



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

(11) PI 1006006-5 B1

(22) Data do Depósito: 16/02/2010

(45) Data de Concessão: 22/05/2018



★ B R P I 1 0 0 6 0 0 6 B 1 ★

(54) Título: COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO FUNGICIDA E MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS

(51) Int.Cl.: C07D 207/36; C07D 231/18; C07D 277/20; A01N 43/24; A01N 43/36; A01P 3/00

(52) CPC: C07D 207/36, C07D 231/18, C07D 277/20, A01N 43/24, A01N 43/36

(30) Prioridade Unionista: 17/02/2009 EP 09356011.8, 23/09/2009 EP 09356054.8

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

(72) Inventor(es): JÜRGEN BENTING; PETER DAHMEN; PHILIPPE DESBORDES; STÉPHANIE GARY; MARIE-CLAIRE GROSJEAN-COURNOYER; PHILIPPE RINOLFI; ULRIKE WACHENDORFF-NEUMANN

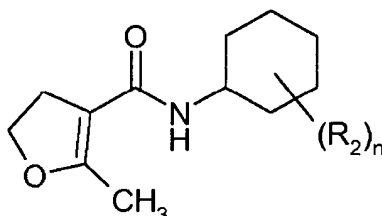
“COMPOSTOS, COMPOSIÇÃO FUNGICIDA E MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS”

CAMPO DA INVENÇÃO

A presente invenção refere-se a fungicidas N-
5 (fenilcicloalquil)carboxamida ou N-(benzilcicloalquil)carboxamida ou seus
derivados tiocarboxamida, aos seus processos de preparação e aos compostos
intermediários para sua preparação, suas utilizações como fungicida, em
particular na forma de composições fungicidas, e aos métodos para o controle
de fungos fitopatogênicos das plantas utilizando estes compostos ou suas
10 composições.

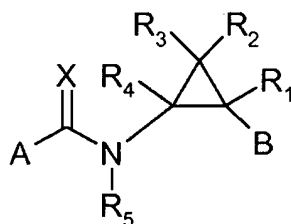
ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

No pedido de patente internacional WO 1998/03495,
determinados derivados fungicidas de N-(fenilciclohexil)carboxamida são
genericamente englobados em uma ampla descrição dos numerosos
15 compostos da seguinte fórmula:



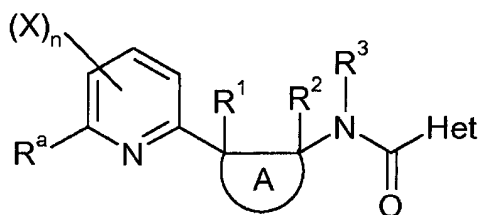
em que R_2 pode representar um grupo arila substituído ou um
grupo aralquila substituído e n pode ser 1. No entanto, este documento não
descreve os compostos em que o átomo de nitrogênio do resíduo carboxamida
pode ser substituído por um grupo cicloalquila.

20 No pedido de patente internacional WO 2007/134799,
determinados derivados fungicidas do N-(fenilciclopropil)(tio)carboxamida são
genericamente englobados em uma ampla descrição dos numerosos
compostos da seguinte fórmula:



em que A pode representar um anel heterocíclico de 5 membros, X pode ser um átomo de oxigênio ou de enxofre, R₁, R₂, R₃ e R₄ podem representar um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, uma alquila C₁-C₄, um ciano ou um grupo nitro, B pode representar um grupo fenila substituída e R₅ pode representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₄. No entanto, este documento não descreve compostos em que o átomo de nitrogênio do resíduo de (tio)carboxamida pode ser substituído por um grupo cicloalquila.

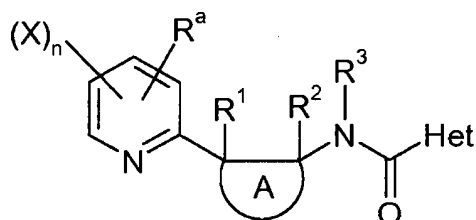
No pedido de patente internacional WO 2006/122955 determinados derivados fungicidas de N-(2-piridilcicloalquil)carboxamida são genericamente englobados em uma ampla descrição dos numerosos compostos da seguinte fórmula:



em que *Het* pode representar um anel heterocíclico de 5 membros, A pode representar um anel de cicloalquila C₃-C₇, R₁ e R₂ podem representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₆, R₃ pode representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁-C₆ ou um grupo cicloalquila C₃-C₇, e, X e R^a, iguais ou diferentes, podem representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio ou um grupo alquila C₁-C₈. Entretanto, este documento não descreve compostos em que a

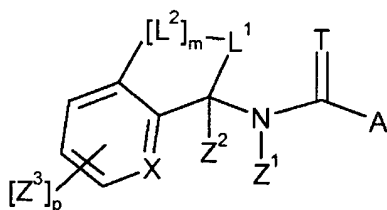
unidade 2-piridina pode ser substituída por um grupo fenila. Além disso, não há nenhuma descrição explícita neste documento de qualquer composto compreendendo um grupo cicloalquila ligado ao átomo de nitrogênio do resíduo carboxamida.

