



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

(11) PI 0309830-3 B1



(22) Data de Depósito: 16/04/2003

(45) Data da Concessão: 28/07/2015
(RPI 2325)

(54) Título: Bifenilcarboxamidas, sua aplicação e seu processo de preparação, processo para combate de microorganismos indesejados, composição e seu processo de preparação

(51) Int.Cl.: C07C233/77; C07D319/16; C07D317/46; A01N43/30

(30) Prioridade Unionista: 29/04/2002 DE 102 19 035.6

(73) Titular(es): Bayer Cropscience AG

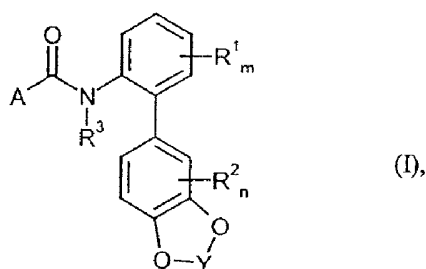
(72) Inventor(es): Astrid Mauler-Machnik, Hans-Ludwig Elbe, Heiko Rieck, Karl-Heinz Kuck, Martin Kugler, Ralf Dunkel, Robert Markert, Thomas Jaetsch, Ulrike Wachendorff-Neumann

Relatório Descritivo da Patente de Invenção para **"BIFENIL-CARBOXAMIDAS, SUA APLICAÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, PROCESSO PARA COMBATE DE MICROORGANISMOS INDESEJADOS, COMPOSIÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO"**.

5 A presente invenção refere-se a novas bifenilcarboxamidas, vários processos para a sua preparação e sua aplicação para o combate de microorganismos indesejados.

Já se sabe, que inúmeras carboxanilidas possuem propriedades fungicidas (compare WO 93/11.117, WO 99/09.013, WO 00/14.071, EP-A 10 0.545.099 e EP-A 0.589.301). A eficácia dessas substâncias é boa, mas em alguns casos, por exemplo, em baixas quantidades de aplicação, deixa a desejar.

Foram desenvolvidas novas bifenilcarboxamidas da fórmula (I)



na qual

15 R^1 e R^2 independentes um do outro, representam hidrogênio, halogênio, ciano, nitro, C_1 - C_8 -alquila, C_1 - C_8 -alcóxi, C_1 - C_8 -alquiltio, C_1 - C_6 -halogenoalquila, C_1 - C_6 -halogenoalcóxi ou C_1 - C_6 -halogenoalquiltio em cada caso com 1 até 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

m representa 1, 2, 3 ou 4, sendo que R^1 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2, 3 ou 4,

20 n representa 1, 2 ou 3, sendo que R^2 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2 ou 3,

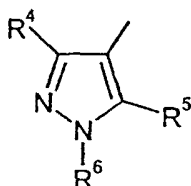
R^3 representa hidrogênio, hidróxi, C_1 - C_6 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_6 -alcóxi- C_1 - C_6 -alquila, ciano- C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -halogenoalquila com 1 até 7 átomos de halogênio, C_1 - C_6 -aminoalquila, C_1 - C_6 -alquilsulfenila, 25 C_1 - C_6 -halogenoalquilsulfonila com 1 até 7 átomos de halogênio, (C_1 - C_6 -alquil)carbonila, carbamoíla,

Y representa carbonila ou C_1 - C_3 -alquilenos eventualmente substituído uma ou

mais vezes, igual ou diferente por halogênio, C₁-C₆-alquila, C₁-C₆-alcóxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-halogenoalquila, C₁-C₆-halogenoalcóxi e/ou C₁-C₆-halogenoalquiltio em cada caso com 1 até 13 átomos de flúor, cloro e/ou bromo

5 e

A representa um radical da fórmula

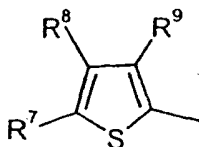


R⁴ representa hidrogênio, ciano, halogênio, nitro, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de halogênio, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-halogenoalquiltio com 1 até 5 átomos de halogênio, amino-carbonila ou aminocarbonil-C₁-C₄-alquila e

10 R⁵ representa hidrogênio, halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-alcóxi ou C₁-C₄-alquiltio e

R⁶ representa hidrogênio, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, hidróxi-C₁-C₄-alquila, C₂-C₆-alquenila, C₃-C₆-cicloalquila, C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalquiltio-C₁-C₄-alquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C₁-C₄-alcóxi-C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalcóxi-C₁-C₄-alquila com 1 até 5 átomos de halogênio ou fenila,

20 ou A representa um radical da fórmula

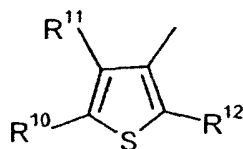


R⁷ e R⁸ independentes um do outro, representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

R⁹ representa halogênio, ciano ou C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de halogênio,

25 ou

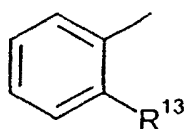
A representa um radical da fórmula



R¹⁰ e R¹¹ independentes um do outro, representam hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e R¹² representa hidrogênio, C₁-C₄-alquila ou halogênio,

5 ou

A representa um radical da fórmula

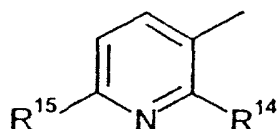


R¹³ representa hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, C₁-C₆-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C₁-C₄-halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de halogênio ou representa C₁-C₄-halogenoalquiltio com 1 até 5 átomos de halogênio,

10

ou

A representa um radical da fórmula



R¹⁴ representa halogênio, hidróxi, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-halogenoalquiltio com 1 até 5 átomos de halogênio ou representa C₁-C₄-halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de halogênio e

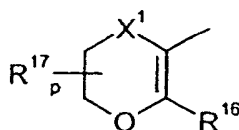
15

R¹⁵ representa hidrogênio, halogênio, hidróxi, ciano, C₁-C₄-alquila, C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C₁-C₄-alcóxi, C₁-C₄-alquiltio, C₁-C₄-halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de halogênio, C₁-C₄-alquilsulfonila ou representa C₁-C₄-alquilsulfonila,

20

ou

A representa um radical da fórmula



R¹⁶ representa C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

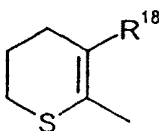
R¹⁷ representa C₁-C₄-alquila,

X¹ representa um átomo de enxofre, representa SO, SO₂ ou CH₂,

5 p representa 0, 1 ou 2, na qual R¹⁷ representa radicais iguais ou diferentes, quando p representa 2,

ou

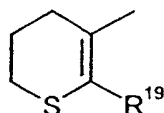
A representa um radical da fórmula



10 R¹⁸ representa C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

ou

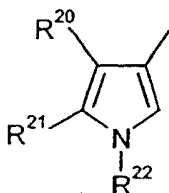
A representa um radical da fórmula



R¹⁹ representa C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

15 ou

A representa um radical da fórmula



R²⁰ representa halogênio, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

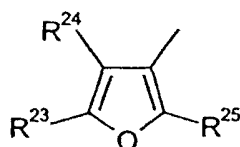
R²¹ representa hidrogênio, halogênio, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-

halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio.

R^{22} representa hidrogênio, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C_1 - C_4 -alcóxi- C_1 - C_4 -alquila, hidróxi- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alquilsulfonila, di(C_1 - C_4 -alquil)aminossulfonila, C_1 - C_6 -alquilcarbonila ou

ou

A representa um radical da fórmula

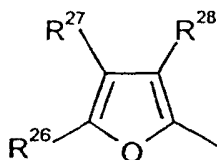


R^{23} e R^{24} independentes um do outro, representam hidrogênio, halogênio, amino, C_1 - C_4 -alquila ou representam C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

R^{25} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula

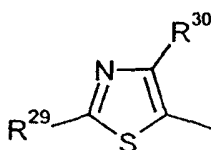


R^{26} e R^{27} independentes um do outro, representam hidrogênio, halogênio, amino, nitro, C_1 - C_4 -alquila ou representam C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

R^{28} representa hidrogênio, halogênio, C_1 - C_4 -alquila ou representa C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



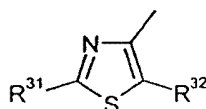
R^{29} representa hidrogênio, halogênio, amino, C_1 - C_4 -alquilamino, di-(C_1 - C_4 -

alquil)amino, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

R³⁰ representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

5 ou

A representa um radical da fórmula

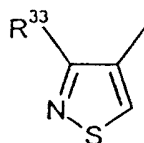


R³¹ representa hidrogênio, halogênio, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, C₁-C₄-alquila ou representa C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio e

10 R³² representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

ou

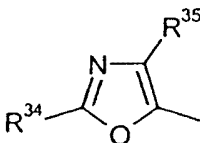
A representa um radical da fórmula



15 R³³ representa halogênio, C₁-C₄-alquila ou C₁-C₄-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula

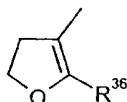


R³⁴ representa hidrogênio ou C₁-C₄-alquila e

R³⁵ representa halogênio ou C₁-C₄-alquila,

20 ou

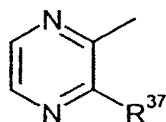
A representa um radical da fórmula



R^{36} representa C_1 - C_4 -alquila ou C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio,

ou

A representa um radical da fórmula



- 5 R^{37} representa hidrogênio, halogênio ou C_1 - C_4 -alquila.

Os compostos da fórmula (I) podem apresentar-se, em função do tipo dos substituintes, com isômeros ou misturas de isômeros geométricos e/ou ópticos de diferente composição. A invenção refere-se tanto à aplicação dos isômeros puros como também às misturas de isômeros.

- 10 Além disso, foi verificado, que se obtêm bifenilcarboxamidas da fórmula (I), quando

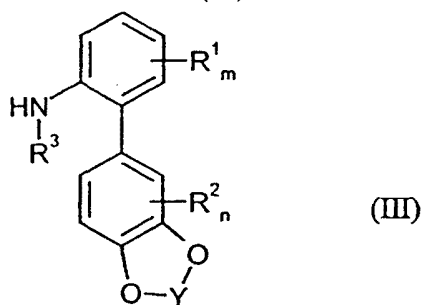
a) reagem-se derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)



na qual

A tem os significados indicados acima e

- 15 G representa halogênio, hidróxi ou C_1 - C_6 -alcóxi, com derivados de anilina da fórmula (III)



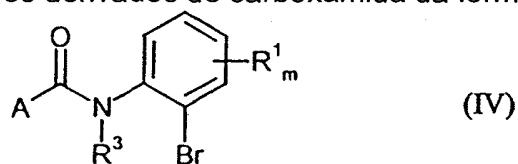
na qual

R^1 , R^2 , m, n, R^3 e Y têm os significados indicados acima,

eventualmente na presença de um catalisador, eventualmente na presença

- 20 de um agente ligador de ácido e eventualmente na presença de um diluente, ou

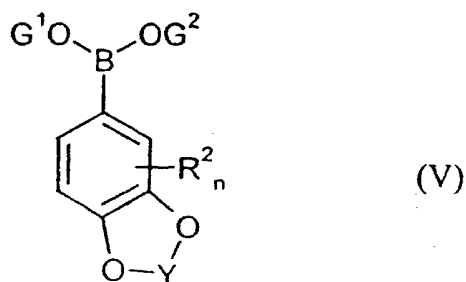
b) quando reagem-se derivados de carboxamida da fórmula (IV)



na qual

R^1 , m , R^3 e A têm os significados indicados acima,

com derivados de ácido borônico da fórmula (V)



5 na qual

R^2 , n e Y têm os significados indicados acima e

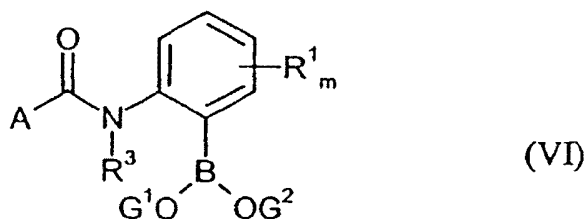
G^1 e G^2 representam em cada caso hidrogênio ou juntos representam tetra-
metiletileno,

na presença de um catalisador, eventualmente na presença de um agente

10 ligador de ácido e eventualmente na presença de um diluente,

ou

c) quando reagem-se derivados de ácido carboxamid-borônico da fórmula
(VI)

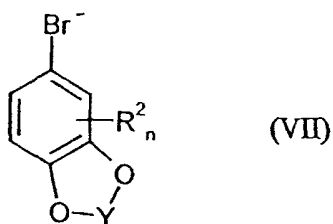


na qual

15 R^1 , m , R^3 e A têm os significados indicados acima e

G^1 e G^2 representam em cada caso hidrogênio ou juntos representam tetra-
metiletileno,

com derivados de fenila da fórmula (VII)



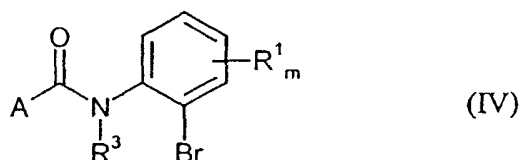
na qual

R^2 , n e Y têm os significados indicados acima,

na presença de um catalisador, eventualmente na presença de um agente ligador de ácido e eventualmente na presença de um diluente,

5 ou

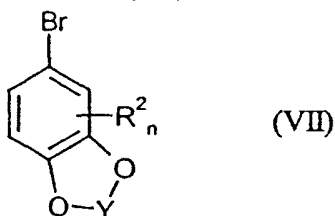
c) quando reagem-se derivados de carboxamida da fórmula (IV)



na qual

R^1 , m, R^3 e A têm os significados indicados acima,

com derivados de fenila da fórmula (VII)



10 na qual

R^2 , n e Y têm os significados indicados acima,

na presença de um catalisador de paládio ou de platina e na presença de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, eventualmente na presença de um agente ligador de ácido e eventualmente na presença de

15 um diluente.

Finalmente, foi verificado, que as novas bifenilcarboxamidas da fórmula (I) possuem propriedades microbicidas muito boas e são aplicáveis para o combate de microorganismos indesejados tanto na proteção de plantas como também na proteção de material.

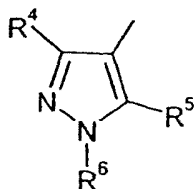
20 Surpreendentemente, as bifenilcarboxamidas da fórmula (I) de

acordo com a invenção, mostram uma eficácia fungicida essencialmente melhor do que as substâncias ativas constitucionalmente semelhantes com mesma direção de efeito.

As bifenilcarboxamidas de acordo com a invenção, são definidas de modo geral pela fórmula (I).

