *Heterodera* spp, *Longidorus* spp,

Meloidogyne spp, *Pratylenchus* spp, *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp, *Trichodorus* spp, *Tylenchorhynchus* spp, *Tylenchulus* spp, *Thylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp;

- besouros, tais como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*,
- 5 *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Emobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;
- 10 - *Hymenopteron*, tal como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*,
- cupins, tais como *Kaloterms flavicollis*, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*,
- 15 *Coptoterms formosanus*;
- traças, tais como *Lepisma saccharina*;
- ordem de *Acarina*, tal como *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula*
- 20 *autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*;
- ordem de *Araneae*, tal como *Aviculariidae*, *Araneidae*;
- ordem de *Opiliones*, tal como *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*;
- ordem de *Isopoda*, tal como *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;
- 25 - ordem de *Diplopoda*, tal como *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp;
- ordem de *Chilopoda*, tal como *Geophilus* spp;
- ordem de *Zygentoma*, tal como *Ctenolepisma* spp, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*;

- ordem de *Blattaria*, tal como *Blatta orientalis*, *Blatella germanica*, *Blatella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp, *Parcoblatta* spp, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*;
- 5 - ordem de *Saltatoria*, tal como *Acheta domesticus*;
- ordem de *Dermaptera*, tal como *Forficula auricularia*;
- ordem de *Isoptera*, tal como *Kaloterms* spp, *Reticulitermes* spp;
- ordem de *Psocoptera*, tal como *Lepinatus* spp, *Liposcelis* spp;
- ordem de *Coleoptera*, tal como *Anthrenus* spp, *Attagenus* spp,
- 10 *Dermestes* spp, *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp, *Ptinus* spp, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*;
- ordem de *Diptera*, tal como *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma*
- 15 *pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp, *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp, *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*;
- ordem de *Lepidoptera*, tal como *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola*
- 20 *bisselliella*;
- ordem de *Siphonaptera*, tal como *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopsis*;
- ordem de *Hymenoptera*, tal como *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*,
- 25 *Paravespula* spp, *Tetramorium caespitum*;
- ordem de *Anoplura*, tal como *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*;
- ordem de *Heteroptera*, tal como *Cimex hemipterus*, *Cimex*

lectularius, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

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

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

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

A composição fungicida ou inseticida de acordo com a presente invenção pode também ser utilizada no tratamento de organismos geneticamente modificados com os compostos de acordo com a presente invenção ou as composições agroquímicas de acordo com a presente invenção. Plantas geneticamente modificadas são plantas em cujo genoma gene heterólogo que codifica proteína de interesse foi integrado de forma estável. A expressão "gene heterólogo que codifica proteína de interesse" indica essencialmente genes que

fornecem as novas propriedades agronômicas à planta transformada, ou genes para melhorar a qualidade agronômica da planta modificada.

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

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

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

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

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

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

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

TABELA 1

COMPOSTOS DE ACORDO COM A FÓRMULA (I)

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
1	H	Me	Et	Me	Me	O	H			Cl			2,14
2	H	Me	Et	Me	Me	O	H			F			1,99
3	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl				Cl	2,05
4	H	Me	Et	Me	Me	O	Me	Cl				Cl	2,52
5	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl		-O-CH ₂ -O-			2,05
6	H	Me	Et	Me	Me	O	Me			F			2,08
7	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Cl				2,13
8	H	Me	Et	Me	Me	O	H			tBu			2,67
9	H	Me	Et	Me	Me	O	H		CF ₃				2,24
10	H	Me	Et	Me	Me	O	H			CN			1,7
11	H	Me	Et	Me	Me	O	H	F					1,94
12	H	Me	Et	Me	Me	O	H		C= NOMe				2,07
13	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Cl	Cl			2,38
14	H	Me	Et	Me	Me	O	H			CF ₃			2,28
15	H	Me	Et	Me	Me	O	H		F	F			2,02
16	H	Me	Et	Me	Me	O	H	OCF ₃					2,28
17	H	Me	Et	Me	Me	O	H		OCF ₃				2,33
18	H	Me	Et	Me	Me	O	H	CF ₃		Cl			2,52
19	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Cl		CF ₃		2,54
20	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl			CF ₃		2,44
21	H	Me	Et	Me	Me	O	H		CF ₃		CF ₃		2,62
22	H	Me	Et	Me	Me	O	H		OMe	F			1,92
23	H	Me	Et	Me	Me	O	H			O CF ₃			2,38
24	H	Me	Et	Me	Me	O	H			O CF ₂			2,06

