



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

**(11) PI 0616004-2 B1**



\* B R P I 0 6 1 6 0 0 4 B 1 \*

**(22) Data do Depósito:** 12/09/2006

**(45) Data de Concessão:** 19/04/2016

**(RPI 2363)**

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

**(51) Int.Cl.:** C07D 239/46; C07D 239/34; C07D 239/52; A01N 43/54

**(52) CPC:** A01N 43/54; A01N 43/84; C07D 239/34; C07D 239/47; C07D 239/52; C07D 403/04

**(30) Prioridade Unionista:** 13/09/2005 EP 05356157.7

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

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

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

5

**CAMPO DA INVENÇÃO**

A presente invenção refere-se aos derivados de 2,5-dissubstituído-4-pirimidinil-substituído-fenil-amidina, notadamente aos derivados de 2,5-dialquil-4-pirimidinil-substituído-fenil-amidina, ao seu processo de preparação, ao seu uso como agentes ativos inseticidas ou fungicidas, em particular, na forma de composições fungicidas ou inseticidas, e aos métodos para o controle do fungo fitopatogênico ou de insetos nocivos, notadamente de plantas, utilizando estes compostos ou composições.

**ANTECEDENTES DA INVENÇÃO**

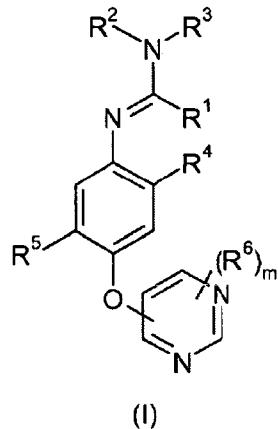
No documento WO 00/46184, certos derivados de fenil amidina são descritos. Entretanto, este documento não descreve especificamente nem sugere selecionar tais compostos em que o anel fenila é substituído de acordo com a invenção, permitindo, assim, uma inesperada e significativa maior atividade fungicida ou inseticida.

É sempre de grande interesse na agricultura utilizar novos compostos pesticidas a fim de evitar ou controlar o desenvolvimento cepas resistentes aos ingredientes ativos. É também sempre de grande interesse utilizar novos compostos que sejam mais ativos do que aqueles já conhecidos, com o objetivo de diminuir as quantidades de compostos ativos a serem utilizados, enquanto que, ao mesmo tempo, mantém uma eficácia pelo menos equivalente aos compostos já conhecidos.

**DESCRIÇÃO DA INVENÇÃO**

É revelada agora uma nova família de compostos que possui os efeitos mencionados acima ou as vantagens.

Conseqüentemente, a presente invenção apresenta os derivados de 2,4,5-trissubstituído-fenil-amidina de Fórmula (I):



em que:

- R<sup>1</sup> representa H, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, uma alquenila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, uma alquinila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, SH ou uma alquila S-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída;
- R<sup>2</sup> representa uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída;
- R<sup>3</sup> representa uma alquila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, uma cicloalquila C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> substituída ou não substituída, uma alquenila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, uma alquinila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, uma halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>; ou
- R<sup>1</sup> e R<sup>2</sup>, R<sup>1</sup> e R<sup>3</sup> ou R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> podem formar juntos um heterociclo de 5 a 7 membros substituídos ou não substituídos;
- R<sup>4</sup> representa uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, um átomo de halogênio, uma halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, uma alquila O-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída ou ciano;
- R<sup>5</sup> representa H, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, um átomo de halogênio, uma halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, uma alquila O-C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída ou ciano;
- R<sup>6</sup> representa H, halogênio, CN, fenóxi substituído ou não

substituído, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, uma halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, OR<sup>7</sup>, SR<sup>7</sup>, trialquilsilil, COOR<sup>7</sup>, C(R<sup>7</sup>)=NOR<sup>7</sup>; NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>;

- R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> representam independentemente H, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída, arila ou R<sup>7</sup> e R<sup>8</sup> podem formar um heterociclo de

5 5 a 7 membros saturados ou não saturados, substituídos ou não substituídos, incluindo um ou mais átomos selecionados na lista que consiste em O, N e S;

- m representa 1, 2 ou 3;

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

10 Quaisquer dos compostos de acordo com a presente invenção podem existir em uma ou mais formas isômeras ópticas ou quirais dependendo

do número de centros assimétricos no composto. Assim, a presente invenção refere-se igualmente a isômeros ópticos e às suas misturas racêmicas ou escalêmicas (o termo “escalêmico” denota uma mistura de enantiômeros em

15 diferentes proporções), e às misturas de todos os estereoisômeros possíveis, em todas as proporções. Os diastereoisômeros e/ou os isômeros ópticos podem ser separados de acordo com os métodos que são conhecidos *per se*

pelo técnico no assunto regular.

Quaisquer dos compostos de acordo com a presente invenção 20 também podem existir em uma ou mais formas de isômeros geométricos – dependendo do número de ligações duplas no composto. Assim, a presente

invenção refere-se igualmente a todos os isômeros geométricos e a todas as misturas possíveis, em todas as proporções. Os isômeros geométricos podem ser separados de acordo com os métodos gerais, que são conhecidos *per se*

25 pelo técnico no assunto regular.

Para os compostos de acordo com a presente invenção, halogênio significa quaisquer destes do flúor, bromo, cloro ou iodo e o

heteroátomo pode ser o nitrogênio, oxigênio ou enxofre.

Os compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>1</sup> representa H; alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>; de preferência, alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> como metila; ou SH.

5 Outros compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>2</sup> representa a metila.

Ainda, outros compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>3</sup> representa alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>; de preferência, uma alquila C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> não substituída como a etila, *n*-propila, *i*-propila; alquenila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>, de preferência, alquenila C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> como a propenila ou a alila; 10 cicloalquila C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> como a ciclopropila.

Ainda, outros compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> podem formar juntos um heterociclo de 5 a 7 membros substituído ou não substituído, de preferência, um heterociclo de 6 membros, de maior preferência, uma pipiridinila ou uma 15 pirolidinila, de maior preferência, ainda, um bis-alquil-pirolidinila como uma bis-metil-pirolidinila.

Ainda, outros compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>4</sup> representa alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>; de preferência, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> não substituída como a metila, um átomo de 20 halogênio como um átomo de cloro.

Ainda, outros compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>5</sup> representa H, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> substituída ou não substituída, um átomo de halogênio, halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, uma alquila O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> substituída ou não substituída ou CN.

25 Ainda, outros compostos preferidos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção são aqueles em que R<sup>6</sup> representa H, halogênio, CN, fenóxi substituído ou não substituído, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> substituída ou não substituída notadamente a alquila ramificada C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>,

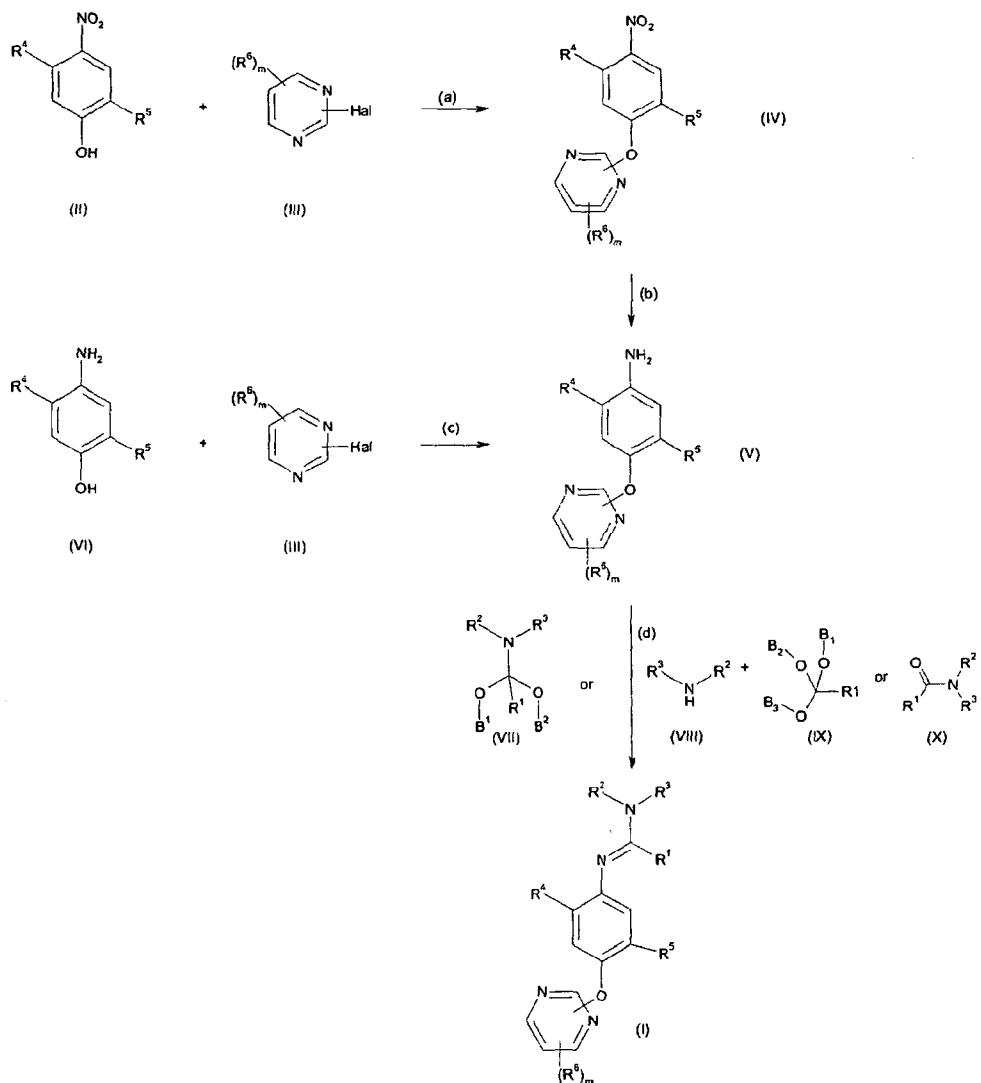
OR<sup>7</sup>, SR<sup>7</sup>, trialquilsilil, COOR<sup>7</sup>, C(R<sup>7</sup>)=NOR<sup>7</sup>; NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup> em que R<sup>7</sup> e R<sup>8</sup> são conforme descrito no presente.