- São preferidas bifenilcarboxamidas da fórmula (I), na qual R^1 e R^2 independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, C_1 - C_6 -alquila, C_1 - C_6 -alcóxi, C_1 - C_6 -alquiltio, C_1 - C_4 -halogenoalquila, C_1 - C_4 -halogenoalcóxi, C_1 - C_4 -halogenoalquiltio em cada caso com 1 até 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, m representa 1, 2 ou 3, sendo que R^1 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2 ou 3, n representa 1, 2 ou 3, sendo que R^2 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2 ou 3, R^3 representa hidrogênio, hidróxi, C_1 - C_4 -alquila, C_3 - C_6 -cicloalquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_3 -alcóxi- C_1 - C_2 -alquila, ciano- C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de halogênio, C_1 - C_4 -aminoalquila, C_1 - C_4 -alquilsulfenila, C_1 - C_4 -halogenoalquilsulfenila com 1 até 5 átomos de halogênio,, (C_1 - C_4 -alquil)carbonila, Y representa carbonila ou representa C_1 - C_2 -alquilenos eventualmente substituído uma ou mais vezes, igual ou diferente por flúor, cloro, bromo, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_4 -alcóxi, C_1 - C_4 -alquiltio, C_1 - C_4 -halogenoalquila, C_1 - C_4 -halogenoalcóxi e/ou C_1 - C_4 -halogenoalquiltio em cada caso com 1 até 9 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

A representa um radical da fórmula



R^4 representa hidrogênio, ciano, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, i-propila, C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bro-

mo, ciclopropila, metóxi, etóxi, C₁-C₂-halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, metiltio, etiltio, trifluormetiltio, difluormetiltio, aminocarbonila, aminocarbonilmetila ou aminocarboniletila,

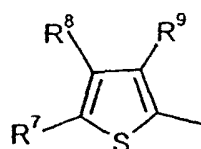
R⁵ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi,

5 metiltio ou etiltio e

R⁶ representa hidrogênio, metila, etila, n-propila, i-propila, C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, hidroximetila, hidroxietila, ciclopropila, ciclopentila, ciclohexila ou fenila,

ou

10 A representa um radical da fórmula



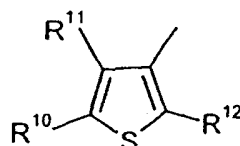
R⁷ e R⁸ independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R⁹ representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila ou C₁-C₂-halogenoalcóxi

15 com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

A representa um radical da fórmula



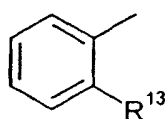
R¹⁰ e R¹¹ independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor,

20 cloro e/ou bromo e

R¹² representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila,

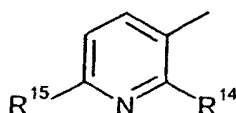
ou

A representa um radical da fórmula



R^{13} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidróxi, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C_1 - C_2 -halogenoalquiltio com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

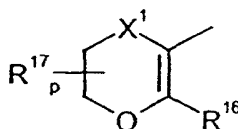
- 5 A representa um radical da fórmula



R^{14} representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidróxi, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio ou representa C_1 - C_2 -halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

- 10 R^{15} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, C_1 - C_4 -alquila, C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, representa C_1 - C_2 -halogenoalcóxi com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C_1 - C_2 -alquilsulfinila ou C_1 - C_2 -alquilsulfonila,, ou

- 15 A representa um radical da fórmula



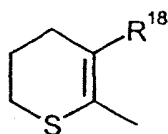
R^{16} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R^{17} representa metila ou etila,

X^1 representa um átomo de enxofre, representa SO , SO_2 ou CH_2 e

- 20 p representa 0, 1 ou 2, em que R^{17} representa radicais iguais ou diferentes, quando p representa 2, ou

A representa um radical da fórmula

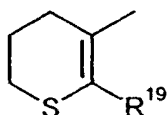


R^{18} representa metila, etila ou representa C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5

átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

A representa um radical da fórmula

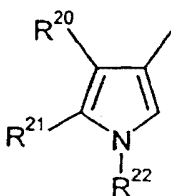


R¹⁹ representa metila, etila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5

5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

A representa um radical da fórmula



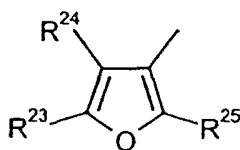
R²⁰ representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, i-propila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

10 R²¹ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R²² representa hidrogênio, metila, etila, C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, C₁-C₂-alcóxi-C₁-C₂-alquila, hidroximetila, hidroxietila, metilsulfonila ou dimetilaminossulfonila,

15 ou

A representa um radical da fórmula

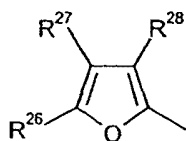


R²³ e R²⁴ independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metila, etila ou representam C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

20 R²⁵ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

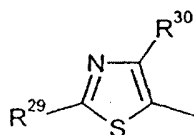
A representa um radical da fórmula



R²⁶ e R²⁷ independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metila, etila ou representam C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

- 5 R²⁸ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

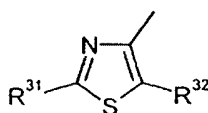
A representa um radical da fórmula



- 10 R²⁹ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, metila, etila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

R³⁰ representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

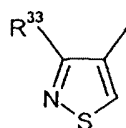
- 15 A representa um radical da fórmula



R³¹ representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, C₁-C₄-alquilamino, di-(C₁-C₄-alquil)amino, ciano, metila, etila ou representa C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo e

- 20 R³² representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C₁-C₂-halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo, ou

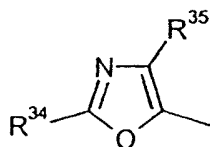
A representa um radical da fórmula



R^{33} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila ou C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

A representa um radical da fórmula

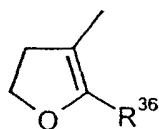


5 R^{34} representa hidrogênio, metila ou etila e

R^{35} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila,

ou

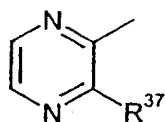
A representa um radical da fórmula



10 R^{36} representa metila, etila ou C_1 - C_2 -halogenoalquila com 1 até 5 átomos de flúor, cloro e/ou bromo,

ou

A representa um radical da fórmula



R^{37} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

Particularmente, são preferidas bifenilcarboxamidas da fórmula

15 (I), na qual

R^1 e R^2 independentes um do outro representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, ciano, nitro, metila, etila, n-propila, i-propila, n-butila, i-butila, s-butila, t-butila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, triclorometila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila, difluormetóxi, trifluormetóxi, trifluormetiltio, difluorclorometiltio,

20

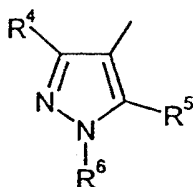
m representa 1 ou 2, sendo que R^1 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2,

n representa 1 ou 2, sendo que R^2 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2,

R^3 representa hidrogênio, hidróxi, metila, etila, n-propila, i-propila, n-, i-, s-, t-butila, ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclohexila, metóxi, etóxi, metoximetila, cianometila, difluormetila, metilsulfenila, triclorometilsulfenila ou acetila,

- 5 Y representa carbonila ou representa $-CH_2$ ou $-(CH_2)_2$ em cada caso eventualmente substituído uma até quatro vezes, igual ou diferente por flúor, cloro, bromo, metila, etila, i-propila, t-butila, metóxi, i-propóxi, t-butóxi, metiltio, i-propiltio, t-butiltio, trifluormetila, trifluormetóxi e/ou por trifluormetiltio e

- 10 A representa um radical da fórmula



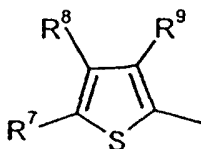
R^4 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, i-propila, monofluormetila, difluormetila, trifluormetila, difluorclorometila, triclorometila, ciclopropila, metóxi, etóxi, trifluormetóxi, triclorometóxi, metiltio, etiltio, trifluormetiltio ou difluormetiltio e

- 15 R^5 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, etila, metóxi, etóxi, metiltio ou etiltio e

R^6 representa hidrogênio, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, hidroximetila, hidroxietila ou fenila,

ou

- 20 A representa um radical da fórmula



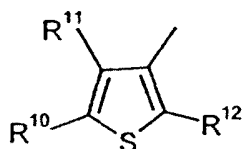
R^7 e R^8 independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluormetila, trifluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

R^9 representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, trifluormetóxi, difluormetóxi,

- 25 difluorclorometóxi ou triclorometóxi,

ou

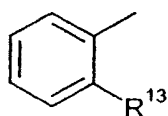
A representa um radical da fórmula



R^{10} e R^{11} independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluormetila, trifluormetila, difluorclorometila ou tricloro-
5 metila e

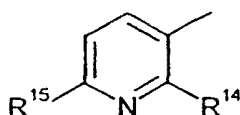
R^{12} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila,
ou

A representa um radical da fórmula



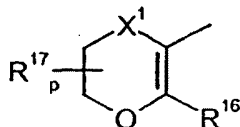
R^{13} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, hidróxi, ciano, metila,
10 etila, n-propila, i-propila, n-butila, i-butila, s-butila, t-butila, difluormetila, trifluorometila, difluorclorometila, triclorometila, trifluormetóxi, difluormetóxi, difluorclorometóxi, triclorometóxi, trifluormetiltio, difluormetiltio, difluorclorometiltio ou triclorometiltio, ou

A representa um radical da fórmula



15 R^{14} representa flúor, cloro, bromo, iodo, hidróxi, ciano, metila, etila, n-propila, i-propila, n-butila, i-butila, s-butila, t-butila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila, triclorometila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, trifluormetóxi, difluormetóxi, difluorclorometóxi ou triclorometóxi e
 R^{15} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, ciano, n-propila, i-
20 propila, n-butila, i-butila, s-butila, t-butila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila, triclorometila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, trifluormetóxi, difluorclorometóxi, difluorclorometóxi, triclorometóxi, metilsulfinila ou metilsulfonyl,
ou

A representa um radical da fórmula

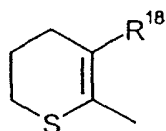


R^{16} representa metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

R^{17} representa metila ou etila,

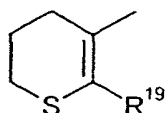
- 5 X^1 representa um átomo de enxofre, representa SO, SO_2 ou CH_2 e
 p representa 0, 1 ou 2, sendo que R^{17} representa radicais iguais ou diferentes, quando p representa 2,
 ou

A representa um radical da fórmula



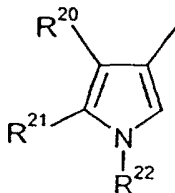
- 10 R^{18} representa metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,
 ou

A representa um radical da fórmula



- 15 R^{19} representa metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,
 ou

A representa um radical da fórmula



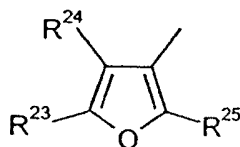
- R^{20} representa flúor, cloro, bromo, ciano, metila, etila, i-propila, trifluormetila difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,
 20 R^{21} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila di-

fluormetila ou triclorometila e

R^{22} representa hidrogênio, metila, etila, trifluormetila, metoximetila, etoximetila, hidroximetila ou hidroxietila,

ou

- 5 A representa um radical da fórmula

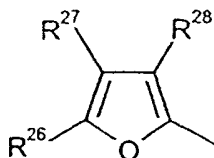


R^{23} e R^{24} independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

- 10 R^{25} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,

ou

A representa um radical da fórmula

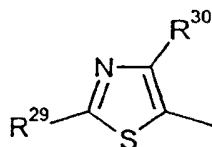


- 15 R^{26} e R^{27} independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, nitro, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

R^{28} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,

ou

A representa um radical da fórmula

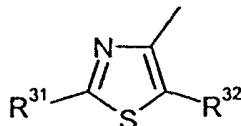


- 20 R^{29} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

R^{30} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,

ou

A representa um radical da fórmula

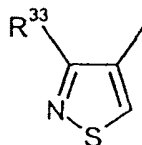


- 5 R^{31} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

R^{32} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,

- 10 ou

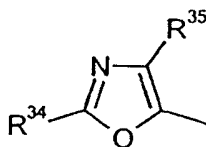
A representa um radical da fórmula



R^{33} representa flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou triclorometila,

ou

- 15 A representa um radical da fórmula

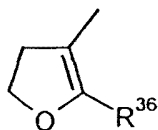


R^{34} representa hidrogênio, metila ou etila e

R^{35} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila,

ou

A representa um radical da fórmula

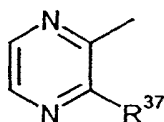


- 20 R^{36} representa metila, etila, trifluormetila, difluormetila, difluorclorometila ou

triclorometila,

ou

A representa um radical da fórmula



R^{37} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila ou etila.

5 Muito particularmente são preferidas bifenilcarboxamidas da fórmula (I), na qual

R^1 e R^2 independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, n-propila, i-propila, n-butila, i-butila, s-butila, t-butila, metóxi, etóxi, metiltio, etiltio, triclorometila, trifluormetila, difluormetila, trifluormetóxi, trifluormetiltio,

10 m representa 1 ou 2, sendo que R^1 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2,

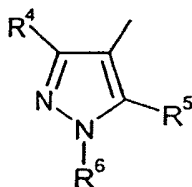
n representa 1,

R^3 representa hidrogênio, metila, etila, n-propila, i-propila, n-, i-, s-, t-butila, 15 ciclopropila, ciclopentila ou ciclohexila,

Y representa carbonila ou representa $-CH_2-$ ou $-(CH_2)_2-$ em cada caso eventualmente substituído uma até quatro vezes, igual ou diferente por flúor, metila, i-propila, t-butila, metóxi, i-propóxi, t-butóxi, metiltio, i-propiltio, t-butiltio, trifluormetila, trifluormetóxi e/ou trifluormetiltio

20 e

A representa um radical da fórmula



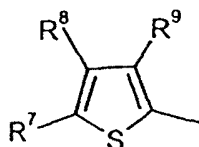
R^4 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, i-propila, monofluormetila, difluormetila, trifluormetila, difluorclorometila ou triclorometila e

R^5 representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo ou metila e

25 R^6 representa hidrogênio, metila, trifluormetila ou fenila,

ou

A representa um radical da fórmula

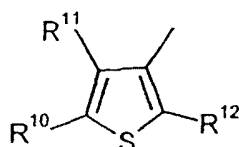


R^7 e R^8 independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluormetila, trifluormetila ou triclorometila e

- 5 R^9 representa flúor, cloro, bromo, metila ou trifluormetóxi,

ou

A representa um radical da fórmula

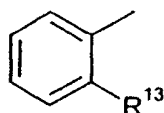


R^{10} e R^{11} independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, difluormetila, trifluormetila ou triclorometila e

- 10 R^{12} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou metila,

ou

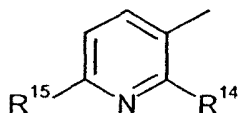
A representa um radical da fórmula



R^{13} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, metila, difluormetila, trifluormetila ou triclorometila,

- 15 ou

A representa um radical da fórmula



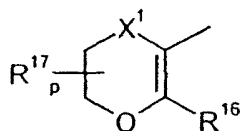
R^{14} representa flúor, cloro, bromo, iodo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila e

- 20 R^{15} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, iodo, n-propila, i-propila, n-butila, i-butila, s-butila, t-butila, trifluormetila, difluormetila, triclorometila, me-

tilsulfonila ou metilsulfonila,

ou

A representa um radical da fórmula



R^{16} representa metila, etila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila e

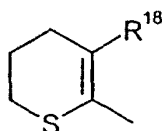
5 R^{17} representa metila ou etila,

X^1 representa um átomo de enxofre, representa SO, SO₂ ou CH₂ e

p representa 0, 1 ou 2, sendo que R^{17} representa radicais iguais ou diferentes, quando p representa 2,

ou

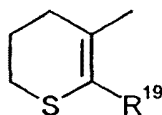
10 A representa um radical da fórmula



R^{18} representa metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

ou

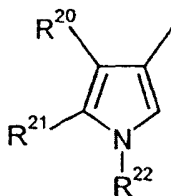
A representa um radical da fórmula



R^{19} representa metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

15 ou

A representa um radical da fórmula



R^{20} representa flúor, cloro, bromo, metila, i-propila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

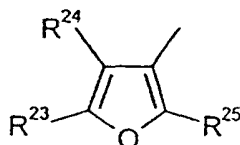
R^{21} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, etila, trifluormetila, di-

fluormetila ou triclorometila e

R^{22} representa hidrogênio, metila, etila, trifluormetila ou metoximetila,

ou

A representa um radical da fórmula

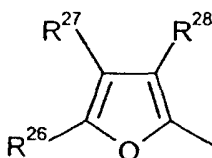


- 5 R^{23} e R^{24} independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila e

R^{25} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

ou

- 10 A representa um radical da fórmula

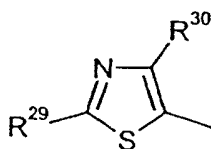


R^{26} e R^{27} independentes um do outro, representam hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila e

R^{28} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

- 15 ou

A representa um radical da fórmula



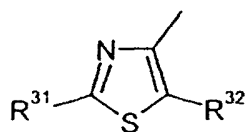
R^{29} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila e

R^{30} representa flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

- 20

ou

A representa um radical da fórmula

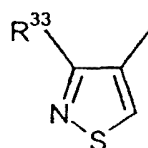


R^{31} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila e

R^{32} representa flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

5 ou

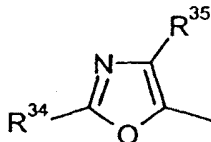
A representa um radical da fórmula



R^{33} representa flúor, cloro, bromo, metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

ou

10 A representa um radical da fórmula

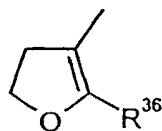


R^{34} representa hidrogênio, metila ou etila e

R^{35} representa flúor, cloro, bromo, metila ou etila,

ou

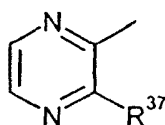
A representa um radical da fórmula



15 R^{36} representa metila, trifluormetila, difluormetila ou triclorometila,

ou

A representa um radical da fórmula



R^{37} representa hidrogênio, flúor, cloro, bromo ou metila.