5 No pedido da patente internacional WO 2005/103006 determinados derivados fungicidas de N-(2-piridilcicloalquil)carboxamida são genericamente englobados em uma ampla descrição dos numerosos compostos da seguinte fórmula:



em que *Het* pode representar um anel heterocíclico de 5
 10 membros, A pode representar um anel de cicloalquila C₃-C₇, R₁ e R₂ pode representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₆, R³ pode representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio, um grupo alquila C₁-C₆ ou um grupo cicloalquila C₃-C₇, R^a representa um grupo halogenoalquila C₁-C₆ e X pode representar um
 15 átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo alquila C₁-C₆ ou grupo halogenoalquila C₁-C₆. Entretanto, este documento não descreve os compostos em que a unidade 2-piridina pode ser substituída por um grupo fenila. Além disso, não há nenhuma descrição explícita neste documento de qualquer composto compreendendo um grupo cicloalquila ligado ao átomo de nitrogênio
 20 do resíduo carboxamida.

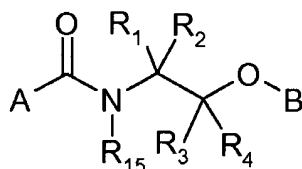
No pedido de patente internacional WO 2009/016218 determinadas amidas fungicidas de N-cicloalquil-N-biciclo são genericamente englobadas em uma ampla descrição dos numerosos compostos da seguinte fórmula:



em que A pode representar um anel heterocíclico de 5 membros, T pode ser um átomo de oxigênio ou de enxofre, Z¹ pode representar um anel de cicloalquila C₃-C₇, Z² pode representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₆, L¹ ou L² podem

5 representar diversos ligantes entre os quais um CH₂ substituído ou não substituído, m pode representar 1, 2 ou 3 e X pode representar um CH ou N substituído ou não substituído. No entanto, este documento não descreve os compostos em que a fenila ou a unidade 2-piridinila podem ser retiradas a partir da unidade cicloalquila de 5-, 6- ou 7-membros.

10 No pedido de patente internacional WO 2009/012998 determinados derivados fungicidas de N-feniloxi-cicloalquilcarboxamida são genericamente englobados em uma ampla descrição dos numerosos compostos da seguinte fórmula:



em que A pode representar um anel heterocíclico de 5 membros,

15 R₁, R₂, R₃ e R₄ podem representar diversos substituintes entre os quais um átomo de hidrogênio ou um grupo alquila C₁-C₄ e R₁ e R₃ juntos com o carbono ao qual eles estão ligados podem formar um anel cicloalquila C₃-C₇ a qual pode ser substituída por um ou mais grupos alquila C₁-C₆, B pode representar um grupo fenila substituído e R₁₅ pode ser um átomo de hidrogênio ou um grupo

20 cicloalquila C₃-C₇. No entanto, este documento não descreve nem sugere compostos em que o átomo de oxigênio ligando o anel B à unidade cicloalquila

C₃-C₇ pode ser substituído por um átomo de carbono.

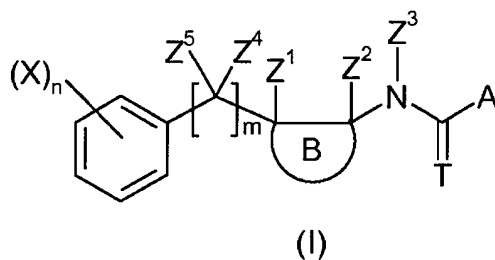
É sempre de grande interesse no campo dos agroquímicos utilizar os compostos pesticidas mais ativos do que os compostos já conhecidos pelo técnico no assunto, em que quantidades reduzidas do composto podem ser utilizadas enquanto se mantém a eficácia equivalente.

Além disso, a oferta de novos compostos pesticidas com uma maior eficácia reduz fortemente o risco de aparecimento de linhagens resistentes do fungo a ser tratado.

De acordo com a presente invenção, é apresentada uma nova família de compostos que apresentam maior atividade fungicida com relação à família conhecida de tais compostos.