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
25	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl		CF ₃			2,47
26	H	Me	Et	Me	Me	O	H	OC HF ₂					2,03
27	H	Me	Et	Me	Me	O	H		-N=S=N-				1,86
28	H	Me	Et	Me	Me	O	H		CF ₃	Cl			2,47
29	H	Me	Et	Me	Me	O	Me	Cl					2,24
30	H	Me	Et	Me	Me	O	Me		Cl				2,23
31	H	Me	Et	Me	Me	O	Me			Cl			2,26
32	H	Me	Et	Me	Me	O	H			Me			2,1
33	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl					2,08
34	H	Me	Et	Me	Me	O	H	CF ₃					2,14
35	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H		CF ₃		CF ₃		2,79
36	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H		Cl				2,2
37	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H	Cl					2,26
38	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H	Me					2,38
39	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H			OMe			2,04
40	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H			Cl			2,27
41	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H			Me			2,23
42	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H			F			2,05
43	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H		CF ₃				2,41
44	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H	F					2,23
45	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H	CF ₃					2,42
46	H	Me	Et	Me	Me	CH ₂	H			CF ₃			2,45
47	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl		Me	Me		2,42
48	H	Me	Et	Me	Me	O	H	F				F	1,94
49	H	Me	Et	Me	Me	O	H		OCH ₂ CF ₃				2,21
50	H	Me	Et	Me	Me	O	H		CH= CH ₂				2,16

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
51	H	Me	Et	Me	Me	O	H	-N=S=N-					1,92
52	H	Me	Et	Me	Me	O	H			O-(p-F- Ph)			2,8
53	H	Me	Et	Me	Me	O	H			C(=O) OMe			1,9
54	H	Me	Et	Me	Me	O	H		C(=O) OtBu				2,42
55	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl		Cl			2,33
56	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Me			Me		2,23
57	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Me				2,11
58	H	Me	Et	Me	Me	O	H	CN					1,78
59	H	Me	Et	Me	Me	O	H	F			F		1,99
60	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Me		Me		2,26
61	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl				F	2,09
62	H	Me	Et	Me	Me	O	H		-CH=CH-CH=CH-				2,29
63	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl		OMe	OMe		1,99
64	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Me	Me			2,23
65	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Br				2,18
66	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Me					2,06
67	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Br					2,13
68	H	Me	Et	Me	Me	O	H	SCF ₃					2,36
69	H	Me	Et	Me	Me	O	H		SCF ₃				2,46
70	H	Me	Et	Me	Me	O	H			Br			2,21
71	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Cl	Me				2,29
72	H	Me	Et	Me	Me	O	H			O-(p- SCH ₃ - Ph)			2,74

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
73	H	Me	Et	Me	Me	O	H			O-(p- Cl-Ph)			2,8
74	H	Me	Et	Me	Me	O	H		CN				1,83
75	H	Me	Et	Me	Me	O	H		-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -				2,55
76	H	Me	Et	Me	Me	O	H	-CH=CH- CH=CH-					2,45
77	H	Me	Et	Me	Me	O	H	F	Me				2,16
78	H	Me	Et	Me	Me	O	H			OMe			1,92
79	H	Me	Et	Me	Me	O	H			-O-CH ₂ - Ph			2,51
80	H	Me	Et	Me	Me	O	H		F				1,99
81	H	Me	Et	Me	Me	O	H		OMe				1,97
82	H	Me	Et	Me	Me	O	H			iPr			2,51
83	H	Me	Et	Me	Me	O	H			SCF ₃			2,61
84	H	Me	Et	Me	Me	O	H			SMe			2,16
85	H	Me	Et	Me	Me	O	H		I				2,42
86	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Me		Me		Me	2,42
87	H	Me	Et	Me	Me	O	H	I					2,29
88	H	Me	Et	Me	Me	O	H		Me		Me		2,26
89	H	Me	Et	Me	Me	O	H	Me	Me				2,29
90	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Cl		Cl		2,51
91	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	Me			Me		2,33