Especialmente são preferidas bifenilcarboxamidas da fórmula (I),

na qual

R^1 representa hidrogênio, flúor, cloro, metila,

5 R^2 representa hidrogênio,

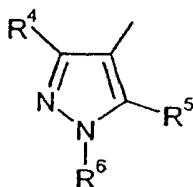
m representa 1 ou 2, sendo que R^1 representa radicais iguais ou diferentes, quando m representa 2,

n representa 1,

R^3 representa hidrogênio,

10 Y representa $-\text{CH}_2-$, $-(\text{CH}_2)_2-$, $-\text{CF}_2-$ ou $-(\text{CF}_2)_2-$
e

A representa um radical da fórmula



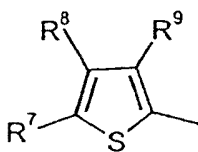
R^4 representa metila, monofluormetila, difluormetila ou trifluormetila e

R^5 representa hidrogênio, flúor, cloro ou metila e

15 R^6 representa metila,

ou

A representa um radical da fórmula

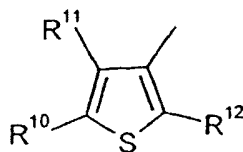


R^7 e R^8 representam hidrogênio e

R^9 representa metila,

20 ou

A representa um radical da fórmula

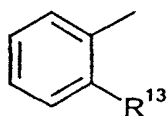


R^{10} e R^{11} representam hidrogênio e

R^{12} representa metila,

ou

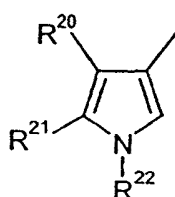
A representa um radical da fórmula



R^{13} representa iodo, metila, difluormetila ou trifluormetila,

5 ou

A representa um radical da fórmula



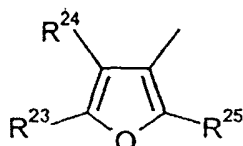
R^{20} representa metila, trifluormetila ou difluormetila,

R^{21} representa hidrogênio, flúor, cloro, metila, trifluormetila ou difluormetila e

R^{22} representa hidrogênio, metila, etila, trifluormetila ou metoximetila,

10 ou

A representa um radical da fórmula

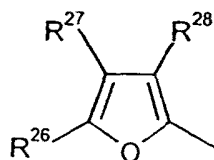


R^{23} e R^{24} representam hidrogênio e

R^{25} representa metila,

ou

15 A representa um radical da fórmula

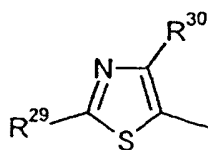


R^{26} e R^{27} representam hidrogênio e

R^{28} representa metila,

ou

A representa um radical da fórmula

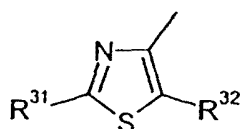


R²⁹ representa amino, metilamino, dimetilamino, metila ou trifluormetila e

R³⁰ representa metila, trifluormetila ou difluormetila,

ou

A representa um radical da fórmula

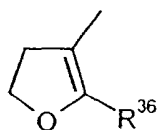


5 R³¹ representa amino, metilamino, dimetilamino, metila ou trifluormetila e

R³² representa metila, trifluormetila ou difluormetila,

ou

A representa um radical da fórmula



R³⁶ representa metila ou trifluormetila.

10 Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual R³ representa hidrogênio.

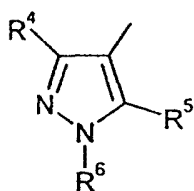
Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual R² representa hidrogênio.

15 Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual Y representa -CH₂-, -(CH₂)₂-, -CF₂- ou -(CH₂)₂-.

Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual R¹ representa hidrogênio, flúor, cloro ou metila, particularmente são destacados para hidrogênio ou flúor.

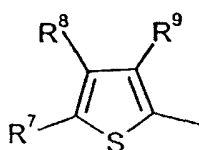
20 Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual m representa 0, 1 ou 2.

Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual A representa um radical da fórmula



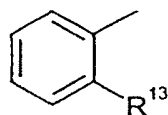
na qual R^4 , R^5 e R^6 têm os significados indicados acima.

Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual A representa um radical da fórmula



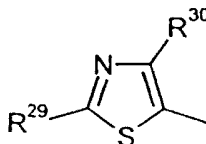
na qual R^7 , R^8 e R^9 têm os significados indicados acima.

- 5 Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual A representa um radical da fórmula



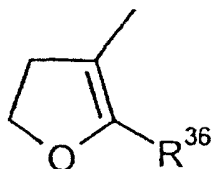
na qual R^{13} tem os significados indicados acima.

Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual A representa um radical da fórmula



- 10 na qual R^{29} e R^{30} têm os significados indicados acima.

Além disso, são destacados compostos da fórmula (I), na qual A representa um radical da fórmula



na qual R^{36} tem os significados indicados acima.

- 15 Radicais hidrocarboneto saturados ou insaturados tais como alquila ou alquenila podem, também em combinação com heteroátomos tal como por exemplo, no alcóxi, desde que possível, ser em cada caso em ca-

deia linear ou ramificada.

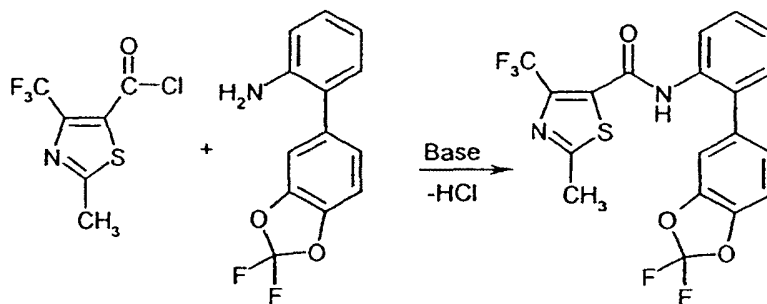
Radicais eventualmente substituídos podem ser substituídos uma ou mais vezes, sendo que em substituições múltiplas os substituintes podem ser iguais ou diferentes.

5 Radicais substituídos por halogênio, tal como por exemplo, halogenoalquila, são halogenados uma ou mais vezes. Na halogenação múltipla, os átomos de halogênio podem ser iguais ou diferentes. Halogênio representa com isso, flúor, cloro, bromo e iodo, representa especialmente flúor, cloro e bromo.

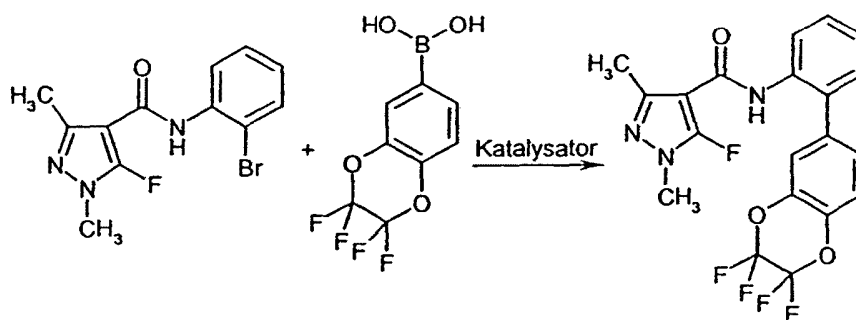
10 As definições ou esclarecimentos dos radicais citados acima de modo geral ou citados em âmbitos preferenciais, podem ser no entanto, também eventualmente combinados entre si, isto é, entre os respectivos âmbitos e âmbitos preferenciais. Eles valem para os produtos finais bem como para os pré-produtos e produtos intermediários correspondentemente.

15 Além disso, também podem ser desnecessárias definições isoladas.

Aplicando-se cloreto de ácido 2-metil-4-trifluormetil-1,3-tiazol-5-carboxílico e (2,2-difluór-1,3-benzodioxol-5-il)fenilamina como substâncias de partida, então o decurso do processo (a) de acordo com a invenção, pode ser mostrado pelo seguinte esquema de fórmula,

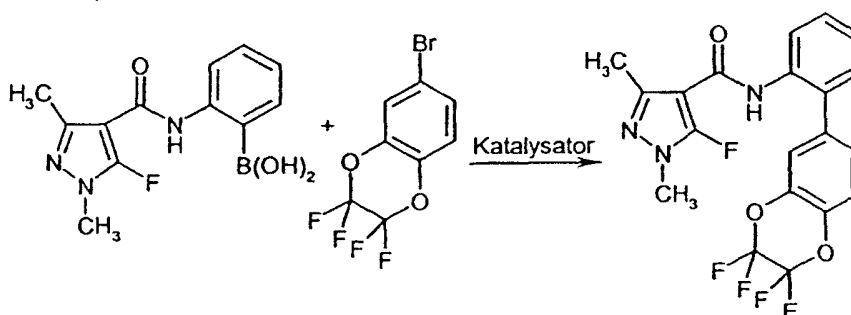


20 Aplicando-se *N*-(2-bromofenil)-5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida e ácido 2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il-borônico como substâncias de partida, bem como um catalisador, então o decurso do processo (b) de acordo com a invenção, pode ser mostrado pelo seguinte esquema de fórmula.



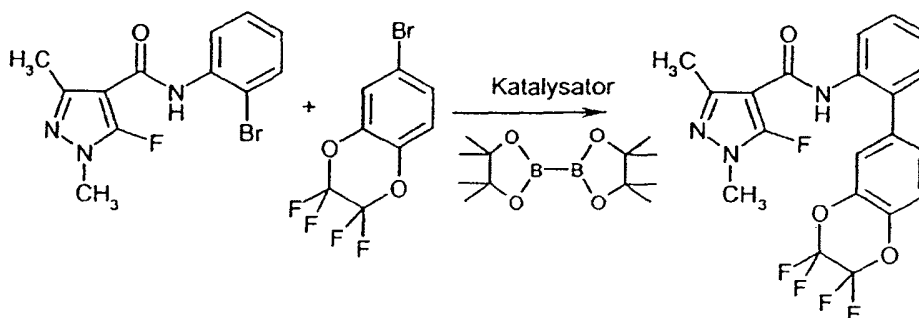
Katalysator = catalisador

- Aplicando-se ácido 2-[[5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]carbo-
nil]amino}fenil-borônico e 6-bromo-2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodi-
oxina como substâncias de partida bem como um catalisador, então o de-
curso do processo (c) de acordo com a invenção, pode ser mostrado pelo
5 seguinte esquema de fórmula.



Katalysator = catalisador

- Aplicando-se *N*-(2-bromofenil)-5-flúor-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-
carboxamida e 6-bromo-2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodioxina como
substâncias de partida bem como um catalisador e 4,4,4',4',5,5,5',5'-
10 octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolana, então o decurso do processo (d) de
acordo com a invenção, pode ser mostrado pelo seguinte esquema de fór-
mula.



katalysator = catalisador

Elucidação dos processos e produtos intermediários

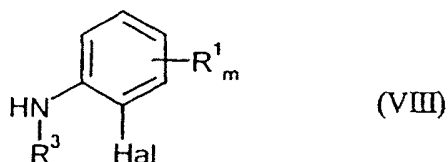
Os derivados de ácido carboxílico necessários como substâncias de partida na execução do processo (a) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (II). Nesta fórmula, A representa de preferência, aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos. G representa de preferência, cloro, bromo, hidróxi, metóxi ou etóxi, particularmente de preferência, representa cloro, hidróxi ou metóxi.

Os derivados de ácido carboxílico da fórmula (II) são conhecidos ou podem ser preparados por processos conhecidos (compare WO 93/11.117, EP-A 0.545.099, EP-A 0.589.301 e EP-A 0.589.313).

Os derivados de anilina necessários como componentes de reação na execução do processo (a) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (III). Nesta fórmula, R^1 , R^2 , m, n, R^3 e Y têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos para estes radicais ou índices.

Os derivados de anilina da fórmula (III) são novos. Eles podem ser parcialmente preparados por métodos conhecidos (compare EP-A 0.545.099 e EP-A 0.589.301). Os derivados de anilina da fórmula (III) são obtidos, quando

e) reagem-se derivados de 2-halogenoanilina da fórmula geral (VIII)

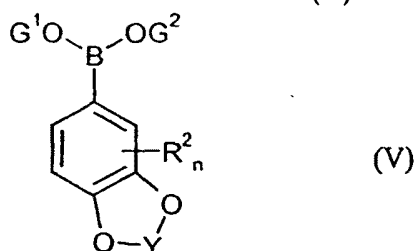


na qual

R^1 , m e R^3 têm os significados indicados acima e

Hal representa halogênio,

com derivados de ácido borônico da fórmula (V)

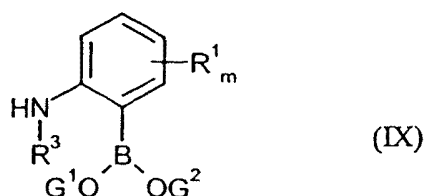


na qual

R^2 , n , Y , G^1 e G^2 têm os significados indicados acima,

- 5 eventualmente na presença de um agente ligador de ácido, bem como eventualmente na presença de um diluente orgânico inerte, bem como eventualmente na presença de um catalisador ou

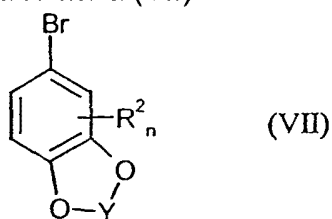
f) quando reagem-se ácidos anilino-borônicos da fórmula (IX)



- 10 na qual

R^1 , m , R^3 , G^1 e G^2 têm os significados indicados acima,

com derivados de fenila da fórmula (VII)



na qual

R^2 , n e Y têm os significados indicados acima,

- 15 eventualmente na presença de um agente ligador de ácido, bem como eventualmente na presença de um diluente orgânico inerte, bem como eventualmente na presença de um catalisador.