As preferências mencionadas acima com relação aos substituintes dos compostos de acordo com a presente invenção podem ser combinadas de diversas maneiras. Estas combinações das características preferidas fornecem, assim, sub-classes dos compostos de acordo com a presente invenção. Os exemplos de tais subclasses dos compostos preferidos de acordo com a presente invenção podem combinar:

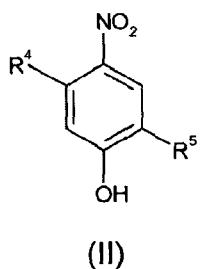
- as características preferidas de R<sup>1</sup> com as características preferidas de R<sup>2</sup> a R<sup>6</sup>;
- as características preferidas de R<sup>2</sup> com as características preferidas de R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup>;
- as características preferidas de R<sup>3</sup> com as características preferidas de R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup>;
- as características preferidas de R<sup>4</sup> com as características preferidas de R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup>;
- as características preferidas de R<sup>5</sup> com as características preferidas de R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup>.

Nestas combinações das características preferidas dos substituintes dos compostos de acordo com a presente invenção, as ditas características preferidas também podem ser selecionadas entre as características de maior preferência de cada um de R<sup>1</sup> a R<sup>6</sup> e m de modo a formar as subclasses de maior preferência dos compostos de acordo com a presente invenção.

A presente invenção também se refere a um processo para a preparação de um composto de Fórmula (I). Assim, de acordo com um aspecto adicional da presente invenção, é fornecido um processo P1 para a preparação do composto de Fórmula (I) e ilustrado de acordo com o seguinte esquema de reação:



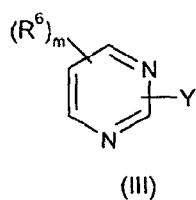
Os derivados de aminofeniléter de Fórmula (V) podem ser preparados de acordo com a etapa do processo (a) pela reação dos derivados de anilina de Fórmula (II)



em que:

-  $R^4$  e  $R^5$  são conforme definidos no presente;

com os derivados de pirimidina de Fórmula (III)



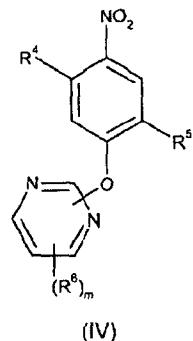
em que

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

-  $Y$  representa halogênio, triflato,  $SOMe$ , mesilato ou tosilato;

seguido pela etapa do processo (b) que compreende a redução

5 dos derivados de nitrofeniléter de Fórmula (IV) obtido seguido da etapa do processo (a)



em que:

-  $R^4$  a  $R^6$  e  $m$  são conforme definidos no presente.

O processo da etapa (a) de acordo com a presente invenção pode

10 ainda compreender uma ou mais das seguintes características:

- presença de uma base;

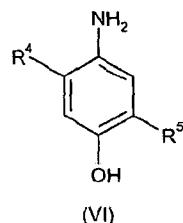
- presença de um diluente;

- presença de um catalisador.

As condições de reação preferidas para a realização da etapa do

15 processo (b) de acordo com a presente invenção compreendem a reação com cloreto estanhoso em ácido clorídrico concentrado.

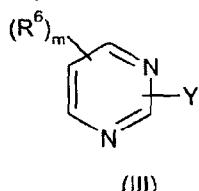
Os derivados de pirimidina de Fórmula (V) também podem ser preparados de acordo com a etapa do processo (c) pela reação dos derivados de anilina de Fórmula (VI)



em que:

-  $R^4$  e  $R^5$  são conforme definidos no presente;

com os derivados de piridina de Fórmula (III)



em que:

5 -  $R^6$  e  $m$  são conforme definidos no presente.

- Y representa halogênio, triflato,  $SOMe$ , mesilato ou tosilato.

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

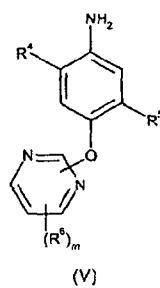
- presença de uma base;

10 - presença de um diluente;

- presença de um catalisador.

Os derivados de pirimidina de Fórmula (V) também podem ser preparados pelos métodos conhecidos.

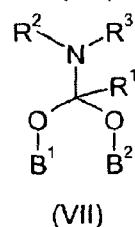
Os derivados de amidina de Fórmula (I) podem ser obtidos de 15 acordo com a etapa do processo (d) ao utilizar os derivados de anilina de Fórmula (V) como material de partida.



Os derivados de amidina de Fórmula (I) podem ser preparados por um processo adicional (d) de acordo com a presente invenção. Diversas alternativas do processo (d) de acordo com a presente invenção podem ser consideradas, elas são definidas como o processo (d1), processo (d2) e processo (d3) de acordo com a presente invenção.

O processo (d) de acordo com a presente invenção compreende a reação dos derivados de anilina de Fórmula (V) com diversos reagentes definindo, assim, os processos (d1), (d2) e (d3) respectivamente.

O processo (d1) é realizado adicionalmente utilizando os derivados de amino-acetal de Fórmula (VII)



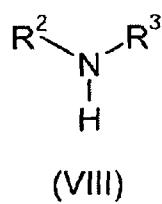
em que:

- $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$  são conforme definidos no presente;
- $\text{B}^1$  e  $\text{B}^2$  representam cada um a alquila ou a cicloalquila juntos.

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

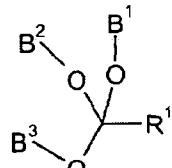
- presença de um ácido ou uma base;
- presença de um diluente.

O processo (d2) é realizado ainda utilizando os derivados de amina de Fórmula (VIII)



em que:

- R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> são conforme definidos no presente;  
na presença dos derivados de ortoéster de Fórmula (IX)



(IX)

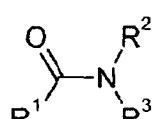
em que:

- R<sup>1</sup> é conforme definido no presente;

5 - B<sup>1</sup>, B<sup>2</sup> e B<sup>3</sup> representam, cada um, uma alquila.

A Fórmula (V) fornece uma definição geral dos derivados de anilina úteis como materiais de partida para a realização do processo (d2) de acordo com a presente invenção. Nesta Fórmula, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> e m representam, de preferência, os substituintes ou valores conforme definidos no presente em conjunto com a descrição dos compostos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

O processo (d3) é realizado adicionalmente utilizando os derivados de amida de Fórmula (X)



(X)

em que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> são conforme definidos no presente.

15 O processo (d3) de acordo com a presente invenção pode ainda compreender uma ou mais das seguintes características:

- presença de um agente de halogenação, como o PCl<sub>5</sub>, PCl<sub>3</sub>,

POCl<sub>3</sub>, SOCl<sub>2</sub>;

- presença de um diluente.

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

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

Os diluentes apropriados para realizar os processos (a), (b) e (c) de acordo com a presente invenção são todos solventes orgânicos inertes usuais. É dada uma preferência à utilização de hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalin; hidrocarbonetos halogenados, tais como clorobenzeno, diclorobenzeno, diclorometano, clorofórmio, tetracloreto de carbono, dicloroetano ou tricloroetano; éteres, tais como dietil éter, diisopropil éter, metil *terc*-butil éter, metil *terc*-amil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, *n*- ou *iso*-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; suas misturas com água ou água pura.

Os diluentes apropriados para realizar o processo (d1), (d2) e (d3) de acordo com a presente invenção são, em cada caso, solventes orgânicos inertes usuais. É dada uma preferência à utilização de hidrocarbonetos alifáticos, alicíclicos ou aromáticos, tais como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benzeno, tolueno, xileno ou decalin; éteres, tais como dietil éter, diisopropil éter, metil *terc*-butil éter, metil *terc*-amil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano ou anisol; nitrilas, tais como acetonitrila, propionitrila, *n*- ou *iso*-butironitrila ou benzonitrila; amidas, tais como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona ou triamida hexametilfosfórica; ésteres, tais como acetato de metila ou acetato de etila; sulfóxidos, tais como dimetilsulfóxido; ou sulfonas, tais como sulfolano; álcoois, tais como metanol, etanol, *n*- ou *iso*-propanol, *n*-, *iso*-, *sec*- ou *terc*-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, dietilenoglicolmonometiléter, dietilenoglicolmonoetiléter, suas misturas com água ou água pura.

Os ligantes ácidos apropriados para realizar os processos (a), (b) e (c) de acordo com a presente invenção são, todos, bases inorgânicas e orgânicas usuais para tais reações. É dada uma preferência ao utilizar hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, hidróxidos, amidas, alcoolatos, acetatos, 5 carbonatos ou carbonatos de hidrogênio, tais como, hidreto de sódio, amida de sódio, diisoproilamida de lítio, metanolato de sódio, etanolato de sódio, *terc*-butanolato de sódio, acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio, ou carbonato de amônio; e 10 também a aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-benzilamina piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazobiciclooctano (DABCO), diazobiciclononeno (DBN) ou diazobicicloundeceno (DBU).

Os ligantes ácidos apropriados para realizar os processos (b), (c), 15 (d) de acordo com a presente invenção são, em cada caso, todos bases inorgânicas e orgânicas usuais para tais reações. É dada uma preferência ao uso de hidretos de metal alcalino e metal alcalino terroso, hidróxidos, amidas, alcoolatos, acetatos, fluoretos, fosfatos, carbonatos ou carbonatos de hidrogênio, tais como, hidreto de sódio, amida de sódio, diisoproilamida de lítio, 20 metanolato de sódio, etanolato de sódio, *terc*-butanolato de potássio, hidróxido de sódio, hidróxido de potássio, acetato de sódio, fosfato de sódio, fosfato de potássio, fluoreto de potássio, fluoreto de césio, carbonato de sódio, carbonato de potássio, hidrogenocarbonato de potássio, hidrogenocarbonato de sódio ou carbonato de césio; e também a aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-benzilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazobiciclooctano (DABCO), diazobiciclononeno (DBN) ou diazobicicloundeceno (DBU).

Os ácidos apropriados para a realização do processo (d3) de acordo com a presente invenção são todos os ácidos orgânicos ou inorgânicos usuais para tais reações. A preferência é dada para a utilização do ácido *para*-tolueno sulfônico, ácido metano sulfônico, ácido clorídrico (solução gasosa, 5 aquosa ou orgânica) ou ácido sulfúrico.

Os agentes de condensação apropriados para a realização do processo (d1) de acordo com a presente invenção são todos os agentes de condensação usuais para tais reações de aminaçao. A preferência é dada para a utilização do formador de haleto ácido, tal como o fosgено, tribrometo fosforoso, 10 tricloreto fosforoso, pentacloreto fosforoso, óxido tricloreto fosforoso ou cloreto de tionila; formador de anidrido, tal como cloroformato de etila, cloroformato de metila, cloroformato de isopropila, cloroformato de isobutila ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidas, tais como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) ou outros agentes de condensação usuais, tais como pentóxido fosforoso, ácido polifosfórico, N,N'- 15 carbonildiimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonila-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/ tetraclorometano ou bromo-tripirrolidino-fosfônio-hexafluorofosfato.