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
92	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	Cl		-O-CH ₂ -O-			2,16
93	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	CH 3			F			2,18
94	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Cl				2,21
95	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			tBu			2,64
96	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		CF ₃				2,29
97	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	F			F		2,09
98	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			CN			1,94
99	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Me		Me		2,42
100	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	F					2,09

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
101	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	Cl				F	2,16
102	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	Cl		OMe	OMe		2,09
103	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			C=N- Ome			2,21
104	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			F			2,09
105	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			Cl			2,26
106	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	Cl					2,18
107	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Cl	Cl			2,45
108	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Me	Me			2,36
109	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			CF ₃			2,33
110	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		F	F			2,13

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
111	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	OCF ₃					2,33
112	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	SCF ₃					2,48
113	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		OCF ₃				2,39
114	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		SCF ₃				2,48
115	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			SCF ₃			2,55
116	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	CF ₃		Cl			2,55
117	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Cl	Me			2,39
118	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Cl		CF ₃		2,61
119	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	Cl			CF ₃		2,58
120	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		CN				1,9

N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
121	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		Ome	F			2,06
122	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			OCF ₃			2,42
123	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	CF ₃					2,29
124	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			Me			2,23
125	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			OC HF ₂			2,16
126	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H			CF ₃			2,58
127	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H	OC HF ₂					2,13
128	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		-N=S=N-				1,99
129	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	H		CF ₃	Cl			2,51

Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X	R ⁶	R ⁷					log P
								orto	meta	para	meta'	orto'	
130	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	Me	Cl					2,36
131	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	Me		Cl				2,36
132	H	-CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ - CH ₂ -CH ₂ -		Me	Me	O	Me			Cl			2,36

Os exemplos a seguir ilustram de forma não limitadora a preparação e eficácia dos compostos da fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

EXEMPLOS

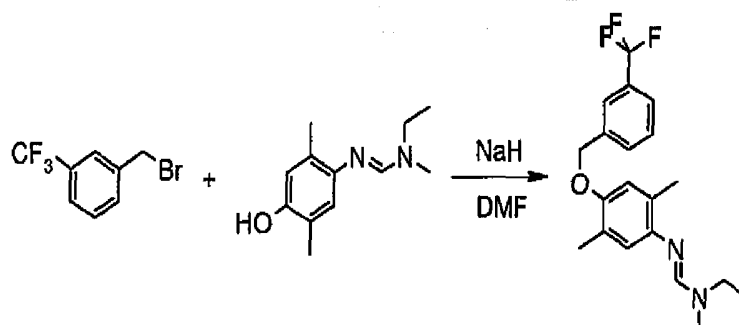
5

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 1

PROCESSO (A) - COMPOSTO (III) EM COMPOSTO (IA)

N'-(2,5-DIMETIL-4-{[3-(TRIFLUOROMETIL)BENZILÓXI}FENIL)-N-ETIL-N-

METILIMIDOFORMAMIDA - COMPOSTO 9



A solução de 206 mg (1,00 mmol) de N-etil-N'-(4-hidróxi-2,5-
 10 dimetilfenil)-N-metimidofórmamida em 5 ml de N, N-dimetilformamida, 26,4
 mg (1,10 mmol) de hidreto de sódio foram adicionados a 0 °C. Após
 agitação a 0 °C por trinta minutos, adicionou-se 262 mg (1,10 mmol) de 1-

(bromometil)-3-(trifluorometil)benzeno e a mistura de reação foi mantida em aquecimento à temperatura ambiente. Após agitação por dezesseis horas, a mistura de reação foi concentrada a vácuo e adicionou-se 10 ml de água e 10 ml de acetato de etila. A camada orgânica foi separada, seca sobre
 5 cartucho cheio com sulfato de sódio e concentrada a vácuo. Sem purificação adicional, foram obtidos 328 mg (0,90 mmol; 90%) de N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(trifluorometil)benzil]óxi]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida.
 log P (pH 2,3) = 2,24.