DESCRIÇÃO DA INVENÇÃO

Assim, a presente invenção fornece uma N-(fenilcicloalquil)carboxamida ou N-(benzilcicloalquil)carboxamida ou seu derivado de tiocarboxamida de Fórmula (I)



em que

- A representa um grupo heterociclila de 5 membros, insaturado ou parcialmente saturado, ligado ao carbono, que pode ser substituído por até quatro grupos R;

- T representa O ou S;

- B representa um carbociclo não aromático de 3-, 4-, 5-, 6- ou 7-membros, que pode ser substituído por um a quatro grupos alquila C₁-C₈;

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

- m representa 0 ou 1;

- X representa um átomo de halogênio; nitro; ciano; isonitrila; hidroxil; amino; sulfanila; pentafluoro- λ^6 -sulfanila; formila; formiloxil; formilamino; (hidroxilimino)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; (alcoxilimino C₁-C₈)-
 5 alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; (alqueniloxilimino C₂-C₈)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; (alquililoxilimino C₂-C₈)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; (benziloxilimino)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; carboxil; carbamila; N-hidroxicarbamila; carbamato; alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de
 10 halogênio; alquênila C₂-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquênila C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilila C₂-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilila C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alcoxil C₁-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalcoxil C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilsulfanila C₁-C₈ substituída ou não substituída;
 15 halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilsulfilila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilsulfilila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilsulfonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilamino C₁-C₈ substituído ou não substituído; di-alquilamino C₁-C₈ substituído ou não
 20 substituído; alqueniloxil C₂-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalqueniloxil C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquililoxil C₃-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalquililoxil C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; cicloalquila C₃-C₇ substituída ou não substituída; halogenocicloalquila C₃-C₇ com 1 a 5 átomos de halogênio; (cicloalquil C₃-C₇)-
 25 alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; (cicloalquil C₃-C₇)-alquênila C₂-C₈ substituída ou não substituída; (cicloalquil C₃-C₇)-alquilila C₂-C₈ substituída ou não substituída; tri-alquilsilila C₁-C₈ substituída ou não substituída; tri-alquilsilil (C₁-C₈)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; alquilcarbonila C₁-C₈

substituída ou não substituída; halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilcarboniloxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalquilcarboniloxi C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilcarbonilamino C₁-C₈ substituído ou não substituído;

5 halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alcóxicarbonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalcóxicarbonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquiloalcoxycarboniloxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalcóxicarboniloxi C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilcarbamoila C₁-C₈ substituída ou não substituída; di-

10 alquilcarbamoila C₁-C₈ substituída ou não substituída; alquilaminocarboniloxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; di-alquilaminocarboniloxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; N-(alquil C₁-C₈)-hidroxcarbamoila substituída ou não substituída; alcóxicarbamoila C₁-C₈ substituída ou não substituída; N-(alquil C₁-C₈)-alcóxicarbamoila C₁-C₈ substituída ou não substituída; arila que pode ser

15 substituída por até 6 grupos Q; arilalquila C₁-C₈ que pode ser substituída por até 6 grupos Q; arilalquenila C₂-C₈ que pode ser substituída por até 6 grupos Q; arilalquinila C₂-C₈ que pode ser substituída por até 6 grupos Q; ariloxi que pode ser substituído por até 6 grupos Q; arilsulfanila que pode ser substituída por até 6 grupos Q; arilamino que pode ser substituído por até 6 grupos Q; arilalquiloxi

20 C₁-C₈ que pode ser substituído por até 6 grupos Q; arilalquilsulfanila C₁-C₈ que pode ser substituída por até 6 grupos Q; ou arilalquilamino C₁-C₈ que pode ser substituído por até 6 grupos Q;

- dois substituintes X, juntamente com os átomos de carbono consecutivos aos quais estão ligados, podem formar um carbociclo saturado ou

25 um heterociclo saturado, de 5 ou 6 membros, os quais podem ser substituídos por até quatro grupos Q que podem ser iguais ou diferentes;

- Z¹ e Z² representam independentemente um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio; ciano; uma alquila C₁-C₈ substituída ou

não substituída; halogenoalquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alcoxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; alquilsulfanila C₁-C₈ substituída ou não substituída; ou alcoxycarbonila C₁-C₈ substituída ou não substituída;

- Z³ representa uma cicloalquila C₃-C₇ não substituída ou uma
 5 cicloalquila C₃-C₇ substituída por até 10 átomos ou grupos que podem ser iguais ou diferentes e que podem ser selecionados a partir da lista que consiste em átomos de halogênio; ciano; alquila C₁-C₈; halogenoalquila C₁-C₈ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₈; halogenoalcoxi C₁-C₈ que compreende até 9 átomos de halogênio
 10 que podem ser iguais ou diferentes; alcoxycarbonila C₁-C₈; halogenoalcoxycarbonila C₁-C₈ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alquilaminocarbonila C₁-C₈ e di-alquilamino carbonila C₁-C₈;