Os processos (a), (b) e (c) da presente invenção podem ser realizados na presença de um catalisador. É dada a preferência aos sais de paládio ou aos complexos, tais como cloreto de paládio, acetato de paládio, 20 tetrakis-(trifenilfosfina) paládio, dicloreto de bis-(trifenilfosfina) paládio ou cloreto de 1,1'-bis-(difenilfosfino)ferrocenopaládio (II).

Também é possível gerar um complexo de paládio diretamente na mistura de reação ao adicionar separadamente à mistura de reação um sal de paládio e um complexo ligante, tal como trietilfosfano, tri-terc-butilfosfano, 25 triciclohexilfosfano, 2-(diciclohexilfosfano)bifenila, 2-(di-terc-butilfosfano)bifenila, 2-(diciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)bifenila, trifenilfosfano, tris-(otolil)fosfano, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato de sódio, tris-2-(metoxifenil)fosfano, 2,2'-bis-(difenilfosfano)-1,1'-binaftil, 1,4-bis-(difenilfosfano)butano, 1,2-bis-

(difenilfosfano)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfano)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfano)etano, 2-(diciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)bifenila, bis-(difenilfosfino)ferroceno ou tris-(2,4-*terc*-butilfenil)-fosfito.

Quando são realizados os processos (d) de acordo com a presente invenção, a temperatura de reação pode ser variada dentro de um intervalo relativamente amplo. Em geral, o processo é realizado em temperaturas entre 0° C a 150° C, de preferência, de 0° C a 120° C, de maior preferência, de 10° C a 90° C.

Quando são realizados os processos (a) e (b) de acordo com a presente invenção, as temperaturas de reação em cada caso podem ser variadas dentro de um intervalo relativamente amplo. Em geral, o processo é realizado em temperaturas entre 0° C a 180° C, de preferência, de 10° C a 150° C, de maior preferência, de 20° C a 120° C.

Em geral, para realizar o processo (a) de acordo com a presente invenção, de 0,8 a 15 mols, de preferência, de 0,8 a 8 mols, de derivado de fenol de Fórmula (III) e de 1 a 3 mols de ligante ácido são empregados por mol de derivado de pirimidina de Fórmula (II).

Entretanto, também é possível empregar os componentes da reação em outras razões.

O desenvolvimento é realizado pelos métodos usuais.

A água pode ser adicionada à mistura de reação e a fase orgânica pode ser separada e, após a secagem, concentrada sob pressão reduzida. O resíduo que permanece pode, caso apropriado, ser liberado quaisquer impurezas que podem ainda estar presentes utilizando os métodos usuais, tais como cromatografia ou recristalização.

Os processos de acordo com a presente invenção são, em geral, realizados sob pressão atmosférica.

Entretanto, em cada caso, também é possível operar sob pressão elevada ou reduzida – em geral, de 0,1 bar a 10 bar.

Os compostos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção podem ser preparados de acordo com os processos descritos no presente. No entanto, será entendido que na base deste conhecimento geral e das publicações disponíveis, o técnico no assunto será capaz de adaptar estes processos de acordo 5 com as especificações de cada um dos compostos que é desejado para sintetizar.

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

A expressão “quantidade eficaz e não fitotóxica” significa uma 10 quantidade de composição de acordo com a presente invenção que é suficiente para controlar ou destruir o fungo presente ou sujeito a aparecer em culturas, e que não implica em qualquer sintoma notável de fitotoxicidade para ditas culturas. Tal quantidade pode variar dentro de um amplo intervalo dependendo do fungo a ser controlado, o tipo de cultura, as condições climáticas e os compostos incluídos na 15 composição fungicida de acordo com a presente invenção.

Esta quantidade pode ser determinada por testes em campo sistemáticos, que estão dentro das capacidades de um técnico no assunto.

Assim, de acordo com a presente invenção, é fornecida uma composição fungicida que compreende, como um ingrediente ativo, uma 20 quantidade eficaz de um composto de Fórmula (I) conforme definido no presente e um suporte, veículo ou carga aceitável em agricultura.

De acordo com a presente invenção, o termo “suporte” refere-se a um material natural ou sintético, orgânico ou inorgânico com o qual o composto ativo de Fórmula (I) é combinado ou associado para torná-lo mais fácil de 25 aplicar, notavelmente, nas partes da planta. Portanto, este suporte é, em geral, inerte e deve ser aceitável em agricultura. O suporte pode ser um sólido ou um líquido. Os exemplos de suportes apropriados incluem a argila, silicatos naturais ou sintéticos, sílica, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, água, álcoois,

em particular o butanol, solventes orgânicos, óleos minerais e vegetais e seus derivados. As misturas de tais suportes também podem ser utilizadas.

A composição de acordo com a presente invenção também pode compreender os componentes adicionais. Em particular, a composição pode 5 ainda compreender um tensoativo. O tensoativo pode ser um emulsificante, um agente dispersante ou um agente umidificador do tipo iônico ou não iônico ou uma mistura de tais tensoativos. Pode ser feita menção, por exemplo, aos sais de ácido poliacrílico, sais de ácido lignossulfônico, sais de ácido fenolssulfônico ou naftalenossulfônico, policondensados de óxido de etileno com álcoois 10 graxos ou com ácidos graxos ou com aminas graxas, fenóis substituídos (em particular, alquilfenóis ou arilfenóis), sais de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados taurinos (em particular, tauratos de alquila), ésteres fosfóricos de álcoois ou fenóis polioxietilados, ésteres de ácido graxo de polióis e os 15 derivados dos compostos presentes contendo funções sulfato, sulfonato e fosfato. A presença de pelo menos um tensoativo é geralmente essencial quando o composto ativo e/ou o suporte inerte são insolúveis em água e quando o agente vetor para a aplicação é a água. De preferência, o teor de tensoativo pode estar compreendido entre 5% e 40% em peso da composição.

Opcionalmente, os componentes adicionais também podem ser 20 incluídos, por exemplo, colóides protetores, adesivos, espessantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetração, estabilizantes, agentes seqüestrantes. Geralmente, os compostos ativos podem ser combinados com qualquer aditivo sólido ou líquido, os quais cumprem com as técnicas de formulação usuais.

Em geral, a composição de acordo com a presente invenção pode 25 conter de 0,05 a 99% em peso do composto ativo, de preferência, de 10 a 70% em peso.

As composições de acordo com a presente invenção podem ser utilizadas em várias formas, tais como dispensador aerossol, isca (pronta para o

uso), concentrado de isca, isca em bloco, suspensão em cápsula, concentrado de nebulização a frio, pó empoeirável, concentrado emulsificável, emulsão de óleo-em-água, emulsão água-em-óleo, grânulo encapsulado, grânulo fino, concentrado com capacidade de fluxo para o tratamento de sementes, gás (sob pressão),  
5 produto gerador de gás, isca em grão, isca em grânulo, grânulo, concentrado de nebulização a quente, macrogrânulo, microgrânulo, pó dispersível em óleo, concentrado com capacidade de fluxo miscível em óleo, líquido miscível em óleo, pasta, bastonete de planta, isca em placa, pó para o tratamento de sementes secas, isca em pedaço, semente revestida com um pesticida, vapor de vela,  
10 cartucho de vapor, gerador de vapor, *pellet* de vapor, bastão de vapor, tablete de vapor, lata de vapor, concentrado solúvel, pó solúvel, solução para o tratamento de semente, concentrado de suspensão (concentrado com capacidade de fluxo), pó de controle, líquido de volume ultra baixo (ULV), suspensão de volume ultra baixo (UVL), produto liberador de vapor, grânulos ou tabletes dispersíveis em  
15 água, pó dispersível em água para o tratamento de calda, grânulos ou tabletes hidrossolúveis, pó hidrossolúvel para o tratamento de semente e pó umidificável.

Estas composições incluem não apenas as composições que estão prontas para serem aplicadas na planta ou na semente a ser tratada por meios de um dispositivo apropriado, tais como um dispositivo de aspersão ou  
20 pulverização, mas também as composições comerciais concentradas que devem ser diluídas antes da aplicação na cultura.

Os compostos de acordo com a presente invenção também podem ser misturados com uma ou mais substância ativa de inseticidas, fungicidas, bactericidas, atrativos, acaricidas ou feromônios ou outros compostos com atividade  
25 biológica. As misturas assim obtidas possuem um espectro ampliado de atividade.

As misturas com outros compostos fungicidas são particularmente vantajosas. Os exemplos de associações em mistura de fungicidas apropriados podem ser selecionados na seguinte lista:

(B1) um composto capaz de inibir a síntese de ácido nucléico como o benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, quiralaxil, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico;

(B2) um composto capaz de inibir a mitose e a divisão celular  
5 como a benomila, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurona, tiabendazol, tiofanato-metila, zoxamida;

(B3) um composto capaz de inibir a respiração, por exemplo,  
- como um inibidor da respiração Cl como o diflumetorim;  
- como um inibidor da respiração CII como o boscalid, carboxina,  
10 fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronila, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida;  
- como um inibidor da respiração CIII como o azoxistrobin, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, cresoxim-metila, metominostrobina, orisastrobina, piraclostrobina,  
15 picoxistrobina, trifloxistrobina;

(B4) um composto capaz de agir como um desacoplador como o dinocap, fluazinam;

(B5) um composto capaz de inibir a produção de ATP como o acetato de fenantin, cloreto de fenantin, hidróxido de fenantin, siltiofam;

20 (B6) um composto capaz de inibir a biossíntese de proteína e aminoácido como o andoprim, blasticidin-S, ciprofénol, casugamicina, hidrato de cloreto de casugamicina, mepanipirim, pirimetanil;

(B7) um composto capaz de inibir a transdução de sinal como o fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen;

25 (B8) um composto capaz de inibir a síntese de lipídio e membrana como o clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina, pirazofós, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotiolano, tolclofós-metila, bifenila, iodocarb, propamocarb, cloreto de propamocarb;

(B9) um composto capaz de inibir a biossíntese de ergosterol como o fenexamida, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, *cis*-furconazol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanol, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, proticonazol, simeconazol, tebuconazol, tetriconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifeno, triforina, perfurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, 10 aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, spiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

(B10) um composto capaz de inibir a síntese de parede celular como o bentiavalicarb, bialafós, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxins, polioxorim, validamicina A;

15 (B11) um composto capaz de inibir a biossíntese de melanina como o carpropamida, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilon, triciclavol;

(B12) um composto capaz de induzir uma defesa do hospedeiro como o acibenzolar-S-metila, probenazol, tiadinila;