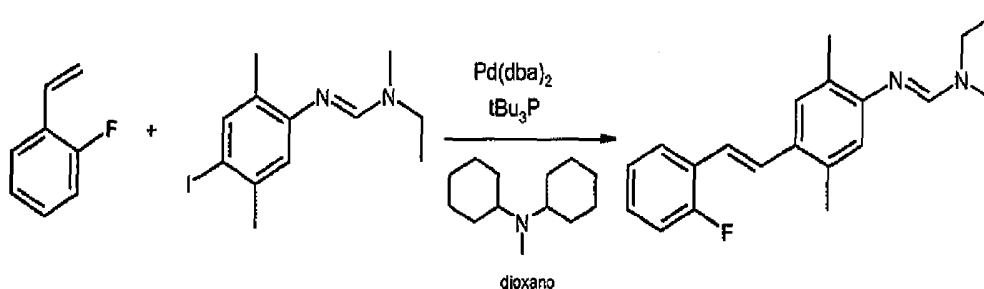
EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 2

10

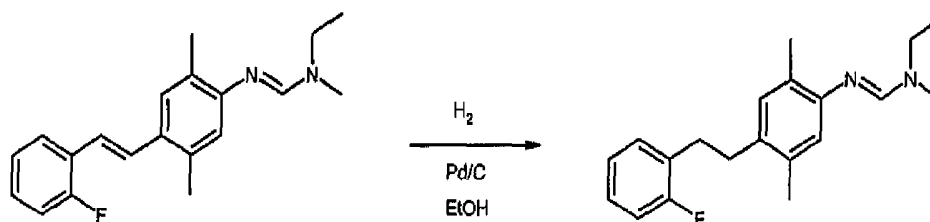
PROCESSO (B) - COMPOSTO (VII) EM COMPOSTO (X)

N-ETIL-N'-2-(2-FLUOROFENIL)VINIL]-2,5-DIMETILFENIL]-N-METILIMIDOFORMAMIDA -

INTERMEDIÁRIO (VII-1)

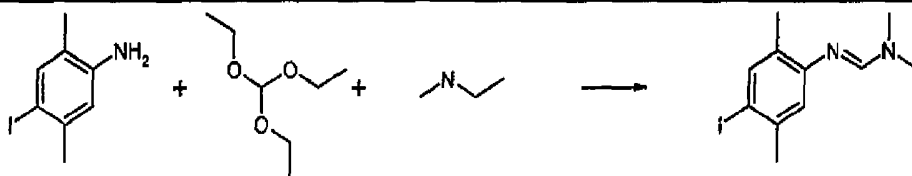


A reação é conduzida utilizando condições inertes (atmosfera de argônio ou nitrogênio, solventes secos). Suspensão de 474 mg (1,50 mmol)
 15 de N-etil-N'-(4-iodo-2,5-dimetilfenil)-N-metilimidoformamida, 201 mg (1,65 mmol) de 1-fluoro-2-vinilbenzeno, 321 mg (1,65 mmol) de diciclohexilmetilamina, 43 mg (0,075 mmol) de bis-(dibenzilidenacetona)paládio e 30 mg (0,15 mmol) de tri-terc-butilfosfina em 10 ml de dioxano foi agitada por dezesseis horas a 100 °C. Após filtragem
 20 sobre cartucho cheio com sulfato de sódio, a mistura é concentrada a vácuo. Sem purificação adicional, 400 mg (1,29 mmol, 86%) de N-etil-N'-{4-[(Z)-2-(2-fluorofenil)vinil]-2,5-dimetilfenil}-N-metilimidoformamida foram obtidos na forma de mistura de estereoisômeros (E) e (Z); log P (pH 2,3) = 2,11.

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 3**PROCESSO (C) - COMPOSTO (X) EM COMPOSTO (IB)****N-ETIL-N'-{4-[2-(2-FLUOROFENIL)ETIL]-2,5-DIMETILFENIL}-N-****METILIMIDOFORMAMIDA - COMPOSTO 44**

5 Suspensão de 275 mg (0,88 mmol) de N-etil-N'-2-(2-fluorofenil)vinil]-2,5-dimetilfenil}-N-metilimidoformamida e 94 mg (0,089 mmol) de paládio sobre carvão (10%) em 10 ml de etanol é agitada sob atmosfera de hidrogênio (pressão atmosférica) à temperatura ambiente por 24 horas. Após filtragem sobre cartucho cheio com sulfato de sódio,

10 228 mg (0,73 mmol, 83%) de N-etil-N'-{4-[2-(2-fluorofenil)etil]-2,5-dimetilfenil}-N-metilimidoformamida foram obtidos sem purificação; log P (pH 2,3) = 2,23.