- Z⁴ e Z⁵ representam independentemente um átomo de
 15 hidrogênio; um átomo de halogênio; ciano; uma alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alcoxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; alquilsulfanila C₁-C₈ substituída ou não substituída; alcoxycarbonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; ou Z⁴ e Z⁵ são um grupo alquilenos C₂-C₅, que pode ser substituído por um a quatro grupos
 20 alquila C₁-C₈;

- Q representa independentemente um átomo de halogênio; ciano; nitro; alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₈ com 1 a 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₈ com 1 a 9 átomos de
 25 halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alquilsulfanila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ com 1 a 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; tri-alquilsilila C₁-C₈ substituída ou não substituída; tri-(alquilsililC₁-C₈)-alquila C₁-C₈ substituída ou não

substituída; (alcoxiimino C₁-C₈)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída;
 (benziloxiimino)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída;

- R representa independentemente átomo de hidrogênio; átomo de halogênio; nitro; ciano; hidroxil; amino; sulfanila; pentafluoro-λ⁶-sulfanila;
- 5 (alcoxiimino C₁-C₈)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída;
 (benziloxiimino)-alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquenila C₂-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquenila C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquinila C₂-C₈ substituída ou não substituída;
- 10 halogenoalquinila C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alcoxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilsulfanila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilsulfinila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilsulfinila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio;
- 15 alquilsulfonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilamino C₁-C₈ substituído ou não substituído; di-alquilamino C₁-C₈ substituído ou não substituído; alqueniloxi C₂-C₈ substituído ou não substituído; alquiniloxi C₃-C₈ substituído ou não substituído; cicloalquila C₃-C₇ substituída ou não substituída;
- 20 halogenocicloalquila C₃-C₇ com 1 a 5 átomos de halogênio; tri-alquilsilila C₁-C₈ substituída ou não substituída; alquilcarbonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alcóxicarbonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalcóxicarbonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio; alquilcarbamoila C₁-C₈ substituída ou
- 25 não substituída; di-alquilcarbamoila C₁-C₈ substituída ou não substituída; fenoxil; fenilsulfanila; fenilamino; benziloxil; benzilsulfanila; ou benzilamino;

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

Para os compostos de acordo com a presente invenção, os seguintes termos genéricos são geralmente utilizados com os seguintes significados:

- halogênio significa flúor, cloro, bromo ou iodo.
- 5 - carboxi significa $-C(=O)OH$;
- carbonila significa $-C(=O)-$;
- carbamoila significa $-C(=O)NH_2$;
- N-hidroxicarbamoila significa $-C(=O)NHOH$;
- SO representa um grupo sulfóxido;
- 10 - SO_2 representa um grupo sulfona;
- um grupo alquila, um grupo alquenila e um grupo alquinila, bem como unidades contendo esses termos, pode ser lineares ou ramificadas;
- a unidade arila contida em um grupo arila, um grupo arilalquila, um grupo arilalquenila e um grupo arilalquenila bem como as unidades que
- 15 contém esses termos, pode ser um grupo fenila que pode ser substituído por até 5 grupos Q, um grupo naftila que pode ser substituído por até 6 grupos Q ou um grupo piridila que pode ser substituído por até 4 grupos Q;
- e, heteroátomo significa enxofre, nitrogênio ou oxigênio.
- no caso de um grupo amino ou da unidade amino de qualquer
- 20 outro grupo que compreende amino, substituído por dois substituintes que podem ser iguais ou diferentes, os dois substituintes, juntamente com o átomo de nitrogênio ao qual estão ligados, podem formar um grupo heterociclila, de preferência um grupo heterociclila de 5- a 7-membros, ou que pode ser substituído ou que pode incluir outros heteroátomos, por exemplo, um grupo de
- 25 morfolino ou grupo piperidinila.
- salvo indicação em contrário, um grupo ou um substituinte que é substituído de acordo com a presente invenção pode ser substituído por um ou mais dos seguintes grupos ou átomos: um átomo de halogênio, um grupo nitro,

um grupo hidróxi, um grupo ciano, um grupo amino, um grupo sulfanila, um grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanila, um grupo formila, um grupo formilóxi, um grupo formilamino, um grupo carbamoila, um grupo N-hidroxycarbamoila, um grupo carbamato, um grupo (hidróxiimino)-alquila C₁-C₆, uma alquila C₁-C₈, uma tri-