20 (B13) um composto capaz de possuir uma ação multilocalizada como o captafol, captan, clorotalonil, preparações de cobre tais como o hidróxido de cobre, naftalenato de cobre, oxicloreto de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, mistura de oxine de cobre e Bordeaux, diclofluanid, ditianon, dodina, base livre de dodina, ferbam, flurofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, 25 mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram de zinco, propineb, enxofre e preparações de enxofre incluindo o polissulfeto de cálcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram;

(B14) um composto selecionado da seguinte lista: amibromadol,

bentiazol, betoxazin, capsimicin, carvona, chinometionat, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofen, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetyl alumínio, fosetyl cálcio, fosetyl sódio, 5 fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicin, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metila, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropila, octilinona, oxamocarb, oxifentiin, pentaclorofenol e sais, 2-fenilfenol e sais, ácido fosforoso e seus sais, piperalin, propanosina de sódio, proquinazida, pirrolnitrina, 10 quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclamida, zarilamid e 2, 3, 5, 6-tetracloro-4-(metilsulfônico)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etyl-4-metilbenzenossulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolecarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]-piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H,1,2,4-triazol-1-il)-15 cicloheptanol, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metila, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinadicarbonitrila, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetíleno)-benzenoacetato de metila, 4-cloro-alfa-propinilóxi-N-[2-[3-metóxi-4-(2-propinilóxi)fenil]etyl]-benzenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]óxi]3-metoxifenil]etyl]-3-metil-2-[(metilsulfônico)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 25 N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etyl]-2,4-dicloronicotinamida, 2-butóxi-6-iodo-3-propil-benzopiran-4-ona, N-{(Z)-[(ciclopropilmetóxi)imino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-(3-etyl-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formilamino-2-hidróxi-benzamida, 2-[[[[1-[3-(1-fluoro-2-

feniletil)óxi]fenil]etilideno]amino]óxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-  
 benzenoacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)-benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenóxi)-5-fluoropirimidin-4-il]óxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenóxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotióico.

A composição, de acordo com a presente invenção que compreende uma mistura de um composto de Fórmula (I) com um composto bactericida também pode ser particularmente vantajosa. Os exemplos de associação de mistura bactericida apropriadas podem ser selecionados na seguinte lista: bronopol, diclorofen, nitrapirina, dimetilditilcarbamato de níquel, casugamicina, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre e outras preparações de cobre.

O composto de Fórmula (I) e a composição fungicida de acordo com a presente invenção podem ser utilizados para controlar de maneira curativa ou preventiva o fungo fitopatogênico de plantas ou culturas. Deste modo, de acordo com um aspecto adicional da presente invenção, é fornecido um método para o controle curativo ou preventivo do fungo fitopatogênico de plantas ou culturas, caracterizado em que um composto de Fórmula (I) ou uma composição fungicida de acordo com a presente invenção são aplicados à semente, à planta e/ou ao fruto da planta ou ao solo em que a planta está crescendo ou em que é desejável que ela cresça.

Da mesma maneira, o composto de fórmula (I) e a composição inseticida de acordo com a presente invenção podem ser utilizados para controlar de maneira curativa ou preventiva os insetos nocivos, notadamente, de plantas ou culturas. Deste modo, de acordo com um aspecto adicional da presente invenção, é fornecido um método para o controle curativo ou

preventivo dos insetos nocivos, notadamente, de plantas ou culturas, caracterizado em que uma composição de Fórmula (I) ou uma composição inseticida de acordo com a presente invenção é aplicada à semente, à planta ou ao fruto da planta ou ao solo em que a planta está crescendo ou em que é 5 desejável que ela cresça.

O método de tratamento de acordo com a presente invenção também pode ser útil para tratar o material de propagação, tal como tubérculos ou rizomas, mas também sementes, mudas ou mudas transferidas e plantas ou plantas transferidas. Este método de tratamento também pode ser útil para 10 tratar as raízes. O método de tratamento de acordo com a presente invenção também pode ser útil para tratar as partes aéreas da planta, tal como troncos, caules ou talos, folhas, flores e frutas da planta em questão.

Entre as plantas que podem ser protegidas pelo método de acordo com a presente invenção, pode ser feita menção às culturas de 15 algodão; linho; vinha; frutas ou vegetais, tais como *Rosaceae* sp. (por exemplo, frutas com caroço, tais como maçãs e pêras, mas também frutas de um caroço, tais como damasco, amêndoas e pêssegos), *Ribesioideae* sp., *Junglandaceae* SP., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidiaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por exemplo, 20 bananeiras e bananas tipo plantin), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiceae* sp., *Rutaceae* sp. (por exemplo, limões, laranjas e toronja); *Solanaceae* sp. (por exemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por exemplo, alfaces), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por exemplo, ervilhas), *Rosaceae* sp. (por exemplo, 25 morangos); principais culturas, tais como *Graminae* sp. (por exemplo, milho, grama ou cereais tais como trigo, arroz, cevada e triticale), *Asteraceae* sp. (por exemplo, girassol), *Cruciferae* sp. (por exemplo, colza) *Fabaceae* sp. (por exemplo, amendoins), *Papilionaceae* sp. (por exemplo, soja), *Solanaceae* sp.

(por exemplo, batatas), *Chenopodiaceae* sp. (por exemplo, raízes de beterraba); horticulturas e culturas em florestas; bem como homólogos geneticamente modificados destas culturas.

Entre as doenças de plantas ou culturas que podem ser controladas 5 pelo método de acordo com a presente invenção, pode ser feita menção a:

Doenças do ódio, tais como:

- Doença da *Blumeria*, causada, por exemplo, pela *Blumeria graminis*;

- Doença da *Podosphaera*, causada, por exemplo, pela

10 *Podosphaera leucotricha*;

- Doença da *Sphaerotheca*, causada, por exemplo, pela *Sphaerotheca fuliginea*;

- Doença da *Uncinula*, causada, por exemplo, pela *Uncinula necator*,

Doenças da Ferrugem, tais como:

15 - Doença da *Gymnosporangium*, causada, por exemplo, pela *Gymnosporangium sabinae*;

- Doença da *Hemileia*, causada, por exemplo, pela *Hemileia vastatrix*;

- Doença da *Phakopsora*, causada, por exemplo, pela *Phakopsora*

20 *pachyrhizi* ou *Phakopsora meibomiae*;

- Doença da *Puccinia*, causada, por exemplo, pela *Puccinia recondita*;

- Doença da *Uromyces*, causada, por exemplo, pela *Uromyces appendiculatus*;

25 Doenças de oomicetes, tais como:

- Doença da *Bremia*, causada, por exemplo, pela *Bremia lactucae*;

- Doença da *Peronospora*, causada, por exemplo, pela *Peronospora pisi* ou *P. brassicae*;

- Doença da Phytophthora, causada, por exemplo, pela *Phytophthora infestans*;
- Doença da Plasmopara, causada, por exemplo, pela *Plasmopara viticola*;
- 5 - Doença da Pseudoperonospora, causada, por exemplo, pela *Pseudoperonospora humuli* ou *Pseudoperonospora cubensis*;
- Doença da Pythium, causada, por exemplo, pela *Pythium ultimum*;

Doenças da mancha foliar, mancha-aquosa foliar e deterioração foliar tais como:

- Doença da Alternaria, causada, por exemplo, pela *Alternaria solani*;
- Doença da Cercospora, causada, por exemplo, pela *Cercospora beticola*;
- 15 - Doença da Cladosporum, causada, por exemplo, pela *Cladosporum cucumerinum*;
- Doença da Cochliobolus, causada, por exemplo, pela *Cochliobolus sativus*;
- Doença da Colletotrichum, causada, por exemplo, pela *Colletotrichum lindemuthianum*;
- 20 - Doença da Cycloconium, causada, por exemplo, pela *Cycloconium oleaginum*;
- Doença da Diaporthe, causada, por exemplo, pela *Diaporthe citri*;
- 25 - Doença da Elsinoe, causada, por exemplo, pela *Elsinoe fawcettii*;
- Doença da Gloeosporium causada, por exemplo, pela *Gloeosporium laeticolor*;

- Doença da Glomerella, causada, por exemplo, pela *Glomerella cingulata*;
- Doença da Guignardia, causada, por exemplo, pela *Guignardia bidwellii*;
- 5 - Doença da Leptosphaeria, causada, por exemplo, pela *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;
- Doença da Magnaporthe, causada, por exemplo, pela *Magnaporthe grisea*;
- Doença da Mycosphaerella, causada, por exemplo, pela
- 10 *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;
- Doença da Phaeosphaeria, causada, por exemplo, pela *Phaeosphaeria nodorum*;
- Doença da Pyrenophora, causada, por exemplo, pela *Pyrenophora teres*;
- 15 - Doença da Ramularia, causada, por exemplo, pela *Ramularia collo-cygni*;
- Doença da Rhynchosporium, causada, por exemplo, pela *Rhynchosporium secalis*;
- Doença da Septoria, causada, por exemplo, pela *Septoria apii* ou
- 20 *Septoria lycoperdisi*;
- Doença da Typhula, causada, por exemplo, pela *Typhula incarnata*;
- Doença da Venturia, causada, por exemplo, pela *Venturia inaequalis*;

Doenças da raiz e do caule, tais como:

- 25 - Doença da Corticium, causada, por exemplo, pela *Corticium graminearum*;
- Doença da Fusarium, causada, por exemplo, pela *Fusarium oxysporum*;

- Doença da *Gaeumannomyces*, causada, por exemplo, pela *Gaeumannomyces graminis*;
- Doença da *Rhizoctonia*, causada, por exemplo, pela *Rhizoctonia solani*;
- 5 - Doença da *Tapesia*, causada, por exemplo, pela *Tapesia acuformis*;
- Doença da *Thielaviopsis*, causada, por exemplo, pela *Thielaviopsis basicola*;
- 10 Doenças da orelha e da panícula, tal como:
  - Doença da *Alternaria*, causada, por exemplo, pela *Alternaria spp.*;
  - Doença da *Aspergillus*, causada, por exemplo, pela *Aspergillus flavus*;
  - Doença da *Cladosporium*, causada, por exemplo, pela
- 15 *Cladosporium spp.*;
  - Doença da *Claviceps*, causada, por exemplo, pela *Claviceps purpurea*;
  - Doença da *Fusarium*, causada, por exemplo, pela *Fusarium culmorum*;
- 20 - Doença da *Gibberella*, causada, por exemplo, pela *Gibberella zae*;
- Doença da *Monographella*, causada, por exemplo, pela *Monographella nivalis*;
- 25 Doença da fuligem e dos esporos, tais como:
  - Doença da *Sphacelotheca*, causada, por exemplo, pela
- Sphacelotheca reiliana*;
  - Doença da *Tilletia*, causada, por exemplo, pela *Tilletia caries*;
  - Doença da *Urocystis*, causada, por exemplo, pela *Urocystis occulta*;