EXEMPLO DE PREPARAÇÃO 4**PROCESSO (D3) - COMPOSTO (V) EM COMPOSTO (VI)****15 N'-{4-iodo-2,5-DIMETILFENIL}-N-ETIL-N-METILIMIDOFORMAMIDA - INTERMEDIÁRIO (V-1)**

A mistura de 12,3 g (50 mmol) de 4-iodo-2,5-dimetilanilina e 83 ml (500 mmol) de trietoximetano, adicionou-se 0,48 g (2,50 mmol) de ácido p-tolueno sulfônico. A mistura de reação foi mantida em refluxo por dezesseis horas e concentrada a vácuo. O produto bruto foi dissolvido em

20 100 ml de diclorometano e adicionou-se 5,91 g (100 mmol) de N-metiletanamina. A mistura de reação foi agitada por dezesseis horas a 40

°C. A mistura de reação foi concentrada a vácuo. Cromatografia de coluna (ciclohexano/acetato de etila 3:1) gerou 13,4 g (42,3 mmol) de 85% N'-(4-iodo-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida; log P (pH 2,3) = 1,21.

EXEMPLO DE EFICÁCIA A

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

Solvente: 50 partes em peso de n, n-dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

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

Para testar a atividade preventiva, plantas jovens são inoculadas com suspensão de esporos de *Puccinia recondita* em solução de agar aquosa com
15 resistência de 0,1%. Após a secagem do revestimento por pulverização, as plantas são pulverizadas com a preparação de composto ativo à taxa de aplicação indicada. As plantas permanecem por 24 horas em gabinete de incubação a 20 °C e umidade relativa do ar de 100%.

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

O teste é avaliado dez dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada. Neste teste, os compostos de acordo
25 com a presente invenção a seguir revelaram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 1000 ppm de ingrediente ativo: 2, 3, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25; 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 61, 62, 64, 65, 66, 70.

EXEMPLO DE EFICÁCIA B

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

Solvente: 50 partes em peso de n, n-dimetilacetamida

5 Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

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

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

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

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

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

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 1000 ppm de ingrediente ativo: 2, 3, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 25; 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 61, 62, 64, 65, 66, 70.

EXEMPLO DE EFICÁCIA C

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

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

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

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

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

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

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com a fórmula a seguir revelaram eficácia de 70% ou mais sob concentração de 500 ppm de ingrediente ativo: 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 18, 23, 31, 32, 33, 34,
20 35, 64, 88, 92, 100, 103, 105, 107, 109.

EXEMPLO DE EFICÁCIA D

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

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes em peso de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

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

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

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

10 Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais sob concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 3, 8, 14, 16, 17, 18, 23, 32, 25, 41, 43, 44.

EXEMPLO DE EFICÁCIA E

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

Solvente:	24,5 partes em peso de acetona
	24,5 partes em peso de dimetilacetamida
Emulsificante:	1 parte em peso de alquilaryl poliglicol éter

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

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

O teste é avaliado sete dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada. Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais em concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 2, 3, 8, 12, 14, 16, 17, 18, 20, 23, 32, 33, 34, 35, 37, 41, 42, 43, 44, 64, 73.

EXEMPLO DE EFICÁCIA F

TESTE PROTETOR *IN VIVO* SOBRE *BOTRYTIS CINEREA* (FEIJÃO)

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona
24,5 partes em peso de dimetilacetamida
Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

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

Para testar a atividade protetora, plantas jovens são pulverizadas com a preparação de composto ativo. Após a secagem do revestimento por pulverização, dois pedaços pequenos de agar cobertos com crescimento de *Botrytis cinerea* são colocados sobre cada folha. As plantas inoculadas são colocadas em câmara escurecida a 20 °C e umidade relativa do ar de 100%.