5 alquila C₁-C₈, uma tri-silil(C₁-C₈-alquil)-alquila C₁-C₈, uma cicloalquila C₁-C₈, uma tri-silil(alquil C₁-C₈)-cicloalquila C₁-C₈, uma halogenoalquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma halogenocicloalquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquenila C₂-C₈, uma alquinila C₂-C₈, um alquenilóxi C₂-C₈, um alquinilóxi C₂-C₈, um alquilamino C₁-C₈, um di-alquilamino C₁-C₈, um alcóxi C₁-

10 C₈, um halogenoalcóxi C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilsulfanila C₁-C₈, uma halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, um alquenilóxi C₂-C₈, um halogenoalquenilóxi C₂-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, um alquinilóxi C₃-C₈, um halogenoalquinilóxi C₃-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilcarbonila C₁-C₈, uma

15 halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilcarbamoila C₁-C₈, uma di-alquilcarbamoila C₁-C₈, uma N-alquiloxicarbamoila C₁-C₈, uma alcóxicarbamoila C₁-C₈, uma N-alquil-C₁-C₈-alcóxicarbamoila C₁-C₈, uma alcóxicarbonila C₁-C₈, uma halogenoalcóxicarbonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, um

20 alquilcarbonilóxi C₁-C₈, um halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, um alquilcarbonilamino C₁-C₈, um halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, um alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, um di-alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, um alquiloxicarbonilóxi C₁-C₈, uma alquilsulfinila C₁-C₈, uma halogenoalquilsulfinila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma

25 alquilsulfonila C₁-C₈, uma halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilaminosulfamoila C₁-C₈, uma di-alquilaminosulfamoila C₁-C₈, uma (alcóxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, um (alquenilóxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, um (alquinilóxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, um 2-oxopirrolidin-1-il, um

(benziloxiimino)-alquila C₁-C₆, uma alcoxialquila C₁-C₈, uma halogenoalcoxialquila C₁-C₈ com 1 a 5 átomos de halogênio, um benziloxi, uma benzilsulfanila, um benzilamino, um fenoxi, uma fenilsulfanila, ou um fenilamino.

5 Qualquer um dos compostos de acordo com a presente invenção pode existir em uma ou mais formas isômeras ópticas ou quirais, dependendo do número de centros assimétricos no composto. Portanto, a presente invenção se refere igualmente a todos os isômeros óticos e a quaisquer das suas misturas racêmicas ou escalêmicas (*scalemic*) (o termo "escalêmico"

10 denota uma mistura de enantiômeros em proporções diferentes) 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 conhecidos *per se* por um técnico no assunto regular.

Qualquer um dos compostos da presente invenção também pode

15 existir em uma ou mais formas do isômero geométrico, dependendo do número de duplas ligações no composto. Portanto, a presente invenção se refere 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 métodos gerais, que são conhecidos *per se* por um técnico no

20 assunto regular.

Qualquer um dos compostos da presente invenção também pode existir em uma ou mais formas do isômero geométrico, dependendo da posição relativa (sin/anti ou cis/trans) dos substituintes do anel B. A presente invenção, assim, se refere igualmente a todos os isômeros sin/anti (ou *cis/trans*) e a todas

25 as misturas possíveis sin/anti (ou *cis/trans*), em todas as proporções. Os isômeros sin/anti (ou *cis/trans*) podem ser separados de acordo com métodos gerais, que são conhecidos *per se* por um técnico no assunto regular.

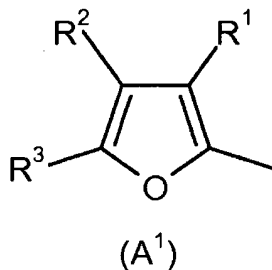
Qualquer um dos compostos de Fórmula (I) em que X representa

um grupo hidroxil, um grupo sulfanil ou um grupo amino pode ser encontrado na sua forma tautomérica resultante do deslocamento do próton de dito grupo hidroxil, sulfanil ou amino.

Tais formas tautoméricas de tais compostos também fazem parte da presente invenção. De um modo geral, todas as formas tautoméricas dos compostos de Fórmula (I), em que X representa um grupo hidroxil, um grupo sulfanil ou um grupo amino, bem como as formas tautoméricas dos compostos que podem ser opcionalmente utilizados como intermediários nos processos de preparação e que serão definidos na descrição desses processos, também fazem parte da presente invenção.