- Doença da Ustilago, causada, por exemplo, pela *Ustilago nuda*;
- Doenças da decomposição da fruta e do mofo, tais como:
  - Doença da Aspergillus, causada, por exemplo, pela *Aspergillus flavus*;
- 5
  - Doença da Botrytis, causada, por exemplo, pela *Botrytis cinerea*;
  - Doença da Penicillium, causada, por exemplo, pela *Penicillium expansum*;
  - Doença da Sclerotinia, causada, por exemplo, pela *Sclerotinia sclerotiorum*;
- 10
  - Doença da Verticilium, causada, por exemplo, pela *Verticilium alboatrum*;
- Decomposição da semente e dos habitantes do solo, doenças do mofo, apodrecimento da planta, decomposição e cacho seco:
  - Doença do Fusarium, causada, por exemplo, pela *Fusarium culmorum*;
  - Doença da Phytophthora, causada, por exemplo, pela *Phytophthora cactorum*;
  - Doença da Pythium, causada, por exemplo, pela *Pythium ultimum*;
- 20
  - Doença da Rhizoctonia, causada, por exemplo, pela *Rhizoctonia solani*;
  - Doença da Sclerotium, causada, por exemplo, pela *Sclerotium rolfsii*;
  - Doença da Microdochium, causada, por exemplo, pela *Microdochium nivale*;
- 25
  - Doenças do cancro, da giesta e da doença progressiva, tal como:
    - Doença da Nectria, causada, por exemplo, pela *Nectria galligena*;

Doenças da deterioração, tal como:

- Doença da Monilinia, causada, por exemplo, pela *Monilinia laxa*;

Doenças da pústula da folha ou do enrolamento da folha, tal

como:

5 - Doença da Taphrina, causada, por exemplo, pela *Taphrina deformans*;

Doença do declínio das plantas de madeira, tais como:

- Doença da Esca, causada, por exemplo, pela *Phaemoniella clamydospora*;

10 - Eutypa progressiva, causada, por exemplo, pela *Eutypa lata*;

- Doença do elmo, causada, por exemplo, pela *Ceratocystis ulmi*;

Doenças das flores e das sementes, tal como:

- Doença da Botrytis, causada, por exemplo, pela *Botrytis cinerea*;

Doenças do tubérculo, tal como:

15 - Doença da Rhizoctonia, causada, por exemplo, pela *Rhizoctonia solani*.

A composição fungicida ou inseticida de acordo com a presente invenção também pode ser utilizada contra as doenças fúngicas ou de insetos nocivos sujeitos a crescerem em ou dentro de troncos. O termo "tronco"

20 significa todos os tipos de espécies de madeira, e todos os tipos de trabalho nesta madeira pretendida para a construção, por exemplo, madeira sólida, madeira de alta densidade, madeira laminada e compensada. O método para o tratamento do tronco, de acordo com a presente invenção consiste principalmente em colocar em contato um ou mais compostos de acordo da

25 presente invenção ou uma composição de acordo com a presente invenção; isto inclui, por exemplo, a aplicação direta, aspersão, imersão, injeção ou quaisquer outros meios apropriados.

A dose do material ativo geralmente aplicada no método de

tratamento de acordo com a presente invenção é, em geral e vantajosamente, de 10 a 800 g/ha, de preferência, de 50 a 300 g/ha, para as aplicações no tratamento foliar. A dose de substância ativa aplicada é, em geral e vantajosamente, entre 2 e 200 g por 100 kg de semente, de preferência, entre 5 3 e 150 g por 100 kg de semente no caso do tratamento de semente.

Está claramente entendido que as doses indicadas no presente são dadas como exemplos ilustrativos do método da presente invenção. Um técnico no assunto irá saber como adaptar as doses de aplicação, notadamente, de acordo com a natureza da planta ou cultura a ser tratada.

10 A composição fungicida de acordo com a presente invenção também pode ser utilizada no tratamento de organismos geneticamente modificados com os compostos de acordo com a presente invenção ou as composições agroquímicas de acordo com a presente invenção. As plantas geneticamente modificadas são plantas no genoma das quais um gene heterólogo que codifica uma proteína de interesse foi integrado de maneira estável. A expressão "gene heterólogo que codifica uma proteína de interesse" significa essencialmente genes que fornecem à 15 planta transformada novas propriedades agronômicas, ou genes para o melhoramento da qualidade agronômica da planta modificada.

As composições ou misturas de acordo com a presente invenção 20 também podem ser utilizadas para a preparação da composição útil para tratar de maneira curativa ou preventiva as doenças fúngicas animais ou humanas tais como, por exemplo, micoses, dermatoses, doenças de *Trichophyton* e candidíases ou doenças causadas por *Aspergillus* spp., por exemplo, *Aspergillus fumigatus*.

25 Os diversos aspectos da presente invenção serão agora ilustrados com referência às seguintes tabelas de compostos e exemplos. As seguintes tabelas ilustram de um modo não limitante os exemplos de compostos de acordo com a presente invenção.

Nos seguintes exemplos,  $M + 1$  (ou  $M - 1$ ) significa o pico de íon molecular, mais ou menos 1 a.m.u. (unidade de massa atômica) respectivamente, conforme observado na espectrometria de massa e  $M$  (Apcl+) significa o pico de íon molecular como ele foi encontrado por meio da ionização química da pressão atmosférica positiva na espectroscopia de massa.

Nos seguintes exemplos, os valores de  $\log P$  foram determinados de acordo com a Diretriz EEC 79/831 Annex V. A8 por HPLC (Cromatografia Líquida de Alta Performance) em uma coluna de fase reversa (C 18), utilizando o método descrito abaixo:

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

A calibração foi realizada utilizando alcan-2-onas não ramificadas (compreendendo de 3 a 16 átomos de carbono) com valores de  $\log P$  conhecidos (determinação dos valores de  $\log P$  pelos tempos de retenção 15 utilizando a interpolação linear entre duas alcanonas sucessivas).

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

Os seguintes exemplos ilustram de uma maneira não limitante a preparação e a eficácia dos compostos de Fórmula (I) de acordo com a 20 presente invenção.

**PREPARAÇÃO DO EXEMPLO 1: N'-(2,5-DIMETIL-4-[2(METIL-FENIL-AMINO)-PIRIMIDIN-4-ILÓXI]-FENIL)-N-ETIL-N-METIL-FORMAMIDINA – PROCESSO (D2) – COMPOSTO (V) A**

**COMPOSTO (I)**

Foi adicionado a uma mistura de 252 mg (0,7 mmol) de [4-(4-amino-2,5-dimetil-fenóxi)-pirimidin-2-il]-metil-fenil-amina e 4 mL de 25 trimetóximetano, 20 mg de ácido *p*-tolueno sulfônico. A mistura de reação foi refluxada por 2 horas e concentrada em vácuo. A mistura foi dissolvida em 10 mL de diclorometano e 62 mg (1,05 mmol) de metil etil amina foram

adicionados. Após agitação de 18 horas à temperatura ambiente, a mistura foi evaporada e rendeu 280 mg (89%) com uma pureza de 87%; log P (pH = 2,3) = 1,61.

Preparação do material de partida:

5 **4-(2-CLORO-PIRIMIDIN-4-ILÓXI)-2,5-DIMETIL-FENILAMINA – PROCESSO (C) –**

**COMPOSTO (VI) A COMPOSTO (V)**

Foi adicionada uma solução de 7,55 g (55 mmol) de 4-amino-2,5-dimetilfenol e 2,4 g de NaOH (2M) em 30 mL de água, gota a gota a uma solução de 7,45 g (50 mmol) de 2,4 dicloropirimidina em 50 mL de acetona. A 10 mistura de reação foi agitada por 20 horas à temperatura ambiente. Após a concentração em vácuo e a adição de 150 mL de água, o precipitado formado foi filtrado por sucção. Rendeu 10,6 g (75%) com uma pureza de 88% de log P (pH = 2,3) = 1,37.

**[4-(4-AMINO-2,5-DIMETIL-FENÓXI)PIRIMIDIN-2-IL]-METIL-FENIL-AMINA – COMPOSTO (V)**

15 Foi agitada uma solução de 2,50 g (10 mmol) de 4-amino(2-cloro-pirimidin-4-ilóxi)-2,5-dimetil-fenilamina e 2,14 g de N-metilanilina (20 mmol) em 50 mL de ácido clorídrico por 20 h a 80° C. Após o resfriamento à temperatura ambiente, 50 mL de acetato de etila foi adicionado e a camada orgânica foi separada. A camada de água foi deixada em pH 8 com carbonato de sódio e o 20 precipitado formado foi filtrado por sucção e lavado com hexano. Após a separação, a camada orgânica foi concentrada em vácuo e a cromatografia em coluna (diclorometano) rendeu 380 mg (11%) com uma pureza de 89% de log P (pH = 2,3) = 1,72.

**PREPARAÇÃO DO EXEMPLO 2: N’-[4-[2-(3-CLORO-2-METIL-FENÓXI)-PIRIMIDIN-4-**

25 **ILÓXI]-2,5-DIMETIL-FENIL]-N-ETIL-N-METIL-FORMAMIDINA – PROCESSO (D1) –**

**COMPOSTO (V) A COMPOSTO (I)**

Foi adicionada uma mistura de 293 mg (0,7 mmol) de 4-amino-[2-(3-cloro-2-metil-fenóxi)-pirimidin-4-ilóxi]-2,5-dimetil-fenilamina em 20 mL de

metanol, 182 mg (1,05 mmol) de N-(dimetoximetil)-N-metil-etanamina (77% pura). A mistura de reação foi agitada por 20 horas à 45º C. A mistura de reação foi seca com sulfato de magnésio concentrado em vácuo e rendeu 290 mg (76%) com uma pureza de 78% de  $\log P$  ( $\text{pH} = 2,3$ ) = 2,08.

## 5 Preparação do material de partida:

**4-[2-(3-CLORO-2-METIL-FENÓXI)-PIRIMIDIN-4-ILÓXI]-2,5-DIMETIL-FENILAMINA –  
COMPOSTO (V)**

Foi agitada uma solução de 1,43 g (10 mmol) de 3-cloro-2-metil-fenol e 0,4 g de hidreto de sódio (60% em parafina, 10 mmol) em 20 mL de THF 10 por 30 min a temperatura ambiente. Após a adição de 1,25 g (5 mmol) de 4-[2-cloro-pirimidin-4-ilóxi]-2,5-dimetil-fenilamina, a mistura foi agitada por 20 horas a 60º C. Após o resfriamento à temperatura ambiente, 20 mL de água foi adicionado e a camada orgânica foi separada, seca com sulfato de magnésio, concentrada em vácuo e a cromatografia em coluna (ciclohexano/ acetato de etila, 2:1) rendeu 15 640 mg (30%) com uma pureza de 85% de log P (pH = 2,3) = 2,81.