Os derivados de 2-halogenoanilina necessários como componentes de reação na execução do processo (e) de acordo com a invenção,

são definidos de modo geral pela fórmula (VIII). Nesta fórmula, R^1 , m e R^3 têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos para estes radicais ou índices. Hal representa de preferência, flúor, cloro ou bromo, representa particularmente de preferência, cloro ou bromo.

Os derivados de 2-halogenoanilina da fórmula (VIII) são conhecidos e/ou podem ser preparados a partir dos compostos nitro correspondentes mediante redução. No caso, de R^3 não representar hidrogênio, os compostos da fórmula (VIII) podem ser obtidos através de derivatizações conhecidas dos derivados de anilina obtidos.

Os derivados de ácido borônico da fórmula (V) necessários além disso, como substâncias de partida para a execução do processo (e) de acordo com a invenção, são elucidados mais detalhadamente abaixo no contexto com o processo (b) de acordo com a invenção.

Os ácidos anilinoborônicos necessários como componentes de reação na execução do processo (f) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (IX). Nesta fórmula, R^1 , m e R^3 têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos para estes radicais ou índices. G^1 e G^2 representam de preferência, em cada caso hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno.

Os ácidos anilinoborônicos da fórmula (IX) são conhecidos e/ou podem ser obtidos por métodos conhecidos.

Os derivados de fenila da fórmula (VII) necessários além disso, como substâncias de partida para a execução do processo (f) de acordo com a invenção, são elucidados mais detalhadamente abaixo no contexto com o processo (d) de acordo com a invenção.

Os derivados de carboxamida necessários como substâncias de

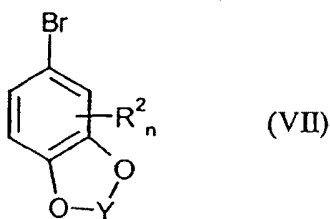
partida na execução dos processos (b) e (d), são definidos de modo geral pela fórmula (IV). Nesta fórmula, R^1 , m, R^3 e A têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais ou
 5 estes índices como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos.

Os derivados de carboxamida da fórmula (IV) são conhecidos ou podem ser preparados por processos conhecidos (compare por exemplo, WO 91/01311, EP-A 0.371.950).

10 Os derivados de ácido borônico necessários como substâncias de partida na execução dos processos (b) e (e) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (V). Nesta fórmula, R^2 , n e Y têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais como sendo preferidos, particularmente preferi-
 15 dos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos para estes radicais ou índices. G^1 e G^2 representam de preferência, em cada caso hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno.

Os derivados de ácido borônico da fórmula (V) são conhecidos
 20 e/ou podem ser preparados por processos conhecidos (compare por exemplo, WO 01/90084 e US 5.633.218). Eles são obtidos por exemplo, quando se

g) reagem derivados de fenila da fórmula (VII)



na qual R^2 , n e Y têm os significados indicados acima,
 25 com ésteres de ácido bórico da fórmula (X)
 $B(OR^{38})_3$ (X),
 na qual
 R^{38} representa C_1 - C_4 -alquila,

na presença de magnésio eventualmente na presença de um diluente (por exemplo, tetrahidrofurano).

Os ésteres de ácido bórico necessários como componentes de reação na execução do processo (g) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (X). Nesta fórmula, R^{38} representa de preferência, metila, etila, n- ou i-propila, particularmente de preferência, representa metila ou etila.

Os ésteres de ácido borônico da fórmula (X) são produtos químicos de síntese conhecidos.

Os derivados de carboxamida-ácido borônico necessários como componentes de reação na execução do processo (c) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (VI). Nesta fórmula, R^1 , m, R^3 e A têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais ou estes índices como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos. G^1 e G^2 representam de preferência, em cada caso hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno.

Os derivados de carboxamida-ácido borônico da fórmula (VI) são conhecidos e/ou podem ser preparados por processos conhecidos.

Os derivados de fenila necessários como substâncias de partida na execução dos processos (c), (d), (f) e (g) de acordo com a invenção, são definidos de modo geral pela fórmula (VII). Nesta fórmula, R^2 , n e Y têm preferentemente aqueles significados, que já foram mencionados no contexto com a descrição das substâncias da fórmula (I) de acordo com a invenção, para estes radicais ou estes índices como sendo preferidos, particularmente preferidos, muito particularmente preferidos ou especialmente preferidos.

Os derivados de fenila da fórmula (VII) são conhecidos ou podem ser preparados por processos em si conhecidos (compare Synth. Commun. 2000, 30, 665-669, Synth. Commun. 1999, 29, 1697-1701).

Como agentes ligadores de ácido na execução dos processos

(a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção, podem ser tomadas em consideração todas as bases inorgânicas e orgânicas usuais para tais reações. De preferência, são aplicáveis hidróxidos de metais alcalino ou alcalino-terrosos, tais como hidróxido de sódio, hidróxido de cálcio, hidróxido de potássio ou também hidróxido de amônio, carbonatos de metais alcalinos, tais como carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogenocarbonato de potássio, hidrogenocarbonato de sódio, acetatos de metais alcalinos ou alcalino-terrosos, tais como acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio, bem como aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diazabicycloundeceno (DBU). No entanto, também é possível trabalhar sem agente ligador de ácido adicional, ou empregar o componente amina em um excesso, de modo que ele atue simultaneamente como agente ligador de ácido.

Como diluentes na execução dos processos (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção, podem ser tomados em consideração todos os solventes orgânicos inertes, usuais. De preferência, são aplicáveis hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como por exemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalina; clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetraclorometano, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-t-butilico, éter metil-t-amílico, dióxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, n- ou i-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida de ácido hexametilfosfórico; ésteres tais como éster metílico de ácido acético ou éster etílico de ácido acético; sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido; sulfonas, como sulfolano.

As temperaturas de reação na execução dos processos (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção, podem variar em cada caso em uma faixa maior. Em geral, trabalha-se a temperaturas entre 0°C e 140°C, de preferência, entre 10°C e 120°C.

Ao efetuar os processos (a), (b), (c), (d), (e) e (f) de acordo com a invenção, pode, trabalhar-se em geral, em cada caso com pressão atmosférica. Mas também é possível, trabalhar em cada caso com alta ou baixa pressão.

5 Na execução do processo (a) de acordo com a invenção, aplicam-se para 1 mol de halogeneto de ácido da fórmula (II) em geral, 1 mol ou também um excesso de derivado de anilina da fórmula (III) bem como 1 até 3 moles de agente ligador de ácido. No entanto, também é possível, empregar os componentes de reação em outras razões. A elaboração é efetuada
10 por métodos usuais. Em geral, processa-se de maneira tal, que a mistura de reação é adicionada com água, a fase orgânica é separada e após a secagem se concentra com baixa pressão. O resíduo remanescente pode ser eventualmente liberado por métodos usuais, tal como cromatografia ou recristalização, de impurezas eventualmente ainda presentes.

15 Na execução do processo (b) de acordo com a invenção, aplica-se para 1 mol de carboxamida da fórmula (IV), em geral, 1 mol ou também um excesso de derivado de ácido borônico da fórmula (V), bem como 1 até 5 moles de agente ligador de ácido. No entanto, também é possível, aplicar os componentes da reação em outras razões. A elaboração é efetuada por
20 métodos usuais. Em geral, processa-se de maneira tal, que a mistura de reação é adicionada com água, o precipitado é separado e seco. O resíduo remanescente pode ser eventualmente liberado por métodos usuais, tais como cromatografia ou recristalização, de impurezas eventualmente ainda presentes.

25 Para a execução do processo (c) de acordo com a invenção, aplica-se para 1 mol de derivado de carboxamida-ácido borônico da fórmula (VI), em geral, 1 mol ou também um excesso de derivado de fenila da fórmula (VII) bem como 1 até 10 moles de agente ligador de ácido e 0,5 até 5 % em mol, de um catalisador. No entanto, também é possível, aplicar os
30 componentes da reação em outras razões. A elaboração é efetuada por métodos usuais. Em geral, processa-se de maneira tal, que se adiciona a mistura de reação com água, separa o precipitado e seca. O resíduo rema-

nescente pode ser eventualmente liberado por métodos usuais, tais como cromatografia ou recristalização, de impurezas eventualmente ainda presentes.

Para a execução do processo (d) de acordo com a invenção, aplica-se para 1 mol de derivado de carboxamida da fórmula (IV), em geral, 1 mol ou também um excesso de derivado de fenila da fórmula (VII) bem como 1 até 5 moles de agente ligador de ácido, bem como 1 até 5 moles de um catalisador. No entanto, também é possível aplicar os componentes da reação em outras razões. A elaboração é efetuada por métodos usuais. Em geral, processa-se de maneira tal, que se adiciona a mistura de reação com água, separa o precipitado e seca. O resíduo remanescente pode ser eventualmente liberado por métodos usuais, tais como cromatografia ou recristalização, de impurezas eventualmente ainda presentes.

As substâncias de acordo com a invenção, apresentam um forte efeito microbida e podem ser aplicadas para o combate de microorganismos indesejados, tais como fungos e bactérias, na proteção de plantas e na proteção de material.

Fungicidas podem ser empregados na proteção de plantas para combater Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes e Deuteromycetes.

Bactericidas podem ser empregados na proteção de plantas para combater Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae e Streptomycetaceae.

São exemplificados, mas não limitando, alguns causadores de doenças por fungos e bactérias, que recaem sob os conceitos listados acima:

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

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

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

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

- espécies *Phytophthora*, tal como por exemplo, *Phytophthora infestans*;
 espécies *Pseudoperonospora*, tal como por exemplo, *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*;
 espécies *Plasmopara*, tal como por exemplo, *Plasmopara viticola*;
 5 espécies *Bremia*, tal como por exemplo, *Bremia lactucae*;
 espécies *Peronospora*, tal como por exemplo, *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*;
 espécies *Erysiphe*, tal como por exemplo, *Erysiphe graminis*;
 espécies *Sphaerotheca*, tal como por exemplo, *Sphaerotheca fuliginea*;
 10 espécies *Podosphaera*, tal como por exemplo, *Podosphaera leucotricha*;
 espécies *Venturia*, tal como por exemplo, *Venturia inaequalis*;
 espécies *Pyrenophora*, tal como por exemplo, *Pyrenophora teres* ou *P. graminea*
 (forma de conídias: *Drechslera*, sinônimo: *Helminthosporium*);
 15 espécies *Cochliobolus*, tal como por exemplo, *Cochliobolus sativus*
 (forma de conídias: *Drechslera*, sinônimo: *Helminthosporium*);
 espécies *Uromyces*, tal como por exemplo, *Uromyces appendiculatus*;
 espécies *Puccinia*, tal como por exemplo, *Puccinia recondita*;
 espécies *Sclerotinia*, tal como por exemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*;
 20 espécies *Tilletia*, tal como por exemplo, *Tilletia caries*;
 espécies *Ustilago*, tal como por exemplo, *Ustilago nuda* ou *Ustilago avenae*;
 espécies de *Pellicularia*, tal como por exemplo, *Pellicularia sasakii*;
 espécies *Pyricularia*, tal como por exemplo, *Pyricularia oryzae*;
 espécies *Fusarium*, tal como por exemplo, *Fusarium culmorum*;
 25 espécies *Botrytis*, tal como por exemplo, *Botrytis cinerea*;
 espécies *Septoria*, tal como por exemplo, *Septoria nodorum*;
 espécies *Leptosphaeria*, tal como por exemplo, *Leptosphaeria nodorum*;
 espécies *Cercospora*, tal como por exemplo, *Cercospora canescens*;
 espécies *Alternaria*, tal como por exemplo, *Alternaria brassicae*;
 30 espécies *Pseudocercospora*, tal como por exemplo, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

As substâncias ativas de acordo com a invenção, também apre-

sentam um forte efeito fortificante nas plantas. Elas se prestam, por conseguinte, para a mobilização de forças de defesa próprias das plantas contra a infestação por microorganismos indesejados.

5 Por substâncias fortificantes vegetais (indutoras de resistência), compreendem-se no presente contexto aquelas substâncias, que estão em condição, de estimular o sistema de defesa das plantas de modo tal, que as plantas tratadas desenvolvem na inoculação posterior com microorganismos indesejados, ampla resistência contra estes microorganismos.

10 Por microorganismos indesejados compreendem-se no presente caso fungos fitopatogênicos, bactérias e vírus. As substâncias de acordo com a invenção podem ser aplicadas, portanto, para proteger plantas dentro de um determinado espaço de tempo após o tratamento, contra o ataque dos causadores de danos mencionados. O espaço de tempo, dentro do qual é realizada sua proteção, estende-se em geral de 1 até 10 dias, de preferência,
15 cia, de 1 até 7 dias após o tratamento das plantas com as substâncias ativas.

A boa compatibilidade vegetal das substâncias ativas nas concentrações necessárias para com o combate das doenças de plantas permite um tratamento das partes aéreas das plantas, do material da planta e
20 do material da semente e do solo.

As substâncias ativas de acordo com a invenção, também são adequadas para aumentar o rendimento da colheita. Além disso, elas são pouco tóxicas e apresentam uma boa compatibilidade com as plantas.

25 As substâncias ativas de acordo com a invenção, podem ser eventualmente empregadas em determinadas concentrações e quantidades de aplicação também como herbicidas, para influenciar o crescimento das plantas, bem como para combater pragas animais. Eventualmente, elas podem ser aplicadas também como produtos intermediários e pré-produtos para a síntese de outras substâncias ativas.

30 De acordo com a invenção, todas as plantas e partes das plantas podem ser tratadas. Por plantas compreendem-se com isso, todas as plantas e populações de plantas, como plantas selvagens ou plantas de cultura

desejadas e indesejadas (inclusive plantas de cultura de origem natural). Plantas de cultura podem ser plantas, que podem ser obtidas por métodos de cultivo e otimização convencionais ou por métodos biotecnológicos e tecnológicos genéticos ou por combinações destes métodos, inclusive as plantas transgênicas e inclusive as espécies de plantas protegíveis ou não-protegíveis por leis de proteção de espécie. Por partes de plantas devem ser compreendidas todas as partes e órgãos aéreos e subterrâneos das plantas, tais como rebentos, folha, flor e raiz, sendo enumerados por exemplo, folhas, espinhos, caules, troncos, flores, corpo do fruto, frutos e sementes, bem como raízes, tubérculos e rizomas. Nas partes das plantas incluem-se também material da colheita, bem como material de crescimento vegetativo e generativo, por exemplo, estacas, tubérculos, rizomas, tanchões e sementes.

O tratamento de acordo com a invenção, das plantas e partes das plantas com as substâncias ativas é efetuado diretamente ou pela ação sobre seu meio ambiente, espaço vital ou depósito pelos métodos de tratamento usuais, por exemplo, por imersão, pulverização, evaporação, nebulização, espalhamento, revestimento e no caso do material de crescimento, especialmente nas sementes, além disso, por revestimento de uma ou mais camadas.