Dois dias após a inoculação, o tamanho das lesões sobre as folhas é avaliado. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100% indica que nenhuma doença é observada.

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais em concentração de 500 ppm de ingrediente ativo: 12, 49, 54, 72, 73, 82, 86, 87, 88, 89, 90, 92, 93, 95, 96, 98, 99; 101, 103, 105, 107, 108, 111, 113, 119, 123, 124, 125, 126, 127, 131.

EXEMPLO DE EFICÁCIA G

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

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

5 Emulsificante: 1 parte em peso de alquilaril poliglicol éter

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

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

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

O teste é avaliado dez dias após a inoculação. Zero por cento indica eficácia que corresponde à do controle, enquanto eficácia de 100%
20 indica que nenhuma doença é observada. Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção com as estruturas a seguir exibiram eficácia de 70% ou até mais em concentração de 10 ppm de ingrediente ativo: 129, 132, 133.

EXEMPLO DE EFICÁCIA H

TESTE PROTETOR IN VIVO SOBRE *MYZUS PERSICAE* (MYZUPE)

25 Solvente: 78 partes em peso de acetona
1,5 partes em peso de dimetilformamida

Tintura: 0,5 partes em peso de alquilaril poliglicol éter

Para produzir preparação apropriada de composto ativo, uma

parte em peso de composto ativo é misturada com as quantidades indicadas de solvente e emulsificante e o concentrado é diluído com água contendo emulsificante até a concentração desejada.

Discos de folhas de repolho chinês (*Brassica pekinensis*) infectados com todos os estágios do afídeo do pêssego verde (*Myzus persicae*) são pulverizados com preparação do ingrediente ativo na concentração desejada.

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

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir dos exemplos de preparação exibiram boa atividade: 3, 13, 16, 18, 19, 20, 25, 29, 30, 31, 35, 49, 52, 56, 61, 64, 65, 68, 69, 72, 73.

EXEMPLO DE EFICÁCIA I

15 TESTE PROTETOR IN VIVO SOBRE *Aedes aegypti* (AEDSAE U)

Solvente: 1% N-metilpirrolidona (NMP)
 1% diacetonoálcool

Tintura: sulfoflavina brilhante para água para manchar

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

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

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

Neste teste, os compostos a seguir do exemplo de preparação exibem boa atividade: 1, 3, 4, 6, 7, 9, 13, 14, 18, 29.

EXEMPLO DE EFICÁCIA J**TESTE PROTETOR IN VIVO SOBRE *HELIOTHIS VIRESENS* (HELIVI)**

Solvente: 78 partes em peso de acetona

1,5 partes em peso de dimetilformamida

5 Agente umectante: 0,5 partes em peso de alquilaril poliglicol éter

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

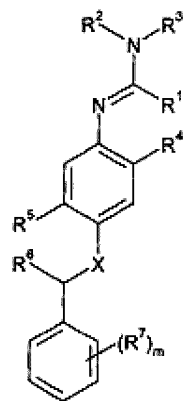
10 Seções de folhas de soja (*Glycine max*) são pulverizadas com preparação do ingrediente ativo na concentração desejada. Após a secagem, as seções de folhas são infestadas com ovos de lagarta do algodão (*Heliothis virescens*).

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

Neste teste, por exemplo, os compostos a seguir dos exemplos de preparação exibiram boa atividade: 6, 7.

REIVINDICAÇÕES

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



(Ia): $X = O$ - (Ib): $X = CH_2$

(I)

em que:

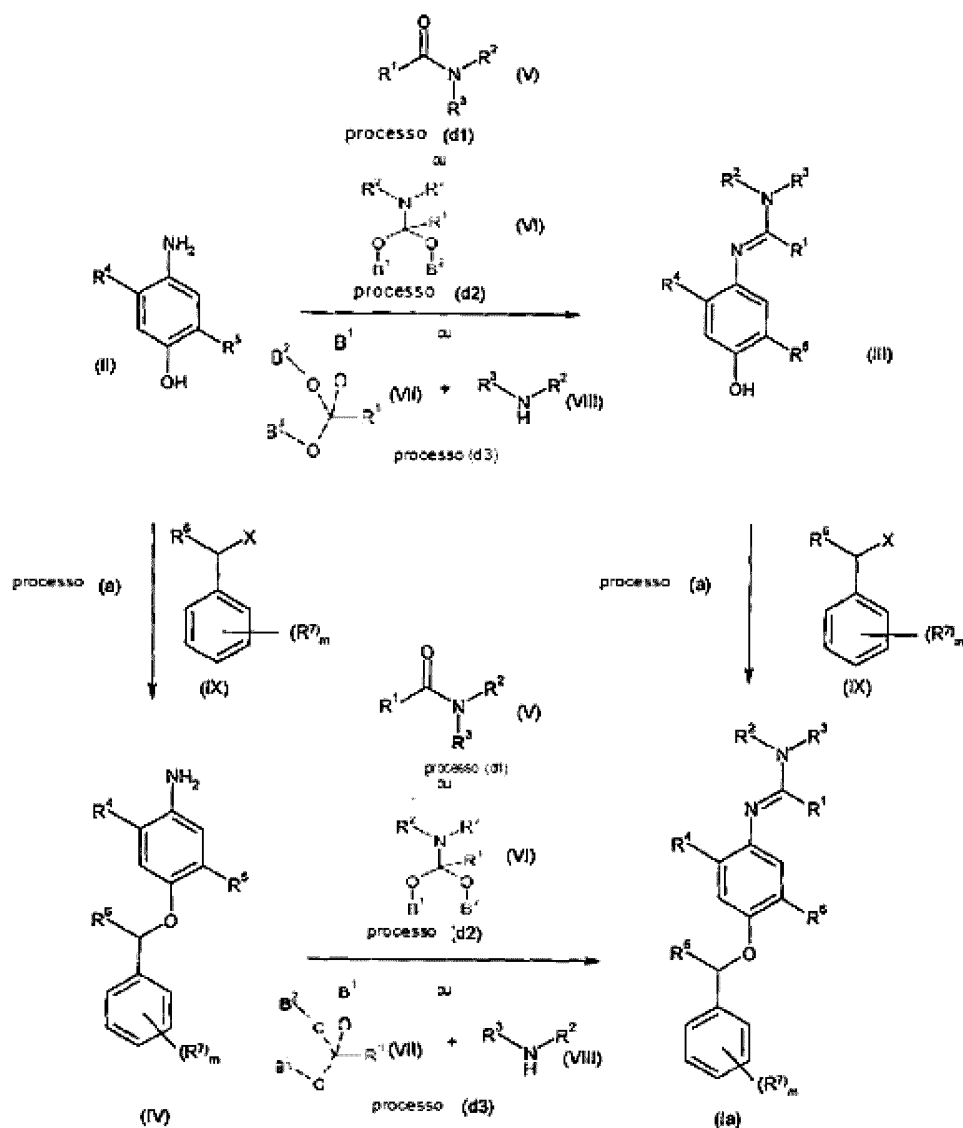
- X representa O ou CH_2 ;
- R^1 representa H ;
- R^2 e R^3 podem juntos formar heterociclo com $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$;
- R^4 representa metila;
- R^5 representa metila;
- R^6 representa H ou metila;
- m representa 1, 2 ou 3;
- R^7 , que pode ser idêntico ou diferente, representa Cl , F , I , Br , metila, $t-Bu$, CN , CF_3 , OCF_3 , $C=N-OMe$, OMe , $OCHF_2$, e SCF_3 ;
- dois substituintes R^7 podem formar anel com $-O-CH_2-O-$, $-N=S=N-$;

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

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

- R^6 representa metila; ou
- m representa 1, 2 ou 3.