O 4-(2-cloro-pirimidin-4-ilóxi)-2,5-dimetil-fenilamina é preparado de acordo com a preparacão do Exemplo 1.

**PREPARAÇÃO DO EXEMPLO 3: N'-{4-[{2-CLORO-6-METILPIRIMIDIN-4-IL}ÓXI]-2,5-DIMETILFENIL}-N-ETIL-N-METILIMIDO-FORMAMIDA – PROCESSO (D1) – COMPOSTO (V)**

20 A COMPOSTO (I)

Foi adicionada uma mistura de 310 mg (0,8 mmol) de 4-[(2-cloro-6-metilpirimidin-4-il)-óxi]-2,5-dimetil-anilina em 20 mL de acetonitrila, 208 mg (1,5 mmol) de N-(dimetóximetil)-N-metiletanamina (77% pura). A mistura de reação foi refluxada por 20 horas. A mistura de reação foi concentrada em 25 vácuo, diluída com acetato de etila e lavada com água. A camada orgânica foi seca com sulfato de magnésio e concentrada em vácuo e rendeu 220 mg (59%) com uma pureza de 72% de log P (pH = 2,3) = 1,45.

### Preparação do material de partida:

4-(2-CLORO-PIRIMIDIN-4-ILÓXI)-2,5-DIMETIL-FENILAMINA – PROCESSO (C) –COMPOSTO (VI) A COMPOSTO (V)4-[(2-CLORO-6-METILPIRIMIDIN-4-IL)ÓXI]-2,5-DIMETILANILINA

Uma solução de 4,53 g (33 mmol) 4-amino-2,5-dimetilfenol e 1,44 g de NaOH (2M) em 30 mL de água foi adicionada gota a gota a uma solução de 4,89 g (30 mmol) de 2,4-dicloropirimidina em 50 mL de acetona. A mistura de reação foi agitada por 20 horas à temperatura ambiente. Após a concentração em vácuo e a adição de 250 mL de água, a mistura foi extraída com acetato de etila. A camada orgânica foi seca com sulfato de magnésio e concentrada em vácuo e rendeu 5,10 g (52%) com uma pureza de 81% de log P (pH = 2,3) = 1,62.

PREPARAÇÃO DO EXEMPLO 89: N'-[4-(5-CLORO-4-[ETIL(METIL)AMINO]PIRIMIDIN-2-IL)ÓXI]-2,5-DIMETILFENIL]-N-ETIL-N-METILIMIDOFORMAMIDA – PROCESSO (D2) –COMPOSTO (V) A COMPOSTO (I)

A uma mistura de 320 mg (1,0 mmol) de 2-(4-amino-2,5-dimetilfenóxi)-5-cloro-N-etyl-N-metilpirimidin-4-amina e 4 mL de trimetóximetano, 20 mg de ácido *p*-tolueno sulfônico foi adicionado. A mistura de reação foi refluxada por 2 horas e concentrada em vácuo. A mistura foi dissolvida em 10 mL de diclorometano e 89 mg (1,5 mmol) de metil etil amina foi adicionada. Após agitação por 18 horas à temperatura ambiente, a mistura foi evaporada e rendeu 310 (78%) com uma pureza de 95 log P (pH = 2,3) = 1,82.

Preparação do material de partida:

2-(4-AMINO-2,5-DIMETILFENÓXI)-5-CLORO-N-ETIL-N-METILPIRIMIDIN-4-AMINA –PROCESSO (B) – COMPOSTO (IV) A COMPOSTO (V)

A uma solução de 8,86 g (20 mmol) de 5-cloro-2-(2,5-dimetil-4-nitrofenóxi)-N-etyl-N-metilpirimidin-4-amina em 50 mL de ácido clorídrico e 50 mL de metanol, 13,5 g (60 mmol) de diidrato de estanho-(II)-dicloro foi

5 adicionado e a mistura foi refluxada por 4 horas. Após o resfriamento à temperatura ambiente, o precipitado formado foi filtrado por sucção, dissolvido em água e trazido à pH 8 com solução aquosa de hidróxido de sódio. O acetato de etila foi adicionado e a camada orgânica foi separada, seca com sulfato de magnésio, concentrada em vácuo e a comatografia em coluna (ciclohexano/acetato de etila, 1:1) rendeu 4,6 g (72%) com uma pureza de 96% log P (pH = 2,3) = 1,88.

**5-CLORO-2-(2,5-DIMETIL-4-NITROFENÓXI)-N-ETIL-N-METILPIRIMIDIN-4-AMINA –**

**PROCESSO (A) – COMPOSTO (II) A COMPOSTO (IV)**

10 A uma solução de 16,8 g (40 mmol) de 2,5-dicloro-N-etil-N-metilpirimidin-4-amina, 7,35 g de 4-nitro-2,5-dimetilfenol (44 mol) e 8,29 g de carbonato de potássio (60 mmol) em 70 mL de DMF foi agitada por 20 horas a 100° C. Após a adição da mistura a 150 ml de água, a suspensão resultante foi extraída duas vezes com 50 mL de diclorometano. As 15 camadas orgânicas combinadas foram lavadas com solução aquosa de hidróxido de sódio. A camada orgânica foi seca com sulfato de magnésio, concentrada em vácuo e a comatografia em coluna (diclorometano) rendeu 8,3 g (47%) com uma pureza de 76% log P (pH = 2,3) = 4,07.

20 As cloro pirimidinas substituídas por 4-amino podem ser preparadas pelos métodos conhecidos, por exemplo, descritos no Polish Journal of Chemistry (1980), 54(7-8), 1557-62.

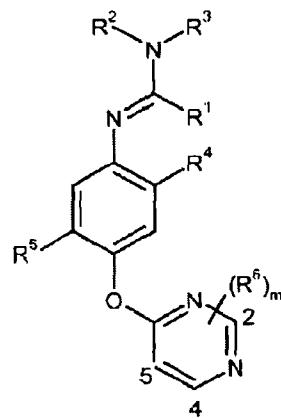


TABELA 1

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	LogP <sub>a</sub>
1	H	Et	Me	Me	Me	2-NMePh	1,61
2	H	Et	Me	Me	Me	2-O-(2-metil-3-clorofenil)	2,08
3	H	Et	Me	Me	Me	2-Cl; 4-Me	1,45
4	H	Et	Me	Me	Me	4- <i>t</i> Bu	1,98 <sup>a</sup>
5	H	Et	Me	Me	Me	4-O-(3-trifluorometil-fenil)	4,35 <sup>a</sup>
6	H	Et	Me	Me	Me	4-(3-trifluorometil-fenil)	3,19 <sup>a</sup>
7	H	Et	Me	Me	Me	4-CF <sub>3</sub>	1,85 <sup>a</sup>
8	H	Et	Me	Me	Me	4-O-(2-metil-3-clorofenil); 5-Me	2,6
9	H	Et	Me	Me	Me	4-O-(3- <i>t</i> Bu-fenil)	4,9 <sup>a</sup>
10	H	Et	Me	Me	Me	2-NMeEt	0,82
11	H	Et	Me	Me	Me	2-OMe	1,16
12	H	Pr	Me	Me	Me	2-OMe	1,38
13	H	Et	Me	Me	Me	2-NMePr	1,25
14	H	Et	Me	Me	Me	2-N-imidazolinil	0,82
15	H	Et	Me	Me	Me	4-Cl	1,4
16	H	Pr	Me	Me	Me	4-Cl	1,56
17	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	4-Cl	1,54
18	H	Pr	Me	Me	Me	2-O-(2-metil-3-clorofenil)	2,21
19	H	Et	Me	Me	Me	2-N-morfolino	1,3
20	H	Pr	Me	Me	Me	2-N-morfolino	3,13
21	H	Et	Me	Me	Me	2-N-piperidino	1,4
22	H	Pr	Me	Me	Me	2-N-piperidino	1,58
23	H	Et	Me	Me	Me	2-Cl	1,3
24	H	Pr	Me	Me	Me	2-Cl	1,44
25	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-Cl	1,4
26	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-OMe	1,4

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	LogP <sub>a</sub>
27	H	Et	Me	Me	Me	2-Cl; 5-Me	1,42
28	H	Pr	Me	Me	Me	2-Cl; 5-Me	1,68
29	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-N-(3-clorofenil)	2,04
30	H	Et	Me	Me	Me	2-N-(3-clorofenil)	1,94
31	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-N-imidazolinil	1,01
32	H	Pr	Me	Me	Me	2-Cl; 4-Me	1,62
33	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-N-morfolino	1,46
34	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-N-piperidino	1,56
35	H	Et	Me	Me	Me	2-OPh	1,68
36	H	Pr	Me	Me	Me	2-OPh	1,87
37	H	Et	Me	Me	Me	2-NMe <sub>2</sub>	0,66
38	H	Pr	Me	Me	Me	2-NMe <sub>2</sub>	0,89
39	H	Et	Me	Me	Me	4-OMe	1,32
40	H	Pr	Me	Me	Me	4-OMe	1,47
41	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-Cl; 4-Me	1,57
42	H	Pr	Me	Me	Me	4-NMeEt	1,6
43	H	Et	Me	Me	Me	4-NMeEt	1,46
44	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-OEt	1,62
45	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	4-NMeEt	1,56
46	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	2-Cl; 5-Me	1,62
47	H	Et	Me	Me	Me	2-OEt	1,47
48	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	4-OMe	1,49
49	H	Et	Me	Me	Me	4-NMePr	1,74
50	H	Pr	Me	Me	Me	2-OEt	1,55
51	H	Pr	Me	Me	Me	4-NMePr	1,79
52	H	Pr	Me	Me	Me	2-N-(3-clorofenil)	2,06
53	H	<i>i</i> Pr	Me	Me	Me	4-NMePr	1,77