Na proteção do material as substâncias de acordo com a invenção, podem ser empregadas para a proteção de materiais técnicos contra o ataque e destruição por microorganismos indesejados.

Por materiais técnicos compreendem-se no presente contexto materiais não vivos, que foram preparados para o emprego na técnica. Por exemplo, materiais técnicos, que devem ser protegidos pelas substâncias ativas de acordo com a invenção, contra a modificação ou destruição microbiana, podem ser adesivos, colas, papéis e papelões, têxteis, couro, madeira, produtos para pintura e artigos de materiais plásticos, lubrificantes refrigeradores e outros materiais, que podem ser atacados ou decompostos por microorganismos. No âmbito dos materiais a serem protegidos também são mencionadas peças de instalações de produção, por exemplo, circuitos de

água de refrigeração, que podem ser prejudicados pelo crescimento de microorganismos. No âmbito da presente invenção, mencionam-se como materiais técnicos de preferência, adesivos, colas, papéis e papelões, couro, madeira, produtos para pintura, lubrificantes refrigeradores e líquidos transmissores de calor, particularmente de preferência, madeira.

Como microorganismos, que podem provocar uma degradação ou uma modificação dos materiais técnicos, mencionam-se por exemplo, bactérias, fungos, leveduras, algas e mucos. De preferência, as substâncias ativas de acordo com a invenção, agem contra fungos, especialmente fungos do mofo, fungos descorantes de madeira e destruidores de madeira (Basidiomycetes) bem como contra mucos e algas.

São mencionados por exemplo, microorganismos dos seguintes gêneros:

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

Com base nas suas respectivas propriedades físicas e/ou químicas, as substâncias ativas podem ser transformadas nas formulações usuais, tal como soluções, emulsões, suspensões, pós, espumas, pastas, granulados, aerossóis, encapsulamentos finíssimos em substâncias polímeras e em massas de revestimento para material de semente, bem como formulações de nebulização fria e morna em volume ultrabaixo.

Estas formulações são preparadas de maneira conhecida, por exemplo, pela mistura das substâncias ativas com diluentes, isto é, solventes líquidos, gases liqüefeitos que se encontram sob pressão e/ou veículos sólidos, eventualmente com aplicação de substâncias tensoativas, isto é, emulsificantes e/ou agentes de dispersão e/ou agentes produtores de espuma. No caso da utilização de água como diluente também podem ser empregados, por exemplo, solventes orgânicos como solventes auxiliares. Como solventes líquidos podem ser tomados em consideração essencialmente: compostos aromáticos, tais como xileno, tolueno ou alquilnaftalenos, compostos aromáticos clorados ou hidrocarbonetos alifáticos clorados, tais como clorobenzenos, cloroetilenos ou cloreto de metileno, hidrocarbonetos alifáticos, tais como ciclohexano ou parafinas, por exemplo, frações de petróleo, álcoois, como butanol ou glicol, bem como seus éteres e ésteres, cetonas, como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona ou ciclohexanona, solventes fortemente polares, tais como dimetilformamida e dimetilsulfóxido, bem como água. Compreendem-se por líquidos com diluentes ou veículos gasosos liqüefeitos aqueles, que são gasosos à temperatura normal e sob pressão normal, por exemplo, gases propulsores em aerossol, tais como hidrocarbonetos halogenados, bem como butano, propano, nitrogênio e dióxido de carbono. Como veículos sólidos podem ser tomados em consideração: por exemplo, pós de pedras naturais, tal como caulinas, aluminas, talco, giz, quartzo, atapulgita, montmorilonita ou terra de infusórios e pós de pedras sintéticos, tais como ácido silícico altamente disperso, óxido de alumínio e silicatos. Como veículos sólidos para granulados podem ser tomados em consideração: por exemplo, pedras naturais quebradas e fracionadas tais como calcita, pedra-pomes, mármore, sepiolita, dolomita bem como granulados sintéticos de farinhas inorgânicas e orgânicas bem como granulados de material orgânico tais como serragem, cascas de coco, espigas de milho e caules de tabaco. Como emulsificantes e/ou agentes produtores de espuma podem ser tomados em consideração: por exemplo, emulsificantes não-ionogêneos e aniônicos, tais como éster de ácido polioxietileno-graxo, éter de álcool polioxietileno-graxo, por exemplo, éter alquilaryl-poliglicólico, sulfo-

atos de alquila, sulfatos de alquila, sulfonatos de arila bem como hidrolisados de albumina. Como agentes de dispersão podem ser tomados em consideração: por exemplo, lixívias residuais de lignina e metilcelulose.

5 Nas formulações podem ser utilizados adesivos tais como carboximetilcelulose, polímeros naturais e sintéticos, pulverizados, granulados ou na forma de látex, tais como goma arábica, álcool polivinílico, acetato de polivinila, bem como fosfolipídios naturais tais como cefalinas e lecitinas e fosfolipídios sintéticos. Outros aditivos podem ser óleos minerais e vegetais.

10 Podem ser empregados corantes tais como pigmentos inorgânicos, por exemplo, óxido de ferro, óxido de titânio, azul de ferrociano e corantes orgânicos, tais como corantes de alizarina, azocorantes e corantes de ftalocianina de metais e traços de substâncias nutritivas, tais como sais de ferro, de manganês, boro, cobre, cobalto, molibdênio e zinco.

15 As formulações contêm, em geral, entre 0,1 e 95 %, em peso, de substâncias ativas, de preferência, entre 0,5 e 90 %.

As substâncias ativas de acordo com a invenção, podem ser aplicadas como tais ou nas suas formulações também em mistura com fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematicidas ou inseticidas conhecidos, para assim, por exemplo, ampliar o espectro de ação ou prevenir desenvolvimentos de resistência. Em muitos casos obtêm-se com isso, efeitos sinérgicos, isto é, a eficácia da mistura é maior do que a eficácia dos componentes individuais.

Como participantes da mistura podem ser tomados em consideração, por exemplo, os seguintes compostos:

25 **Fungicidas:**

2-fenilfenol; 8-hidroxiquinolinossulfato; acibenzolar-s-metila; aldimorf; amido-flumet; ampropilfos; ampropilfos-potássio; andoprim; anilazina; azaconazol; azoxistrobin;

benalaxila; benodanila; benomila; bentiavalicarb-isopropila; benzamacrila;

30 benzamacril-isobutila; bilanafos; binapacrila; bifenila; bitertanol; blasticidin-S; bromuconazol; bupirimate; butiobate; butilamina;

polissulfeto de cálcio; capsimicina; captafol; captan; carbendazim; carboxina;

- carpropamida; carvone; quinometionato; clobentiazona; clorfenazol; cloroneb; clorotalonila; clozolinato; clozilacon; ciazofamid; ciflufenamid; cimoxanila; ciproconazol; ciprodinila; ciprofuram;
- dagger G; debacarb; diclofluanid; diclone; diclorofen; diclocimet; diclomezina;
- 5 dicloran; dietofencarb; difenoconazol; diflumetorim; dimetirimol; dimetomorf; dimoxistrobin; diniconazol; diniconazol-M; dinocap; difenilamina; dipiritiona; ditalimfos; ditianon; dodina; drazoxolon;
- edifenfos; epoxiconazol; etaboxam; etirimol; etridiazol;
- famoxadona; fenamidona; fenapanila; fenarimol; fenbuconazol; fenfuram;
- 10 fenexamida; fenitropan; fenoxanila; fempiclonila; fenpropidin; fenpropimorf; ferbam; fluazinam; flubenzimine; fludioxonila; flumetover; flumorf; fluoromida; fluoxastrobin; fluquinconazol; flurprimidol; flusilazol; flusulfamida; flutolanila; flutriafol; folpet; fosetil-Al; fosetil-sódio; fluberidazol; furalaxila; furametpir; furcarbanila; furmeciclox;
- 15 guazatina; hexaclorobenzeno; hexaconazol; himexazol;
- imazalila; imibenconazol; triacetato de iminoctadina; iminoctadina tris(albesil); iodocarb; ipconazol; iprobenfos; iprodiona; iprovalicarb; irumamicina; isoprotiolana; isovalediona;
- kasugamicina; cresoxim-metila;
- 20 mancozeb; maneb; meferimzona; mepanipirim; mepronila; metalaxila; metalaxil-M; metconazol; metassulfocarb; metfuroxam; metiram; metominostrobin; metsulfovax; mildiomicin; miclobutanila; miclozolina;
- natamicina; nicobifen; nitrotal-isopropila; noviflumuron; nuarimol;
- ofurace; orisastrobin; oxadixila; ácido oxolínico; oxpoconazol; oxicarboxina;
- 25 oxifentiína;
- paclobutrazol; pefurazoato; penconazol; pencicuron; fosdifen; ftalida; picoxistrobina; piperalina; polioxins; polioxorim; probenazol; procloraz; procimidona; propamocarb; propanosina-sódio; propiconazol; propineb; proquinazid; protioconazol; piraclostrobin; pirazofos; pirifenox; pirimetanila; piroquilon;
- 30 piroxifur; pirrolnitrina;
- quinconazol; quinoxifen; quintozena; simeconazol; spiroxamina; enxofre;
- tebuconazol; tecloftalam; tecnazeno; tetciclacis; tetraconazol; tiabendazol;

- ticiofen; tifulzamida; tiofanato-metila; tiram; tioximida; tolclofos-metila; to-
lilfluanida; triadimefon; triadimenol; triazbutila; triazóxido; triciclamida; tricicla-
zol; tridemorf; trifloxistrobin; triflumizol; triforina; triticonazol;
uniconazol; validamicina A; vinclozolin; zineb; ziram; zoxamida;
- 5 (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorfenil)-2-propinil]óxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-
[(metilsulfonil)amino]-butanamida;
1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona;
2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina;
2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida;
- 10 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-piridinocarboxamida;
3,4,5-tricloro-2,6-piridinodicarbonitrila;
actinovato; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol;
1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metila;
carbonato monopotássico; N-(6-metóxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida;
- 15 N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4,5]decan-3-amina;
tetratiocarbonato de sódio;
bem como sais e preparações de cobre, tais como mistura de Bordeaux; hi-
dróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclureto de cobre; sulfato de cobre;
cufraneb; óxido de cobre; mancopper; oxina-cobre.
- 20 **Bactericidas:**
bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel; kasugami-
cina, octilnon, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estrepto-
micina, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.
- Inseticidas/acaricidas/nematicidas:**
- 25 abamectina, ABG-9008, acefata, acequinocila, acetamiprida, acetoprol, acri-
natrina, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb,
aletrin, isômero 1R de aletrin, alfa-cipermetrin (alfametrin), amidoflomet,
aminocarb, amitraz, avermectina, AZ-60541, azadiractin, azametifos, azin-
fos-metila, azinfos-etila, azociclotin,
- 30 *Bacillus popilliae*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*,
Bacillus thuringiensis cepa EG-2348, *Bacillus thuringiensis* cepa GC-91, *Ba-*
cillus thuringiensis cepa NCTC-11821, baculovírus, *Beauveria bassiana*, *Be-*

auveria tenella, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, benzoximato, beta-
 ciflutrin, beta-cipermetrin, bifenazato, bifentrin, binapacrila, bioalletrin, isôme-
 ro de bioalletrin-S-ciclopentila, bioetanometrin, biopermetrin, bioresmetrin,
 bistrifluron, BPMC, brofenprox, bromofos-etila, bromopropilato, bromofen-
 5 vinfos (-metila), BTG-504, BTG-505, bufencarb, buprofezin, butatiofos, buto-
 carboxim, butoxicarboxim, butilpiridaben,
 cadusafos, camfeclor, carbarila, carbofuran, carbofenotion, carbosulfan,
 cartap, CGA-50439, quinometioato, clordano, clordimefom, cloetocarb, clo-
 retoxifos, clorfenapir, clorfenvinfos, clorfluazuron, clormefos, clorobenzilato,
 10 cloropicrin, clorproxifen, clorpirifos-metila, clorpirifos (-etila), clovaporkin,
 cromafenozida, cis-cipermetrin, cis-resmetrin, cis-permetrin, clocitrin, cloeto-
 carb, clofentezina, clotianidin, clotiazoben, codlemona, coumafos, cianofen-
 fos, cianofos, cicloprena, cicloprotrin, Cydia pomonella, ciflutrin, cihalotrin,
 cihexatin, cipermetrin, cifenotrin (isômero trans-1R), ciromazina,
 15 DDT, deltametrin, demeton-S-metila, demeton-S-metilsulfona, diafentiuron,
 dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos, dicofol, dicrotofos, diciclanil, diflu-
 benzuron, dimetoato, dimetilvinfos, dinobuton, dinocap, dinotefuran, diofe-
 nolan, disulfoton, docusat-sódio, dofenapin, DOWCO-439,
 eflusilanato, emamectin, emamectin-benzoato, empentrin (isômero 1R), en-
 20 dosulfan, Entomophthora spp., EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etiprol, etion,
 etoprofos, etofenprox, etoxazol, etrimfos,
 famfur, fenamifos, fenazaquin, óxido de fenbutatina, fenflutrin, fenitrothion,
 fenobucarb, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpropatrin, fenpirad, fenpi-
 ritrin, fenpiroximato, fensulfotion, fention, fentripanil, fenvalerato, fipronil, floni-
 25 camid, fluacripirim, fluazuron, flubenzimina, flubrocitrinato, flucicloxuron, flu-
 citrinato, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox, flumetrin, flupirazofos, flutenzin
 (flufenzina), fluvalinato, fonofos, formetanato, formotion, fosmetilan, fostia-
 zato, fubfenprox (fluproxifen), furatiocarb,
 gamma-HCH, gossypure, grandlure, granulosevírus,
 30 halfenprox, halofenozida, HCH, HCN-801, heptenofos, hexaflumuron, hexiti-
 azox, hidrametilnona, hidropreno,
 IKA-2002, imidacloprid, imiprotrin, indoxacarb, iodofenfos, iprobenfos, isa-

zofos, isofenfos, isoprocarb, isoxation, ivermectin,
 japonilure, kadetrin, vírus polieder nucleares, kinopreno,
 lambda-cihalotrin, lindane, lufenuron,
 malation, mecarbam, mesulfenfos, metaldeído, metam-sódio, metacrifos,
 5 metamidofos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, metidation,
 metiocarb, metomila, metopreno, metoxiclor, metoxifenoazida, metolcarb,
 metoxadiazona, mevinfos, milbemectin, milbemycin, MKI-245, MON-45700,
 monocrotofos, moxidectin, MTI-800,
 naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, niclosamida, nicotina,
 10 nitenpiram, nitiazina, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, novaluron,
 noviflumuron,
 OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, ometoata,
 oxamila, oxidemeton-metila,
 Paecilomyces fumosoroseus, paration-metila, paration (-etila), permetrin (cis-
 15 , trans-), petróleo, PH-6045, fenotrin (isômero 1R-trans), fentoato, forato, fo-
 salona, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, butóxido de piperonila, pirimi-
 carb, pirimifos-metila, pirimifos-etila, praletrin, profenofos, promecarb, pro-
 pafos, propargita, propetamfos, propoxur, protiofos, protoato, protrifenbute,
 pimetozine, piraclofos, piresmetrin, piretrum, piridaben, piridalila, piridafenti-
 20 on, piridation, pirimidifen, piriproxifen,
 quinalfos, resmetrin, RH-5849, ribavirin, RU-12457, RU-15525,
 S-421, S-1833, salition, sebufos, SI-0009, silafluofen, spinosad, spirodiclo-
 fen, spiromesifen, sulfluramid, sulfotep, sulprofos, SZI-121,
 tau-fluvalinato, tebufenozida, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzuron, te-
 25 flutrin, temefos, temivinfos, terbam, terbufos, tetraclorvinfos, tetradifon, te-
 trametrin, tetrametrin (isômero 1R), tetrasul, teta-cipermetrin, tiaclopid, tia-
 metoxam, tiapronil, tiatrifos, hidrogeno-oxalato de tiociclam, tiodicarb, tiofa-
 nox, tiometon, tiosultap-sódio, turingiensin, tolfenpirad, tralocitrin, tralometrin,
 transflutrin, triarateno, triazamato, triazofos, triazuron, triclofenidina, triclor-
 30 fon, triflumuron, trimetacarb,
 vamidotin, vaniliprol, verbutin, Verticillium lecanii,
 WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, xililcarb,

ZA-3274, zeta-cipermetrin, zolaprofos, ZXI-8901,
o composto 3-metil-fenil-propilcarbamato (Tsumacide Z),
o composto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3,2,1]-octan-3-
carbonitrila (CAS-Reg. nº 185982-80-3) e o isômero 3-endo correspondente
5 (CAS-Reg. nº 185984-60-5) (compare WO-96/37494, WO-98/25923),
bem como preparações, os quais contêm extratos de plantas, nematódios,
fungos ou vírus com eficácia inseticida.