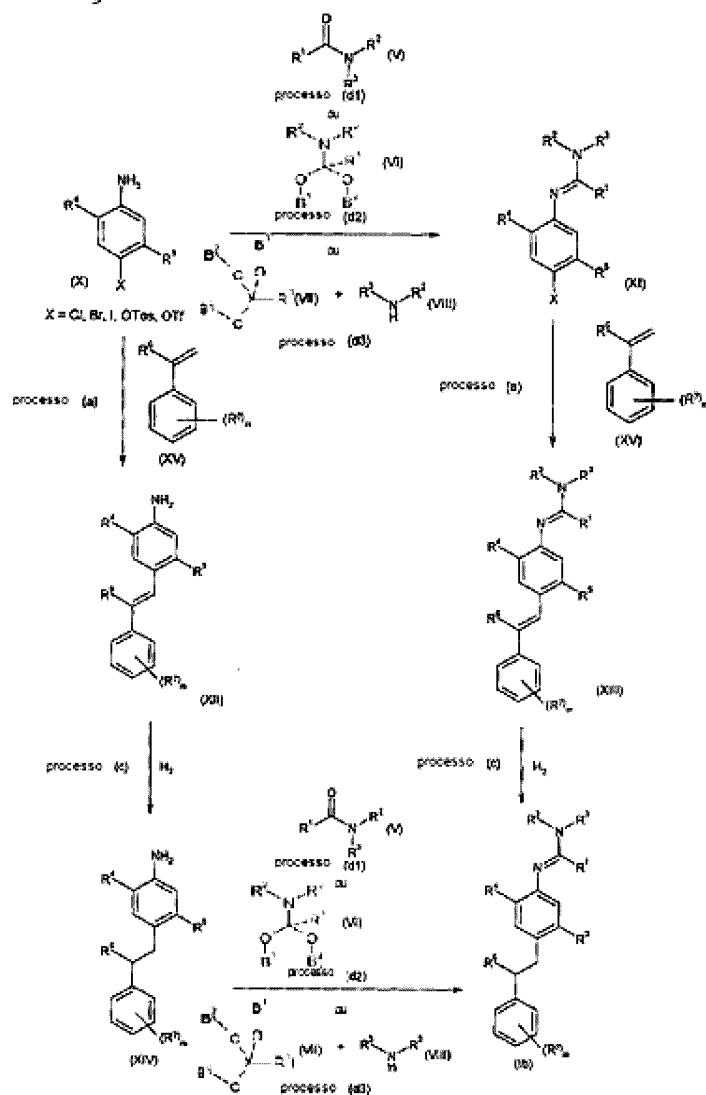
3. PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTO de fórmula (Ia), conforme descrito nas reivindicações 1 a 2, caracterizado pelo fato de que compreende pelo menos uma das etapas a seguir:



em que:

- R^1 a R^7 e X são conforme definidos em uma das reivindicações 1 a 2;
- B^1 , B^2 e B^3 na fórmula (VII) representam alquila;
- $B1$ e $B2$ na fórmula (VI) representam alquila ou, juntos, cicloalquila.

4. PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTO de fórmula (Ib), conforme descrito nas reivindicações 1 a 2, caracterizado pelo fato de que compreende pelo menos uma das etapas a seguir:



em que:

- R^1 a R^7 e X são conforme definidos em uma das reivindicações 1 a 2;
- B^1 , B^2 e B^3 na fórmula (VII) representam alquila;
- B1 e B2 na fórmula (VI) representam alquila ou, juntos, cicloalquila.

5. MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS, caracterizado pelo fato de que a quantidade agronomicamente eficaz e substancialmente não fitotóxica de um composto, conforme descrito nas reivindicações 1 a 2, é aplicada ao solo em que as plantas crescem ou são capazes de crescer, às folhas ou ao fruto das plantas ou às sementes das plantas.

6. MÉTODO PARA O CONTROLE DE INSETOS NOCIVOS, caracterizado pelo fato de que o composto de fórmula (I), conforme descrito nas reivindicações 1 a 2, é aplicado à semente, à planta ou ao fruto da planta ou ao solo em que a planta está crescendo ou onde se deseja que ela cresça.

RESUMO**“COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA, PROCESSOS PARA A
PREPARAÇÃO DE COMPOSTOS, MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS
FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS E MÉTODO PARA O CONTROLE DE
INSETOS NOCIVOS”**

5

A presente invenção refere-se a derivados de fenil-amidina benzilóxi e fenetil-substituídos de fórmula (I), em que os substituintes são conforme o relatório descritivo, seu processo de preparação, seu uso como agentes ativos inseticidas ou fungicidas, particularmente na forma de composições inseticidas ou fungicidas, e métodos de controle de fungos fitopatogênicos ou insetos nocivos, notadamente de plantas, utilizando estes compostos ou composições.

10