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	LogP <sub>a</sub>
54	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-NEt	0,98
55	H	Et	Me	Me	Me	2-NEt	0,72
56	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-NPr	1,13
57	H	Et	Me	Me	Me	2-NPr	0,97
58	H	Et	Me	Me	Me	2-NMe	0,44
59	H	Et	Me	Me	Me	2-tBu; 4-Cl	2,61
60	H	iPr	Me	Me	Me	2-tBu; 4-Cl	2,8
61	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-NMePh	1,84
62	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-NMe	0,87
63	H	Me	Me	Me	Me	2-PhO	1,65
64	H	Et	Me	Me	Me	2,5-Cl <sub>2</sub>	1,67
65	H	Et	Me	Me	Me	2-(3-Cl-PhO)	2,04
66	H	iPr	Me	Me	Me	2-PhO	1,81
67	H	Pr	Me	Me	Me	2-(3-Cl-PhO)	2,14
68	H	iPr	Me	Me	Me	2-(3-Cl-PhO)	2,12
69	H	Et	Me	Me	Me	2,4-Cl <sub>2</sub>	1,67
70	H	Et	Me	Me	Me	2-(3,4-F <sub>2</sub> -PhO)	1,93
71	H	Et	Me	Me	Me	2-(3,4-MeO-PhO)	1,65
72	H	Et	Me	Me	Me	2-PhO	1,96
73	H	Et	Me	Me	Me	2-PhO-4-Me	1,99
74	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-(3,4-MeO-PhO)	1,80
75	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-PhO-4-Me	2,09
76	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-PhO	2,02
77	H	Et	Me	Me	Me	2-(4-tBu-PhO)	2,65
78	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-(4-tBu-PhO)	2,75
79	H	Et	Me	Me	Me	2-(3-Me-PhO)	2,02
80	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-(3-Me-PhO)	2,16

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	LogP <sub>a</sub>
81	H	Et	Me	Me	Me	2-(4-Cl-PhO)	2,11
82	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-(4-Cl-PhO)	2,18
83	H	Et	Me	Me	Me	4-Et; 5-Cl	1,91
84	H	Pr	Me	Me	Me	4-Et; 5-Cl	1,99
85	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	4-Et; 5-Cl	1,98
86	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	4-Et; 5-Cl	1,87
87	H	Et	Me	Me	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -PhO)	2,37
88	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -PhO)	2,49

<sup>a</sup>logP<sub>a</sub> medido a pH = 4

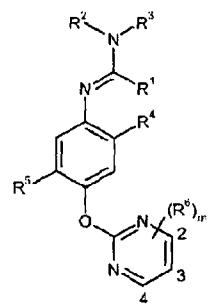


TABELA 2

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	logP <sub>a</sub>
89	H	Et	Me	Me	Me	2-NMeEt; 3-Cl	1,82
90	H	Et	Me	Me	Me	2-CF <sub>3</sub>	0,22 <sup>a</sup>
91	H	Et	Me	H	H	2-CF <sub>3</sub> ; 4-iPr	367 <sup>a</sup>
92	H	Et	Me	Me	iPr	2-CF <sub>3</sub>	1,10 <sup>a</sup>
93	H	Et	Me	Me	Me	2-Me; 3-Me	1,19
94	H	Pr	Me	Me	Me	2-Me; 3-Me	1,4
95	H	Et	Me	Me	Me	3-Cl	1,32
96	H	Pr	Me	Me	Me	3-Cl	1,48
97	H	iPr	Me	Me	Me	3-Cl	1,41
98	H	Pr	Me	Me	Me	2-CF <sub>3</sub>	1,7

No	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	logP <sub>a</sub>
99	H	iPr	Me	Me	Me	2-NMeEt; 3-Cl	1,98
100	H	Pr	Me	Me	Me	2-NMeEt; 3-Cl	1,95
101	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		Me	Me	2-NMeEt; 3-Cl	1,93
102	H	Et	Me	Me	Me	2-PhO	1,82
103	H	Et	Me	Me	Me	2-(3-Cl-PhO)	2,13

<sup>a</sup>logP<sub>a</sub> medido a pH = 4

<sup>b</sup>(M+1) – espectroscopia de massa medida.

**EFICÁCIA DO EXEMPLO A: TESTE PREVENTIVO IN VIVO EM PUCCINIA RECONDITA F. SP.**

**TRITICI (FERRUGEM MARROM DO TRIGO)**

5 Solvente: 50 partes em peso de N,N-dimetilacetamida  
Emulsificante: 1 parte em peso de éter de poliglicol de alquilarila

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades 10 determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água à concentração desejada.

Para o teste da atividade preventiva, as plantas jovens são 15 inoculadas com uma suspensão de esporos de *Puccinia recondita* em uma solução de agar aquosa de 0,1% de força. Após o revestimento do spray ter secado, as plantas são pulverizadas com a preparação do composto ativo na taxa determinada de aplicação. As plantas permaneceram por 24 horas em uma câmara de inoculação a 20° C e uma umidade atmosférica relativa de 100%.

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

O teste é avaliado 10 dias após a inoculação. 0% significa uma

eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

Neste teste, os seguintes compostos de acordo com a presente invenção mostraram uma eficácia de 70% ou mesmo maior em uma concentração de 1.000 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 10, 11, 13, 15, 18, 19, 21, 22, 23, 26, 30, 31, 32, 33, 34, 37, 38, 39, 41, 43, 46, 47, 49, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 62, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 73, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 87, 88, 89, 99, 101.

#### EFICÁCIA DO EXEMPLO B: TESTE PREVENTIVO *IN VIVO* EM *ERYSIPHE GRAMINI* (ÓDIO

##### 10 DA CEVADA)

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

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

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo ou da combinação do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água à concentração desejada.

Para o teste da atividade preventiva, as plantas jovens são pulverizadas com uma preparação do composto ativo ou uma combinação do composto ativo na taxa determinada de aplicação.

20 Após o revestimento do spray ter secado, as plantas são pulverizadas com esporos de *Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*.

As plantas são colocadas em estufa em uma temperatura de cerca de 20º C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 80% para promover o desenvolvimento de pústulas de ódio.

25 O teste é avaliado 7 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

Neste teste, os seguintes compostos de acordo com a presente

invenção mostraram uma eficácia de 70% ou mesmo maior em uma concentração de 1.000 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 5, 7, 8, 10, 11, 13, 15, 18, 19, 21, 23, 30, 32, 33, 37, 38, 41, 47, 49, 55, 58, 59, 60, 61, 89, 90, 101.

**EFICÁCIA DO EXEMPLO C: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM *ALTERNARIA SOLANI***

5

**(MANCHA FOLIAR DO TOMATE)**

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

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

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água à concentração desejada.

Para o teste da atividade de proteção, as plantas jovens são pulverizadas com uma preparação do composto ativo na taxa determinada de aplicação. Após o revestimento do spray ter secado, as plantas são inoculadas com 15 uma suspensão aquosa de esporos de *Alternaria solani*. As plantas permanecem por um dia em uma incubadora a cerca de 20° C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 100%. Então, as plantas são colocadas em uma incubadora a cerca de 20° C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 96%.

O teste é avaliado 7 dias após a inoculação. 0% significa uma 20 eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

Neste teste, os compostos com relação à presente invenção da fórmula seguinte revelaram uma eficácia de 70% ou mesmo maior em uma concentração de 500 ppm de ingrediente ativo: 1, 4, 10.

25

**EFICÁCIA DO EXEMPLO D: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM *PODOSPHAERA***

**LEUCOTRICA (MAÇÃS)**

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes de dimetilacetamida

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

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades 5 determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água à concentração desejada.

Para o teste da atividade de proteção, as plantas jovens são pulverizadas com uma preparação do composto ativo na taxa determinada de aplicação. Após o revestimento do spray ter secado, as plantas são inoculadas 10 com uma suspensão aquosa de esporos do agente causador do ódio da maçã (*Podosphaera leucotricha*). As plantas são então colocadas em uma estufa a cerca de 23º C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 70%.

O teste é avaliado 10 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 15 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção das seguintes estruturas mostraram uma eficácia de 70% ou mesmo maior em uma concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 1, 4, 5, 7, 10, 13, 35, 61, 81, 82, 87, 88, 92.

20 **EFICÁCIA DO EXEMPLO E: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM SPHAEROTECA FULIGINEA**

**(PEPINOS)**

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de éter de poliglicol alquilarila

25 Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água à concentração desejada.

Para o teste da atividade de proteção, as plantas jovens são pulverizadas com uma preparação do composto ativo na taxa determinada de aplicação. Após o revestimento do spray ter secado, as plantas são inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos de *Sphaeroteca fuliginea*. As plantas 5 são então colocadas em uma estufa a cerca de 23° C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 70%.

O teste é avaliado 7 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

10 Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção das seguintes estruturas mostraram uma eficácia de 70% ou mesmo maior em uma concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 13, 30, 41, 47, 59, 60, 61, 67, 70, 78, 79, 81, 82, 87, 88, 92.

#### EFICÁCIA DO EXEMPLO F: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM *UROMYCES*

15 APPENDICULATUS (FEIJÕES)

Solvente: 24,5 partes em peso de acetona

24,5 partes de dimetilacetamida

Emulsificante: 1 parte em peso de éter de poliglicol alquilarila

20 Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água à concentração desejada.

Para o teste com relação à atividade de proteção, as plantas 25 jovens são pulverizadas com uma preparação do composto ativo na taxa determinada de aplicação. Após o revestimento do spray ter secado, as plantas são inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos do agente causador da ferrugem do feijão (*Uromyces appendiculatus*) e então

permanecem por 1 dia em uma incubadora a cerca de 20° C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 100%.

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

5 O teste é avaliado 10 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

Neste teste, os compostos de acordo com a presente invenção das seguintes estruturas mostraram uma eficácia de 70% ou mesmo maior  
10 em uma concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 41, 47, 49, 59, 60, 70, 81, 82, 87, 88.

**EFICÁCIA DO EXEMPLO G: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM *MYZUS PERSICAE*;**

**(MYZUPE)**

Solvente: 78 partes em peso de acetona

15 1,5 parte de dimetilformamida

Corante: 0,5 parte em peso de éter de poliglicol alquilarila

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com 20 água contendo emulsificante à concentração desejada.

Discos de folhas de couve chinesa (*Brassica pekinensis*) infectadas com todas as fases do afídio do pêssego verde (*Myzus persicae*), são pulverizados com uma preparação do ingrediente ativo na concentração desejada.

Após o período de tempo especificado, a mortalidade em % é 25 determinada. 100% significa que todos os afídios foram exterminados; 0% significa que nenhum dos afídeos foi morto.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostraram uma boa atividade: 36, 41, 65.

**EFICÁCIA DO EXEMPLO H: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM *PHAEDON COCHLEARIAE***  
**(PHAECHO)**

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

5 Corante: 0,5 parte em peso de éter de poliglicol alquilarila

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água contendo emulsificante à concentração desejada.

10 Os discos de folha de repolho chinês (*Brassica pekinesis*) são pulverizados com uma preparação do ingrediente ativo na concentração desejada. Uma vez seca, as seções da folha são infestadas com larvas do besouro da mostarda (*Phaedon cochleariae*).

15 Após o período de tempo especificado, a mortalidade em % é determinada. 100% significa que todos os ovos foram exterminados e 0% significa que nenhuma das larvas de besouro foi morta.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostraram uma boa atividade: 18.