Também é possível uma mistura com outras substâncias ativas
conhecidas, tais como herbicidas ou com adubos e reguladores do cresci-
10 mento, protetores ou "Semiochemicals".

Além disso, os compostos da fórmula (I) de acordo com a inven-
ção, também apresentam efeitos antimicóticos muito bons. Eles possuem
um espectro de ação antimicótico muito amplo, especialmente contra der-
matófitos e leveduras, mofo e fungos difásicos (por exemplo, contra espécies
15 de *Candida* tal como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) bem como *Epi-*
dermophyton floccosum, espécies de *Aspergillus* tais como *Aspergillus niger*
e *Aspergillus fumigatus*, espécies de *Trichophyton* tal como *Trichophyton*
mentagrophytes, espécies de *Microsporon* como *Microsporon canis* e *au-*
douinii. A enumeração desses fungos não representa de modo algum uma
20 limitação do espectro micótico abrangível, mas tem somente caráter eluci-
datório.

As substâncias ativas podem ser aplicadas como tais, na forma
de suas formulações ou nas formas de aplicação preparadas a partir das
mesmas, tais como soluções, suspensões, pós para pulverização, pastas,
25 pós solúveis, pós para polvilhamento e granulados prontos para o uso. A
aplicação ocorre de maneira usual, por exemplo, mediante regra, borrifação,
aspersão, espalhamento, polvilhamento, espumação, revestimento e outros.
Além disso, é possível, aplicar as substâncias ativas pelo processo de volu-
me ultrabaixo ou injetar a preparação da substância ativa ou a própria subs-
30 tância ativa no solo. O material da semente das plantas também pode ser
tratado.

Ao aplicar as substâncias ativas de acordo com a invenção

como fungicidas, as quantidades de aplicação podem variar conforme o tipo de aplicação, dentro de um limite maior. No tratamento de partes das plantas as quantidades de aplicação de substância ativa encontram-se em geral, entre 0,1 e 10.000 g/ha, de preferência, entre 10 e 1.000 g/ha. No tratamento do material da semente, as quantidades de aplicação de substância ativa encontram-se em geral, entre 0,001 e 50 g por quilograma de material de semente, de preferência, entre 0,01 e 10 g por quilograma de material de semente. No tratamento do solo, as quantidades de aplicação de substância ativa encontram-se em geral, entre 0,1 e 10.000 g/ha, de preferência, entre 1 e 5.000 g/ha.

Tal como já foi citado acima, de acordo com a invenção todas as plantas e suas partes podem ser tratadas. Em uma forma de execução preferida, são tratados tipos de plantas e espécies de plantas de origem selvagem ou as obtidas mediante métodos de cultivo biológicos convencionais, tal como cruzamento ou fusão de protoplastos, bem como suas partes. Em uma outra forma de execução preferida, tratam-se plantas e espécies de plantas transgênicas, que foram obtidas através de métodos tecnológicos genéticos, eventualmente em combinação com métodos convencionais (Genetic Modified Organisms) e suas partes. O termo "partes" ou "partes de plantas" ou "partes das plantas" já foi esclarecido acima.

De modo particularmente preferido tratam-se conforme a invenção, plantas das espécies de plantas em cada caso usuais comercialmente ou que se encontram em uso. Por espécies de plantas compreendem-se plantas com novas propriedades ("Traits"), que foram cultivadas tanto por cultivo convencional, por mutagênese ou por técnicas de DNA recombinantes. Estas podem ser espécies, raças, biótipos e genótipos.

Dependendo dos tipos de plantas ou das espécies de plantas, seu local e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, nutrição) também podem aparecer efeitos superaditivos ("sinérgicos") através do tratamento de acordo com a invenção. Assim, por exemplo, são possíveis pequenas quantidades de aplicação e/ou aumentos do espectro de ação e/ou um reforço do efeito das substâncias e composições aplicáveis de

acordo com a invenção, melhor crescimento das plantas, maior tolerância frente às altas ou baixas temperaturas, maior tolerância contra seca ou contra teor de sal na água ou no solo, maior poder de florescência, colheita facilitada, aceleração do amadurecimento, maior rendimento da colheita, maior
5 qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior capacidade de armazenagem e/ou capacidade de beneficiamento dos produtos colhidos, que ultrapassam os efeitos a serem propriamente esperados.

Nas plantas ou espécies de plantas transgênicas (obtidas geneticamente) preferidas, a serem tratadas conforme a invenção, incluem-se
10 todas as plantas, que através da modificação tecnológica genética receberam material genético, o qual empresta a essas plantas propriedades valiosas particularmente vantajosas ("Traits"). Exemplos de tais propriedades são melhor crescimento da planta, maior tolerância frente às altas ou baixas temperaturas, maior tolerância contra seca ou contra teor de sal na água ou
15 no solo, maior poder de florescência, colheita facilitada, aceleração do amadurecimento, maior rendimento da colheita, maior qualidade e/ou maior valor nutritivo dos produtos colhidos, maior capacidade de armazenagem e/ou capacidade de beneficiamento dos produtos colhidos. Outros exemplos e particularmente destacados para tais propriedades são uma maior defesa
20 das plantas contra pragas animais e microbianas, tais como com relação aos insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactérias e/ou vírus, bem como uma maior tolerância das plantas contra determinadas substâncias ativas herbicidas. Como exemplos de plantas transgênicas citam-se as plantas de cultura importantes, tais como cereais (trigo, arroz), milho, soja, batatas, algodão,
25 tabaco, colza, bem como plantas frutíferas (como os frutos maçã, pêras, frutas cítricas e uvas), sendo que milho, soja, batatas, algodão, tabaco e colza são particularmente destacados. Como propriedades ("Traits") destacam-se particularmente a maior defesa das plantas contra insetos através das toxinas formadas nas plantas, especialmente aquelas, que são produzidas nas plantas pelo material genético de *Bacillus Thuringiensis* (por exemplo, pelos genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb e CryIF bem como suas combinações) nas plantas
30

(a seguir "plantas Bt"). Como propriedades ("Traits") destacam-se também particularmente a alta defesa das plantas contra fungos, bactérias e vírus através da resistência adquirida sistêmica (SAR), sistemina, fitoalexinas, elicitores bem como genes resistentes e proteínas e toxinas exprimidas correspondentemente. Como propriedades ("Traits") destacam-se além disso, particularmente a alta tolerância das plantas comparadas com determinadas substâncias ativas herbicidas, por exemplo, imidazolinonas, sulfoniluréias, glifosate ou fosfinotricina (por exemplo, gene "PAT"). Os genes que emprestam em cada caso as propriedades desejadas ("Traits") também podem aparecer em combinações entre si nas plantas transgênicas. Como exemplos de "plantas Bt" mencionam-se espécies de milho, espécies de algodão, espécies de soja e espécies de batata, que são divulgadas sob as denominações comerciais YIELD GARD® (por exemplo, milho, algodão, soja), KnockOut® (por exemplo, milho), StarLink® (por exemplo, milho), Bollgard® (algodão), Nucoton® (algodão) e NewLeaf® (batata). Como exemplos de plantas tolerantes aos herbicidas mencionam-se espécies de milho, espécies de algodão e espécies de soja, que são divulgadas sob as denominações comerciais Roundup Ready® (tolerância contra glifosate, por exemplo, milho, algodão, soja), Liberty Link® (tolerância contra fosfinotricina, por exemplo, colza), IMI® (tolerância contra imidazolinonas) e STS® (tolerância contra sulfoniluréias, por exemplo, milho). Como plantas resistentes aos herbicidas (cultivadas convencionalmente para tolerância aos herbicidas) também são citadas as espécies divulgadas sob a denominação Clearfield® (por exemplo, milho). Naturalmente, estas informações valem também para as espécies de plantas a serem desenvolvidas no futuro ou que chegarão futuramente no mercado com estas propriedades genéticas ou a serem futuramente desenvolvidas ("Traits").

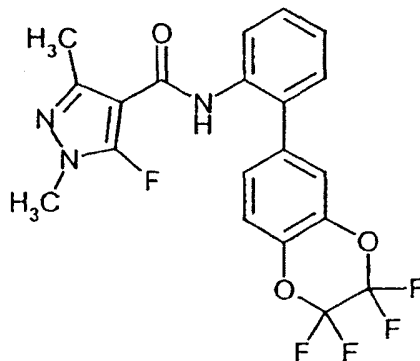
As plantas citadas podem ser tratadas de modo particularmente vantajoso conforme a invenção, com os compostos da fórmula geral (I) ou com as misturas das substâncias ativas de acordo com a invenção. Os limites preferidos indicados acima nas substâncias ativas ou nas misturas valem também para o tratamento dessas plantas. Deve ser particularmente desta-

cado o tratamento das plantas com os compostos ou misturas especialmente citados no presente texto.

A preparação e a aplicação das substâncias ativas de acordo com a invenção, é verificada nos exemplos abaixo.

5 **Exemplos de preparação**

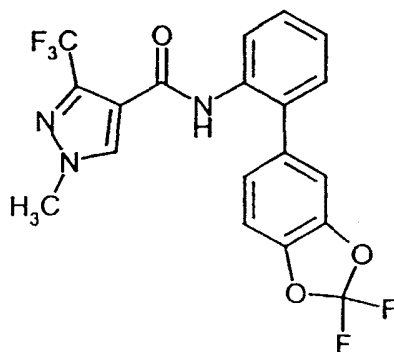
Exemplo 1



A uma solução de 3,12 g de N-(2-bromofenil)-5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida e 3,28 g de ácido 2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il-borônico (V-1) em 10 ml de n-butanol, acrescentam-se 9,77 g de carbonato de cézio e 2 ml de água. Com agitação e atmosfera de argônio acrescentam-se 60 mg de tetraquis(trifenilfosfin)paládio (0). A mistura de reação é agitada a 80°C durante 8 horas. Para a elaboração, a mistura é colocada sobre água, extraída com acetato de etila, seca e concentrada. O resíduo é cromatografado em sílica-gel (ciclohexano/acetato de etila 2:1).

Obtêm-se 4,00 g (83 % da teoria) de 5-flúor-1,3-dimetil-N-[2-(2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida na forma de um sólido incolor [logP (pH 2,3) = 3,77].

Exemplo 2

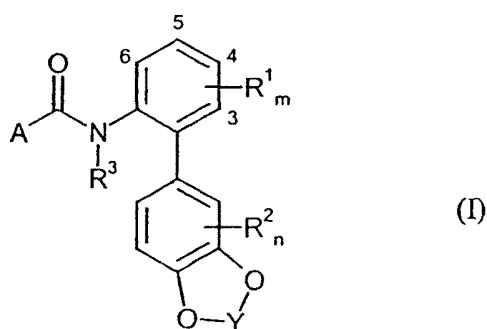


0,37 g (1,6 mmol) de 5-bromo-2,2-difluor-1,3-benzodioxol, 0,4 g (1,6 mmol) de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano e 0,42 g (4,3 mmoles) de acetato de potássio são suspensos com argônio em 5 ml de dimetilsulfóxido e adicionados com 0,05 g (0,07 mmol) de cloreto de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocenopaládio(II). Depois de 2 horas a 80°C resfria-se à temperatura ambiente e acrescentam-se 0,51 g (1,3 mmol) de N-(2-iodofenil)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida (IV-1), 3,25 ml de uma solução de carbonato de sódio 2M e mais 0,05 g (0,07 mmol) de cloreto de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocenopaládio(II). Depois de 45 minutos a 70°C dilui-se com 5 ml de água e extrai-se 3 vezes com 50 ml cada de acetato de etila. Os extratos são secos sobre sulfato de sódio, filtrados e concentrados no vácuo. O produto bruto é retomado em éter dietílico e cromatografado em sílica-gel (ciclohexano/acetato de etila 3:1).

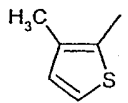
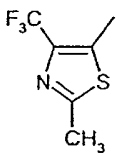
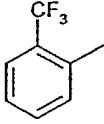
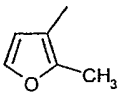
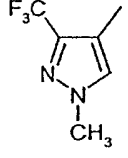
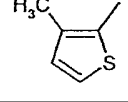
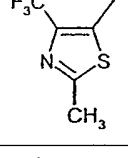
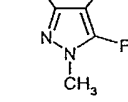
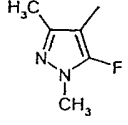
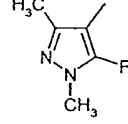
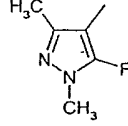
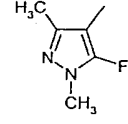
Obtém-se 0,23 g (41 % da teoria) de N-[2-(2,2-difluor-1,3-benzodioxol-5-il)-fenil]-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida [logP (pH 2,3) = 3,37].

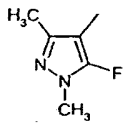
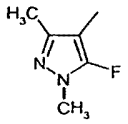
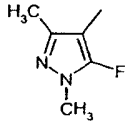
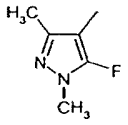
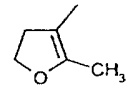
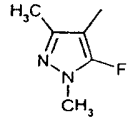
Analogamente aos exemplos 1 e 2 descritos acima, bem como correspondentemente às descrições dos processos gerais, também são preparadas as bifenilcarboxamidas da fórmula (I) enumeradas na tabela 1 abaixo.