Os compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são os compostos de Fórmula (I), em que A é selecionado a partir da lista que consiste em:

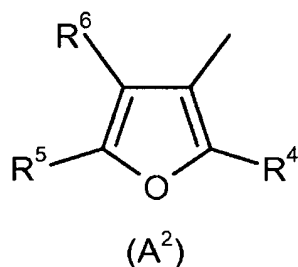
- um heterociclo de Fórmula (A¹)



em que:

R¹ a R³, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

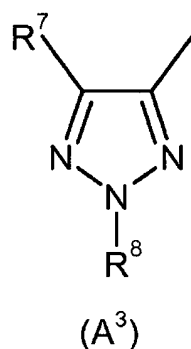
- um heterociclo de Fórmula (A²)



em que:

R⁴ a R⁶, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio
 5 que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A³)

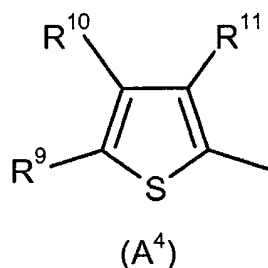


em que:

10 R⁷ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

15 R⁸ representa um átomo de hidrogênio ou uma alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

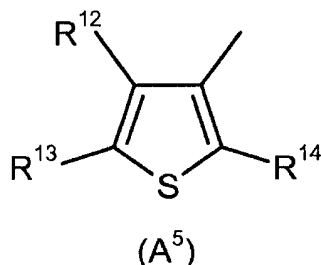
- um heterociclo de Fórmula (A⁴)



em que:

R⁹ a R¹¹, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; amino; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; alquilsulfanila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A⁵)



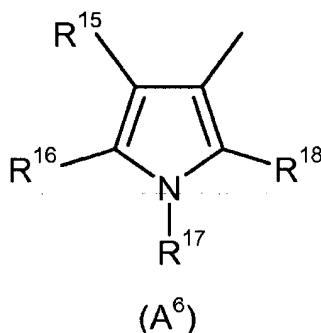
em que:

R¹² e R¹³, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; amino; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R¹⁴ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não

substituído; amino; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A⁶)



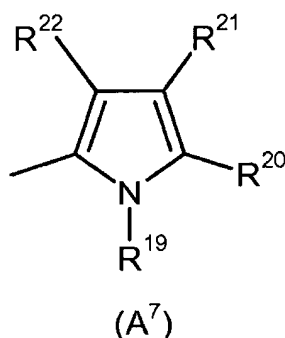
5 em que:

R¹⁵ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; um ciano; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalquila C₁-C₅ que
10 compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R¹⁶ e R¹⁸, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alcóxicarbonila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou
15 diferentes; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R¹⁷ representa um átomo de hidrogênio ou alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A⁷)

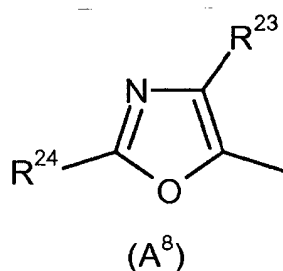


em que:

R^{19} representa um átomo de hidrogênio ou uma alquila C_1-C_5 ;

R^{20} a R^{22} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A^8)

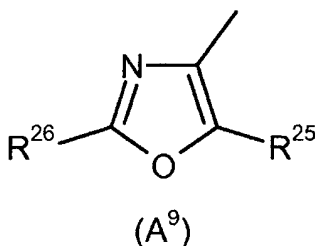


em que

- R^{23} representa um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R^{24} representa um átomo de hidrogênio ou alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A^9)



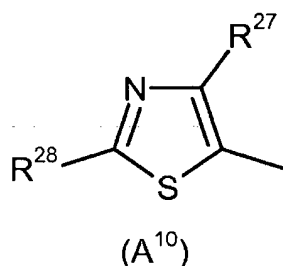
em que:

R^{25} representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que

compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R^{26} representa um átomo de hidrogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

5 - um heterociclo de Fórmula (A^{10})



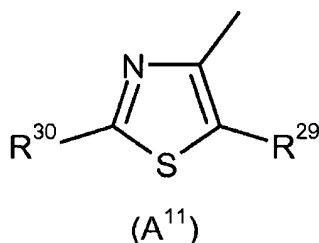
em que:

R^{27} representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

10 R^{28} representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; halogenoalcoxi C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; amino; alquilamino C_1-C_5 substituído ou não substituído;

15 substituído; ou di(alquil C_1-C_5)amino substituído ou não substituído;

- um heterociclo de Fórmula (A^{11})



em que:

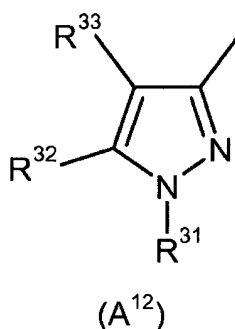
R^{29} representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; alcoxi C_1-C_5 substituído ou não

substituído; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R³⁰ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio;

- 5 alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; amino; alquilamino C₁-C₅ substituído ou não substituído ou di(alquil C₁-C₅)amino substituído ou não substituído;

- 10 - um heterociclo de Fórmula (A¹²)



em que:

R³¹ representa um átomo de hidrogênio ou uma alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

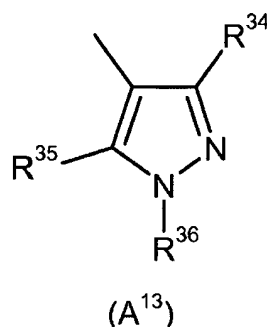
R³² representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio;

- 15 alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R³³ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio;

- um nitro; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de
 20 halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹³)



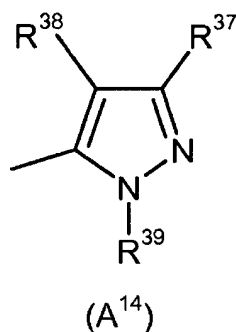
em que:

R³⁴ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; cicloalquila C₃-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; alquiniloxi C₂-C₅ substituído ou não substituído; ou halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R³⁵ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; um ciano; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; alquilsulfanila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; amino; alquilamino C₁-C₅ substituído ou não substituído; ou di(alquil C₁-C₅)amino substituído ou não substituído;

R³⁶ representa um átomo de hidrogênio ou alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A¹⁴)

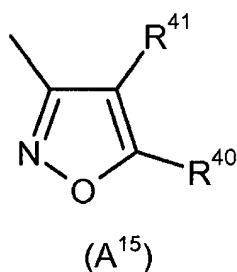


em que:

R³⁷ e R³⁸, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio
5 que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; ou uma alquilsulfanila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

R³⁹ representa um átomo de hidrogênio ou alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

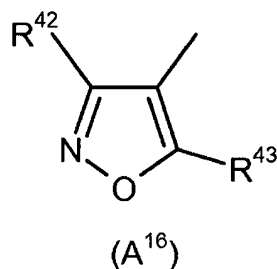
- um heterociclo de Fórmula (A¹⁵)



10 em que:

R⁴⁰ e R⁴¹, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de
15 halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹⁶)

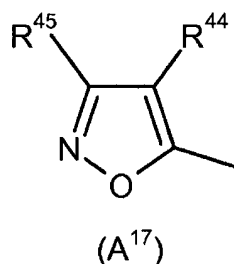


em que:

R⁴² e R⁴³, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio,

5 que podem ser iguais ou diferentes; ou amino;

- um heterociclo de Fórmula (A¹⁷)

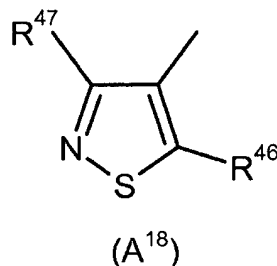


em que:

R⁴⁴ e R⁴⁵, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

10

- um heterociclo de Fórmula (A¹⁸)



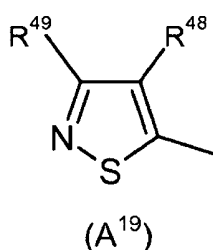
em que:

R⁴⁷ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio;

alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

R⁴⁶ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₅ que
5 compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou alquilsulfanila C₁-C₅ substituída ou não substituída;

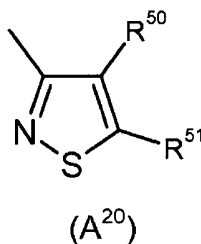
- um heterociclo de Fórmula (A¹⁹)



em que:

R⁴⁹ e R⁴⁸, que podem ser iguais ou diferentes, representam um
10 átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

15 - um heterociclo de Fórmula (A²⁰)

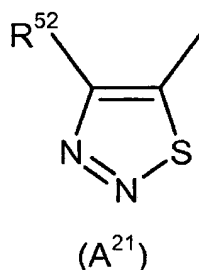


em que:

R⁵⁰ e R⁵¹, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; alcoxi C₁-C₅ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₅

que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A²¹)

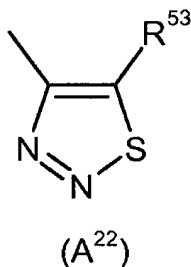


5

em que:

R⁵² representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A²²)