**EFICÁCIA DO EXEMPLO H: TESTE DE PROTEÇÃO IN VIVO EM *TETRANYCHUS URTICAE***

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

Corante: 0,5 parte em peso de éter de poliglicol alquilarila

Para produzir uma preparação apropriada do composto ativo, 1 parte em peso do composto ativo é misturada com as quantidades determinadas do solvente e do emulsificante, e o concentrado é diluído com água contendo emulsificante à concentração desejada.

Os feijões francês (*Phaseolus vulgaris*) que foram infestados em

grande quantidade com todos os estágios do ácaro rajado (*Tetranychus urticae*), são pulverizados com uma preparação do ingrediente ativo na concentração desejada.

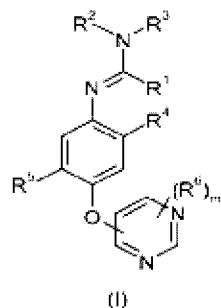
Após o período de tempo especificado, a mortalidade em % é 5 determinada. 100% significa que todos os ácaros rajados foram extermínados e 0% significa que nenhum dos ácaros rajados foi morto.

Neste teste, por exemplo, os seguintes compostos dos exemplos de preparação mostraram uma boa atividade: 37.

### REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO DERIVADO DE FENIL-AMIDINA,

caracterizado pelo fato de ser de fórmula (I):



em que:

- 5 - R¹ representa H, uma alquila C₁-C₁₂, uma alquenila C₂-C₁₂, uma alquinila C₂-C₁₂, SH ou uma alquila S-C₁-C₁₂;
- R² representa uma alquila C₁-C₁₂;
- R³ representa uma alquila C₂-C₁₂, uma cicloalquila C₃-C₆, uma alquenila C₂-C₁₂, uma alquinila C₂-C₁₂, uma halogenoalquila C₁-C₁₂; ou
- 10 - R¹ e R², R¹ e R³ ou R² e R³ podem formar juntos um heterociclo de 5 a 7 membros;
- R⁴ representa uma alquila C₁-C₁₂, um átomo de halogênio, uma halogenoalquila C₁-C₁₂, uma alquila O-C₁-C₁₂ ou ciano;
- R⁵ representa H, uma alquila C₁-C₁₂, um átomo de halogênio, 15 uma halogenoalquila C₁-C₁₂, uma alquila O-C₁-C₁₂ ou ciano;
- R⁶ representa H, halogênio, CN, fenóxi, uma alquila C₁-C₁₂, uma halogenoalquila C₁-C₁₂, OR⁷, SR⁷, trialquilsilil, COOR⁷, C(R⁷)=NOR⁷; NR⁷R⁸;
- R⁷, R⁸ representam independentemente H, uma alquila C₁-C₁₂, arila ou R⁷ e R⁸ podem formar um heterociclo de 5 a 7 membros saturados ou 20 não saturados, incluindo um ou mais átomos selecionados na lista que consiste em O, N e S;
- m representa 1, 2 ou 3;

bem como sais, N-óxidos, complexos metálicos, complexos

metalóidicos e seus isômeros opticamente ativos.

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

- R<sup>1</sup> representa H, alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> ou SH; ou
- R<sup>2</sup> representa metila; ou
- R<sup>3</sup> representa alquila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>, alquenila C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>, cicloalquila C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

ou

- R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> podem formar juntos um heterociclo de 5 a 7 membros;

ou

- R<sup>4</sup> representa alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> ou um átomo de halogênio; ou
- R<sup>5</sup> representa H, uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, um átomo de halogênio, uma halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, uma alquila O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> ou CN; ou
- R<sup>6</sup> que pode ser o mesmo ou diferente representa H, halogênio, CN, fenóxi, alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, uma halogenoalquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>, OR<sup>7</sup>, SR<sup>7</sup>, trialquilsilil, COOR<sup>7</sup>, C(R<sup>7</sup>)=NOR<sup>7</sup>; NR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>.

3. COMPOSTO, de acordo com as reivindicações 1 a 2, caracterizado pelo fato de que:

- R<sup>1</sup> representa alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>; ou
- R<sup>3</sup> representa uma alquila C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> não substituída, alquenila C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> ou ciclopropila; ou
- R<sup>2</sup> e R<sup>3</sup> podem formar juntos um heterociclo de 6 membros; ou
- R<sup>4</sup> representa alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> não substituída ou um átomo de cloro; ou
- R<sup>6</sup> representa uma alquila C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub> ramificada.

4. COMPOSTO, de acordo com as reivindicações 1 a 3, caracterizado pelo fato de que:

- R<sup>1</sup> representa metila; ou
- R<sup>3</sup> representa etila, *n*-propila, *i*-propila, propenila ou alila; ou

-  $R^2$  e  $R^3$  podem formar juntos uma pipiridinila ou uma pirolidinila;

ou

-  $R^4$  representa metila.

5. COMPOSTO, de acordo com as reivindicações 1 a 4,

5 caracterizado pelo que  $R^2$  e  $R^3$  formam juntos uma bis-alquil-pirolidinila.

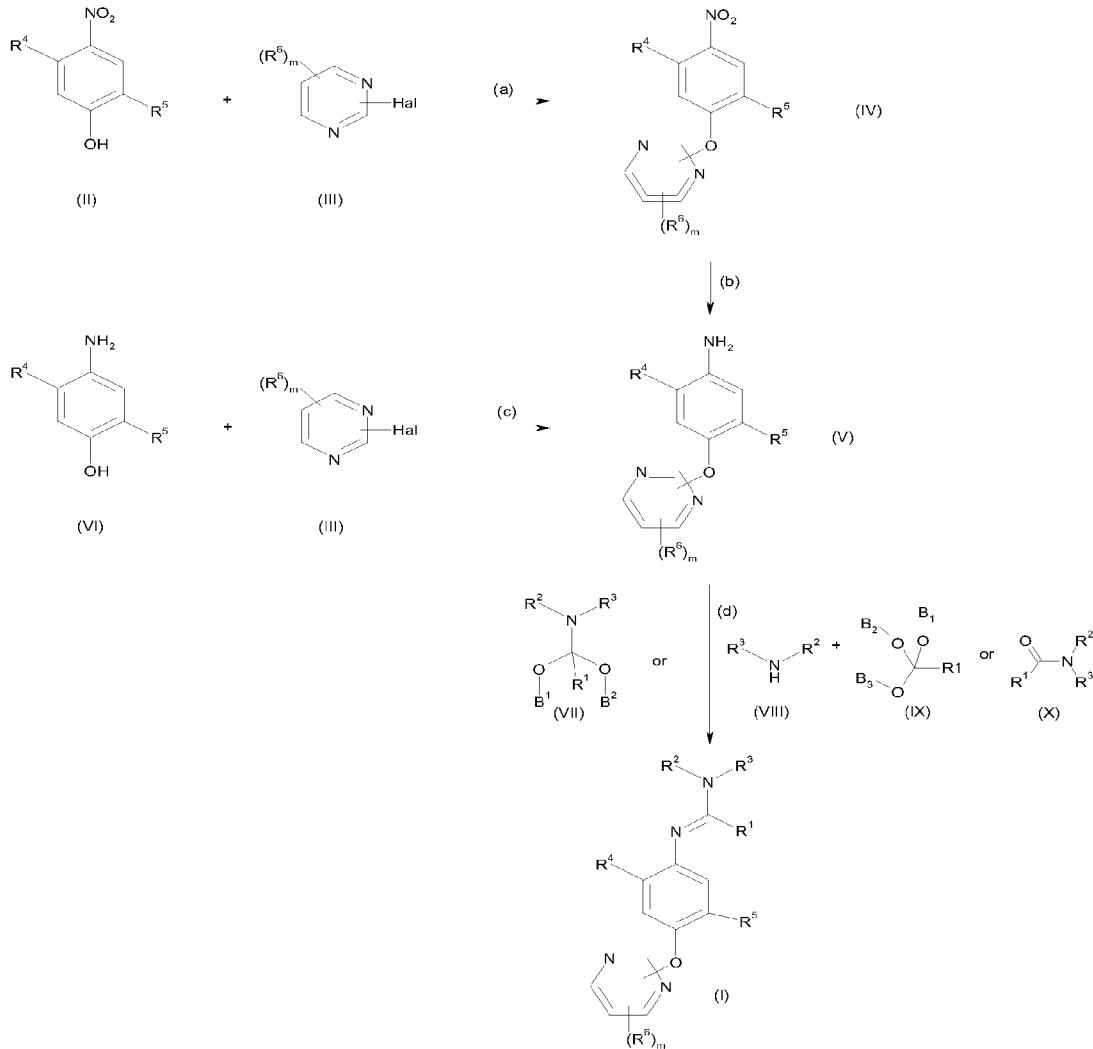
6. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 5,

caracterizado pelo fato de que  $R^2$  e  $R^3$  formam juntos uma bis-metil-pirolidinila.

7. PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE UM COMPOSTO

de fórmula (I) conforme descrito nas reivindicações de 1 a 6, caracterizado pelo

10 fato de que compreende as seguintes etapas:



em que:

- $R^1$  a  $R^6$  são conforme definidos em uma das reivindicações

1 a 6;

- $B^1$ ,  $B^2$  e  $B^3$  na fórmula (IX) representam alquila;
- $B^1$  e  $B^2$  na fórmula (VII) representam alquila ou, juntos,

5 cicloalquila.

8. MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS

FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS, caracterizado pelo fato de que uma quantidade eficaz em agricultura e substancialmente não fitotóxica de um composto conforme descrito nas reivindicações de 1 a 6, é aplicada no solo  
10 onde as plantas crescem ou são capazes de crescer, nas folhas ou no fruto das plantas ou nas sementes das plantas.

9. MÉTODO PARA O CONTROLE DE INSETOS NOCIVOS,

caracterizado pelo fato de que um composto de fórmula (I) conforme descrito nas reivindicações de 1 a 6, é aplicado nas sementes, na planta ou no fruto da  
15 planta ou no solo em que a planta está crescendo ou em que é desejável que ela cresça.

**RESUMO**

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

5

A presente invenção refere-se aos derivados de 2,5-dissubstituído-4-pirimidinil-substituído-fenil-amidina de fórmula (I) em que os substituintes são conforme a descrição, notadamente aos derivados de 2,5-dialquil-4-pirimidinil-substituído-fenil-amidina, ao seu processo de preparação, 10 ao seu uso como agentes ativos fungicidas ou inseticidas, em particular, na forma de composições fungicidas ou inseticidas, e aos métodos para o controle de fungos fitopatogênicos ou insetos nocivos, notadamente de plantas, utilizando estes compostos ou composições.