Tabela 1



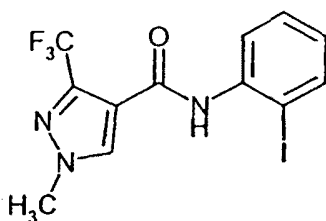
Ex.	R ¹ _m	R ² _n	R ³	Y	A	logP (pH2,3)
3	H	H	H	-CF ₂ -		3,94

4	H	H	H	-CF ₂ -		3,99
5	H	H	H	-CF ₂ -		3,81
6	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		5,93
7	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		4,08
8	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		3,85
9	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		4,46
10	H	H	H	-(CF ₂) ₂ -		3,94
11	4,5-F ₂	H	H	-CH ₂ -		3,24
12	4-Cl	H	H	-CH ₂ -		3,32
13	4-CH ₃ , 5-F	H	H	-CH ₂ -		3,37
14	5-CH ₃	H	H	-CH ₂ -		3,01
15	4,6-F ₂	H	H	-CH ₂ -		2,34

16	4-CH ₃	H	H	-CH ₂ -		3,10
17	4-F, 6-Cl	H	H	-CH ₂ -		2,53
18	4-Cl, 6-F	H	H	-CH ₂ -		2,74
19	H	H	H	-CF ₂ -		3,22
20	H	H	H	-CH ₂ -		2,87
21	H	H	Me	-(CF ₂) ₂ -		3,44

Preparação de substâncias de partida da fórmula (IV)

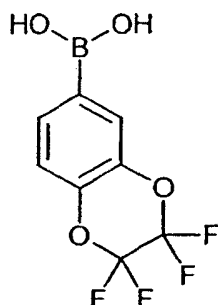
Exemplo (IV-1)



6,57 g (30,0 mmoles) de 2-iodanilina e 6,1 g (60,0 mmoles) de trietilamina são dissolvidos em 100 ml de tetrahidrofurano e à temperatura ambiente vagarosamente adicionados com 7,65 g (36,0 mmoles) de cloreto de 1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carbonila. A solução de reação é aquecida durante 16 horas a 50°C. Para a elaboração, concentra-se no vácuo e cromatografa-se o produto bruto em sílica-gel (ciclohexano/acetato de etila 1:1).

Obtêm-se 10,0 g (85 % da teoria) de N-(2-iodofenil)-1-metil-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida [$\log P$ (pH 2,3) = 2,46].

Preparação de substâncias de partida da fórmula (V)

Exemplo (V-1)

Em uma suspensão de 4,86 g de aparas de magnésio em 20 ml de tetrahidrofurano (anidro) colocam-se alguns grânulos de iodo e em seguida, gotejam-se 57,4 g de 6-bromo-2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodioxina em 60 ml de tetrahidrofurano com atmosfera de argônio. A reação exotérmica é mantida próxima do ponto de ebulição através da velocidade do gotejamento. Depois do gotejamento é agitado durante 30 minutos com refluxo e depois é resfriado à temperatura ambiente. A solução do reagente de Grignard é gotejada junto com uma solução de 29,2 g de éster trietílico de ácido bórico em 60 ml de tetrahidrofurano a 100 ml de tetrahidrofurano a -10°C dentro de 30 minutos. Em seguida, ainda é pós-agitado durante uma hora a -10°C, depois aquecido à temperatura ambiente e agitado durante mais 30 minutos. Para a elaboração, a solução de reação é hidrolisada a -10°C com 14 ml de água e ajustada com 80 ml de ácido sulfúrico a 10 % para pH 4. A mistura é extraída com éter dietílico, a fase aquosa é saturada com cloreto de sódio e extraída com éter dietílico. As fases do éter unidas são concentradas junto com 200 ml de água. O resíduo sólido é misturado em pouco cloreto de metileno, aspirado e seco.

Obtêm-se 47,3 g (75 % da teoria) de ácido 2,2,3,3-tetraflúor-2,3-dihidro-1,4-benzodioxin-6-il-borônico [$\log P$ (pH 2,3) = 2,49].

A determinação dos valores $\log P$ indicados nos exemplos de preparação acima, foi efetuada de acordo com a diretriz EEC 79/831 Annex V.A8 mediante HPLC (High Performance Liquid Chromatography) em uma coluna de inversão de fase (C 18). Temperatura: 43°C.

Eluentes para a determinação na faixa de acidez: 0,1 % de ácido fosfórico, acetonitrila: gradiente linear de 10 % de acetonitrila até 90 % de

acetonitrila.

A calibração foi efetuada com alcan-2-onas não ramificadas (com 3 até 16 átomos de carbono), cujos valores logP são conhecidos (determinação dos valores logP com base nos tempos de retenção mediante
5 interpolação linear entre duas alcanonas sucessivas).

Os valores lambda-max foram determinados com base nos espectros ultravioleta de 200 mn até 400 mn nos máximos dos sinais cromatográficos.

Exemplos de aplicação

10 **Exemplo A**

Teste com Podosphaera (maçã)/protetor

Solvente: 24,5 partes em peso, de acetona

24,5 partes em peso, de dimetilacetamida

Emulsificante: 1,0 parte em peso, de éter alquil-aril-poliglicólico

15 Para a produção de um preparado de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

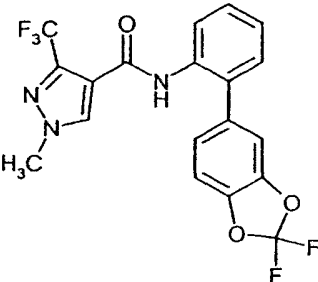
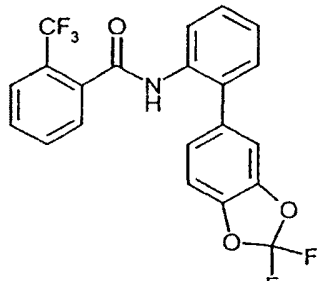
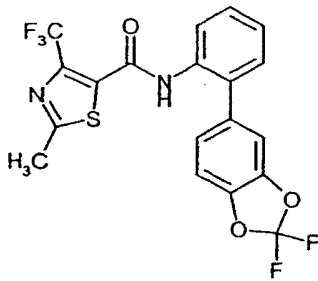
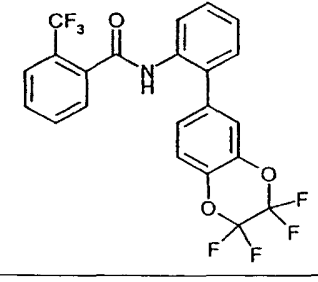
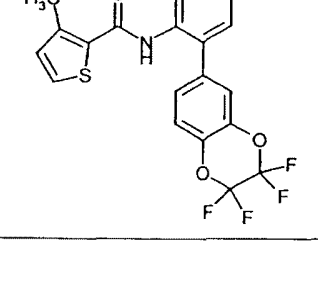
Para testar a eficácia protetora, pulverizam-se plantas novas
20 com o preparado da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são inoculadas com uma suspensão de esporos aquosa do causador do oídio da maçã Podosphaera leucotricha. As plantas são colocadas depois, na estufa a aproximadamente 23°C e uma umidade relativa do ar de aproximada-
25 mente 70 %.

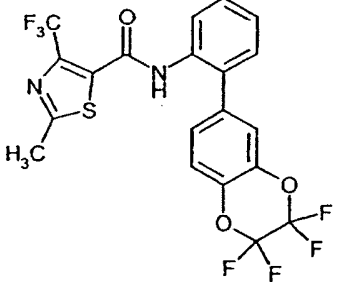
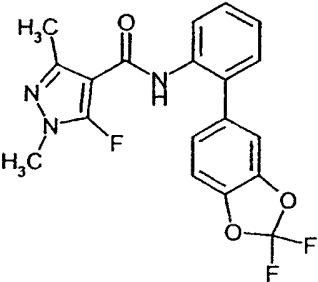
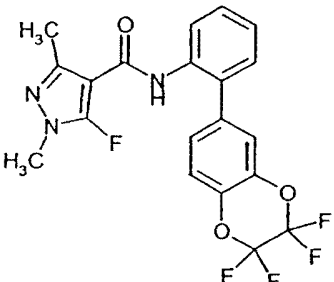
10 dias após a inoculação, efetua-se a avaliação. Com isso, 0 % significa um grau de efeito, que corresponde àquele do controle, enquanto que um grau de efeito de 100 % significa, que não é observada nenhuma infestação.

30 Substâncias ativas, quantidades de aplicação e resultados do ensaio são verificados na tabela abaixo.

Tabela A

Teste com *Podosphaera* (maçã) / protetor

	Substância ativa	Quantidade de aplicação da substância ativa em g/ha	Grau de efeito em %
2		100	100
3		100	100
5		100	100
6		100	100
9		100	100

10		100	100
19		100	100
1		100	100

Exemplo B**Teste com *Sphaerotheca* (pepino) / protetor**

Solvente: 24,5 partes em peso, de acetona

24,5 partes em peso, de dimetilacetamida

- 5 Emulsificante: 1,0 parte em peso, de éter alquil-aril-poliglicólico

Para a produção de um preparado de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

- 10 Para testar a eficácia protetora, pulverizam-se plantas novas com o preparado da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são inoculadas com uma suspensão de esporos aquosa de *Sphaerotheca fuliginea*. As plantas são colocadas, depois, a aproximadamente 23°C e uma umidade relativa do

ar de aproximadamente 70 % na estufa.

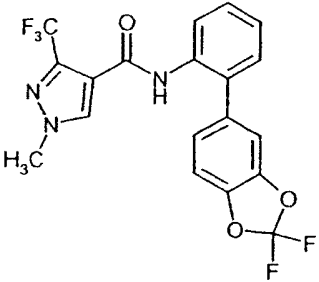
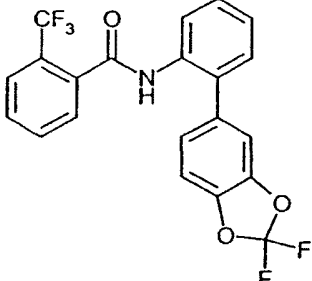
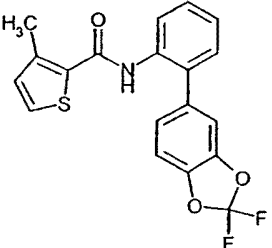
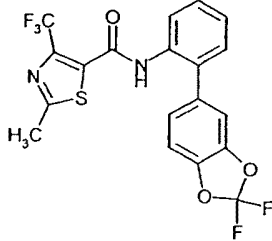
7 dias após a inoculação efetua-se a avaliação. Com isso, 0 % significa um grau de efeito, que corresponde àquele do controle, enquanto que um grau de efeito de 100 % significa, que não é observada nenhuma infestação.

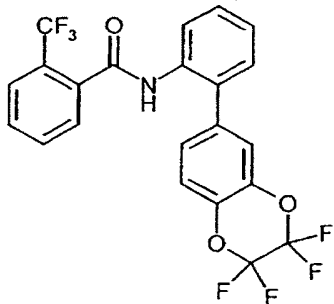
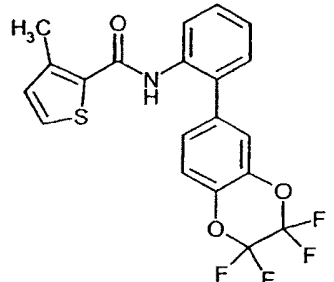
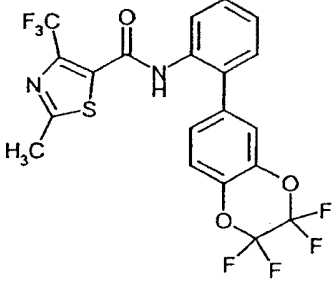
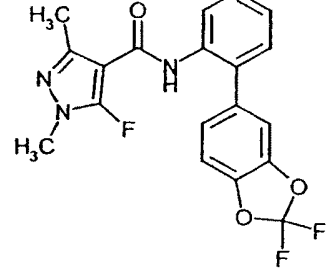
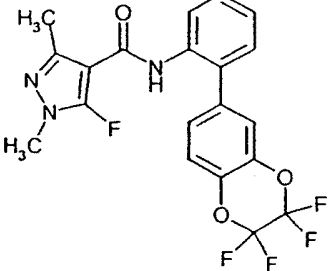
5

Substâncias ativas, quantidades de aplicação e resultados do ensaio são verificados na tabela abaixo.

Tabela B

Teste com *Sphaerotheca* (pepino) / protetor

	Substância ativa	Quantidade de aplicação da substância ativa em g/ha	Grau de efeito em %
2		100	100
3		100	98
4		100	100
5		100	100

6		100	100
9		100	100
10		100	100
19		100	92
1		100	98

Exemplo C**Teste com Venturia (maçã) / protetor**

Solvente: 24,5 partes em peso, de acetona

24,5 partes em peso, de dimetilacetamida

Emulsificante: 1,0 parte em peso, de éter alquil-aril-poliglicólico

Para a produção de um preparado de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

Para testar a eficácia protetora, pulverizam-se plantas novas com o preparado da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada pulverizada, as plantas são inoculadas com uma suspensão de conídias aquosa do causador da escara da maçã *Venturia inaequalis* e permanecem depois, durante um dia a aproximadamente 20°C e 100 % de umidade relativa do ar em uma cabina de incubação.

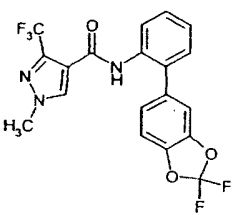
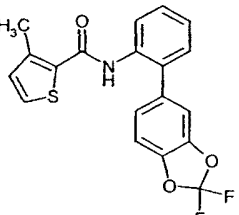
As plantas são colocadas depois, na estufa a aproximadamente 21°C e uma umidade relativa do ar de aproximadamente 90 %.

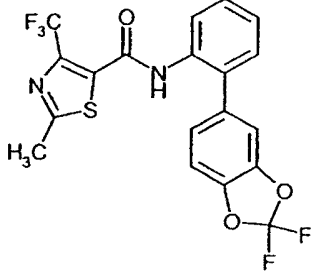
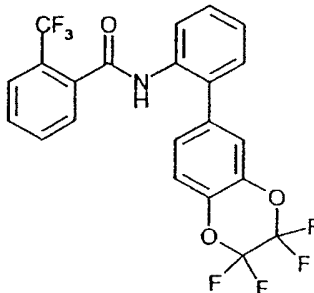
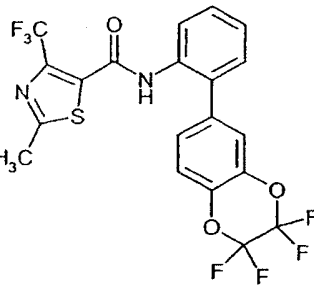
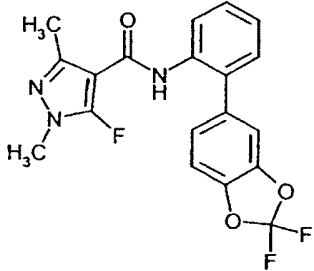
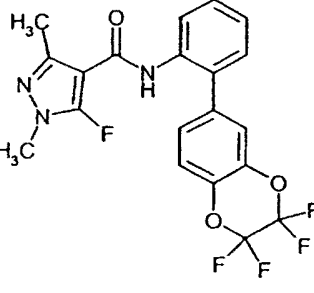
10 dias após inoculação efetua-se a avaliação. Com isso, 0 % significa um grau de efeito, que corresponde àquele do controle, enquanto que um grau de efeito de 100 % significa, que não é observada nenhuma infestação.

Substâncias ativas, quantidades de aplicação e resultados do ensaio são verificados na tabela abaixo.

Tabela C

Teste com *Venturia* - (maçã) / protetor

	Substância ativa	Quantidade de aplicação da substância ativa em g/ha	Grau de efeito em %
2		100	100
4		100	98

5		100	100
6		100	99
10		100	100
19		100	96
1		100	100

Exemplo D

Teste com *Alternaria* (tomate) / protetor

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

Emulsificante: 1 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

Para a produção de um preparado de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

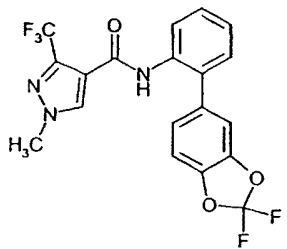
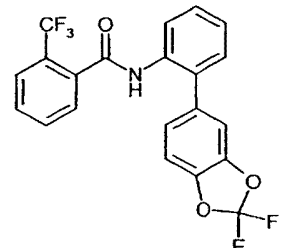
Para testar a eficácia protetora, pulverizam-se plantas de tomate jovens com o preparado da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Um dia após o tratamento, as plantas são inoculadas com uma suspensão de esporos de *Alternaria solani* e repousam depois durante 24 horas a 100% de umidade relativa do ar e 20°C. Em seguida, as plantas permanecem a 96 % de umidade relativa do ar e uma temperatura de 20°C.

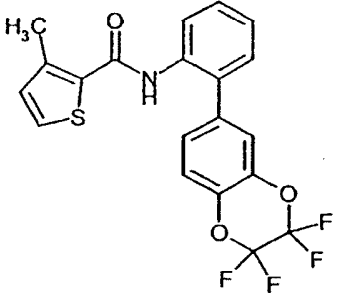
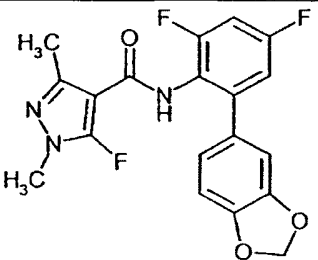
7 dias após a inoculação efetua-se a avaliação. Com isso, 0 % significa um grau de efeito, que corresponde àquele do controle, enquanto que um grau de efeito de 100 % significa, que não é observada nenhuma infestação.

Substâncias ativas, quantidades de aplicação e resultados do ensaio são verificados na tabela abaixo.

Tabela D

20 **Teste com *Alternaria* (tomate) / protetor**

	Substância ativa	Quantidade de aplicação da substância ativa em g/ha	Grau de efeito em %
2		750	100
3		750	94

9		750	95
15		750	95

Exemplo E

Teste com Puccinia (trigo) / protetor

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

Emulsificante: 0,6 parte em peso, de éter alquilarilpoliglicólico

- 5 Para a produção de um preparado de substância ativa conveniente, mistura-se 1 parte em peso, da substância ativa com as quantidades de solvente e emulsificante indicadas e dilui-se o concentrado com água para a concentração desejada.

- 10 Para testar a eficácia protetora, pulverizam-se plantas jovens com o preparado da substância ativa na quantidade de aplicação indicada. Após a secagem da camada borrifada, as plantas são borrifadas com uma suspensão de conídias de Puccinia recondita. As plantas permanecem durante 48 horas a 20°C e 100 % de umidade relativa do ar em uma cabina de incubação.

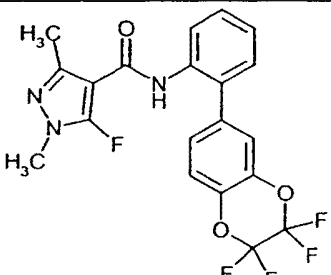
- 15 As plantas são colocadas, depois, em uma estufa a uma temperatura de aproximadamente 20° e uma umidade relativa do ar de 80 %, para favorecer o desenvolvimento de pústulas de ferrugem.

- 20 10 dias após a inoculação efetua-se a avaliação. Com isso, 0 % significa um grau de efeito, que corresponde àquele do controle, enquanto que um grau de efeito de 100 % significa, que não é observada nenhuma infestação.

Substâncias ativas, quantidades de aplicação e resultados do ensaio são verificados na tabela abaixo.

Tabela E

Teste com Puccinia (trigo) / protetor

	Substância ativa	Quantidade de aplicação da substância ativa em g/ha	Grau de efeito em %
1		500	100

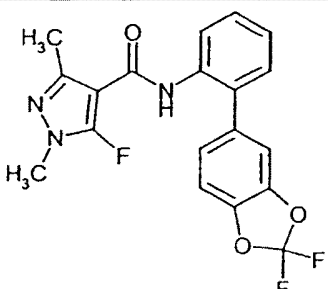
5 Exemplo F**Teste inibidor em uma colônia gigante de basidiomicetos**

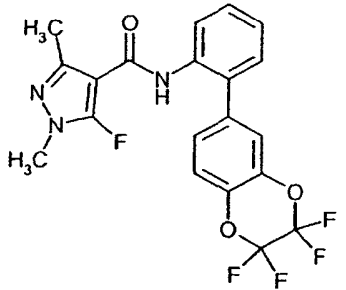
- A partir de uma colônia gigante da espécie de basidiomicetos *Coriolus versicolor* foram cortados pedaços de micélio e incubados em um meio de agar nutritivo contendo extrato de malte-peptona a 26°C. A inibição do crescimento dos hifens sobre solo nutritivo contendo substância ativa foi comparado com o crescimento longitudinal em solo nutritivo sem adição de substância ativa e avaliada como inibição percentual.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação de acordo com a invenção, mostram boa eficácia:

15 Tabela F

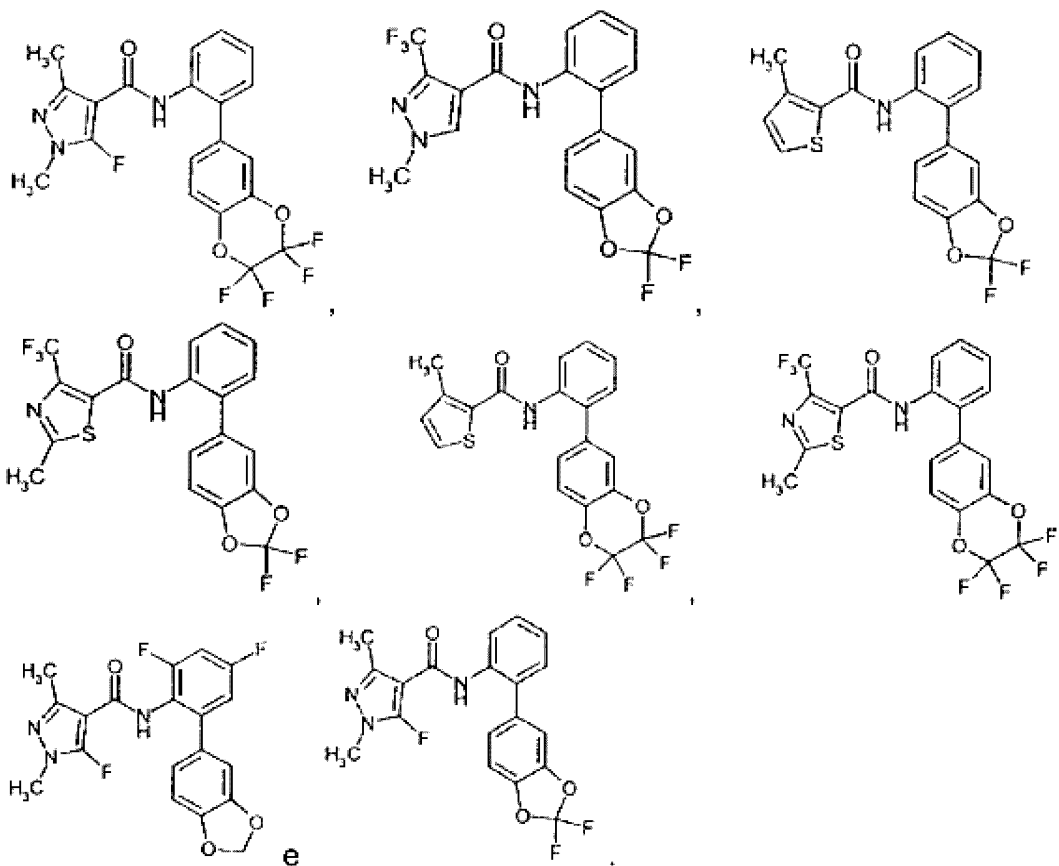
Teste inibidor em uma colônia gigante de basidiomicetos

	Substância ativa	Quantidade de aplicação da substância ativa em g/ha	Grau de efeito em %
19		6	100

1	 <chem>Cc1nc(C)c(F)c(=O)Nc2ccccc2-c3ccc(OCC(F)(F)F)cc3</chem>	6	100
---	---	---	-----

REIVINDICAÇÕES

1. Bifenilcarboxamidas, caracterizadas pelo fato de que são selecionadas dentre:



2. Processo para preparação de bifenilcarboxamidas, como definidas na reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que compreende:

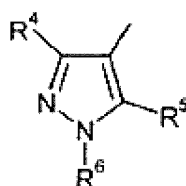
(a) reagirem derivados de ácido carboxílico da fórmula (II)



na qual

G representa halogênio, hidróxi ou C₁-C₆-alcóxi; e

A representa



em que

R^4 representa metila ou trifluormetila;

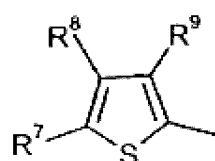
R^5 representa hidrogênio ou flúor, e

R^6 representa metila;

5

ou

A representa



em que

R^7 representa hidrogênio;

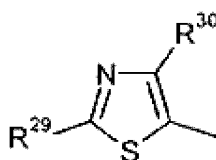
10

R^8 representa hidrogênio;

R^9 representa metila;

ou

A representa



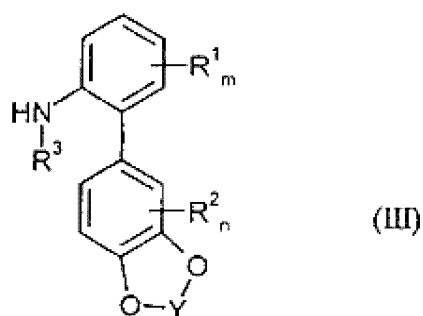
15

em que

R^{29} representa metila;

R^{30} representa trifluormetila;

com derivados de anilina da fórmula (III)



na qual

20

R^1 representa hidrogênio ou flúor;

m representa 1 ou 2, sendo que R^1 representa radicais iguais quando m representa 2;

R^2 representa hidrogênio;

n representa 1;

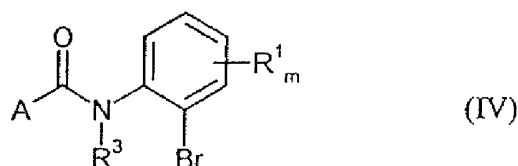
5 R^3 representa H;

Y representa $-\text{CH}_2$ ou $-(\text{CH}_2)_2$, em cada caso eventualmente substituído duas ou quatro vezes por flúor;

eventualmente na presença de um catalisador, eventualmente na presença de um agente ligador de ácido, e eventualmente na presença
10 de um diluente,

ou

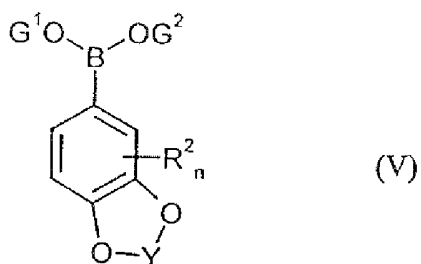
(b) reagirem derivados de carboxamida da fórmula (IV)



na qual

R^1 , m, R^3 e A são como definidos acima,

15 com derivados de ácido borônico da fórmula (V)



na qual

R^2 , n e Y são como definidos acima, e

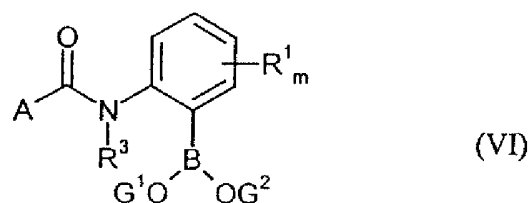
G^1 e G^2 representam em cada caso hidrogênio ou juntos representam tetrametiletileno,

20 na presença de um catalisador, eventualmente na presença de um agente ligador de ácido, e eventualmente na presença de um diluente,

ou

(c) reagirem derivados de carboxamida-ácido borônico da fórmu-

la (VI)



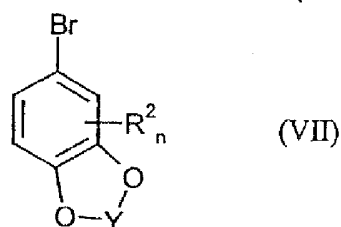
na qual

R^1 , m , R^3 e A são como definidos acima, e

G^1 e G^2 representam em cada caso hidrogênio ou juntos repre-

5 sentam tetrametiletileno,

com derivados de fenila da fórmula (VII)



na qual

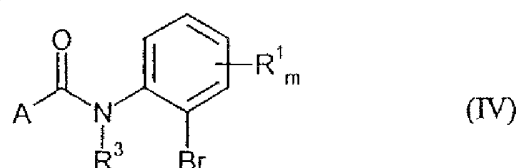
R^2 , n e Y são como definidos acima,

na presença de um catalisador, eventualmente na presença de

10 um agente ligador de ácido, e eventualmente na presença de um diluente,

ou

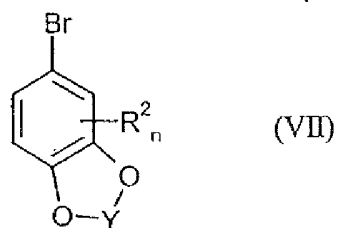
(d) reagirem derivados de carboxamida da fórmula (IV)



na qual

R^1 , m , R^3 e A são como definidos acima,

15 com derivados de fenila da fórmula (VII)



na qual

R^2 , n e Y são como definidos acima,

na presença de um catalisador de paládio ou de platina e na presença de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octameten-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolana, eventualmente na presença de um agente ligador de ácido, e eventualmente na
5 presença de um diluente.

3. Composição para combate de microorganismos indesejados, caracterizada por um teor de pelo menos uma bifenilcarboxamida, como definida na reivindicação 1, além de diluentes e/ou substâncias tenso-ativas.

4. Aplicação de bifenilcarboxamidas, como definidas na reivindicação 1, caracterizada pelo fato de que é para o combate de microorganismos indesejados.
10

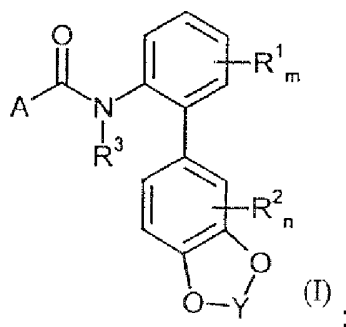
5. Processo para combate de microorganismos indesejados, caracterizado pelo fato de se aplicarem bifenilcarboxamidas, como definidas na reivindicação 1, sobre os microorganismos e/ou seu habitat.

6. Processo para preparação de composições para combate de microorganismos indesejados, caracterizado pelo fato de se misturarem bifenilcarboxamidas, como definidas na reivindicação 1, com diluentes e/ou substâncias tensoativas.
15

RESUMO

Patente de Invenção: **"BIFENILCARBOXAMIDAS, SUA APLICAÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO, PROCESSO PARA COMBATE DE MICROORGANISMOS INDESEJADOS, COMPOSIÇÃO E SEU PROCESSO DE PREPARAÇÃO".**

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



na qual R^1 , R^2 , m, n, R^3 , Y e A têm os significados indicados na descrição, processos para a preparação dessas substâncias e sua aplicação para o combate de microorganismos indesejados, bem como composições para e seu processo de preparação.