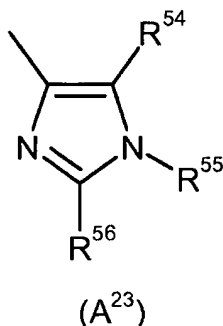


10

em que:

R⁵³ representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C₁-C₅ substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C₁-C₅ que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A²³)

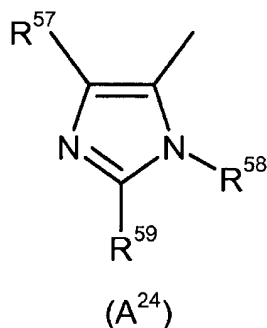


em que:

R^{54} e R^{56} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R^{55} representa um átomo de hidrogênio ou alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A^{24})

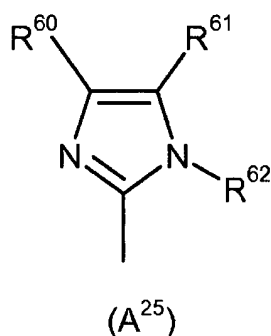


em que:

R^{57} e R^{59} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R^{58} representa um átomo de hidrogênio ou alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A^{25})

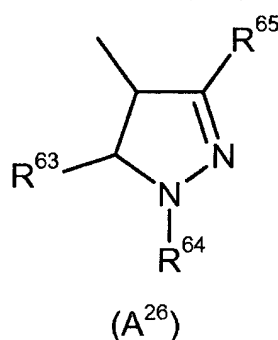


em que:

R^{60} e R^{61} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; ou halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

5 R^{62} representa um átomo de hidrogênio ou alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A^{26})



em que:

R^{65} representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; cicloalquila C_3-C_5 substituída ou não substituída; halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C_1-C_5 substituído ou não substituído; alquiloxi C_2-C_5 substituído ou não substituído ou halogenoalcoxi C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

R^{63} representa um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída; um ciano; alcoxi C_1-C_5 substituído ou não substituído; alquilsulfanila C_1-C_5 substituída ou não substituída; halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; halogenoalcoxi C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; amino; alquilamino C_1-C_5 substituído ou não substituído; ou di(alquil C_1-C_5)amino;

R^{64} representa um átomo de hidrogênio ou alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída.

Os compostos de maior preferência, de acordo com a presente invenção, são compostos de Fórmula (I), em que A é selecionado a partir da
 5 lista que consiste em A^2 ; A^6 ; A^{10} e A^{13} conforme definido no presente. Os compostos de maior preferência, ainda, de acordo com a presente invenção, são compostos de Fórmula (I), em que A representa A^{13} , em que R^{34} representa uma alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída, uma halogenoalquila C_1-C_5 que compreende até 9 átomos de halogênio que podem
 10 ser iguais ou diferentes; alcoxi C_1-C_5 substituído ou não substituído; R^{35} representa um átomo de hidrogênio ou um átomo de halogênio e R^{36} representa uma alquila C_1-C_5 substituída ou não substituída.

Outros compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são os compostos de Fórmula (I), em que T representa O.

15 Outros compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são os compostos de Fórmula (I), em que n representa 0, 1 ou 2.

Outros compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são compostos da Fórmula (I) em que B é um carbociclo não aromático de 3-, 5-, 6- ou 7-membros que pode ser substituído por um a quatro
 20 grupos alquila C_1-C_8 .

De maior preferência, B é escolhido a partir de carbociclo ciclopropila, ciclopentila, ciclohexila e cicloheptila que pode ser substituído por um a quatro grupos de metila.

Outros compostos preferidos de acordo com a presente invenção
 25 são compostos de Fórmula (I), em que X representa independentemente um átomo de halogênio; alquila C_1-C_8 substituída ou não substituída; halogenoalquila C_1-C_8 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes; tri(alquil C_1-C_8)silila substituída ou não substituída;

alcoxi C_1-C_8 substituído ou não substituído ou halogenoalcoxi C_1-C_8 que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes. Ou em que dois substituintes consecutivos X, juntamente com o anel fenila formam uma 1,3-benzodioxolila substituída ou não substituída; 1,2,3,4-
5 tetrahydro-quinoxalinila, 3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazinila; 1,4-benzodioxanila; indanila; 2,3-dihidrobenzofuranila; ou indolinila.

Outros compostos preferidos de acordo com a presente invenção são compostos de Fórmula (I), em que Z^1 e Z^2 representam independentemente um átomo de hidrogênio ou uma alquila C_1-C_8 substituída
10 ou não substituída.

Outros compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são compostos da Fórmula (I) em que Z^3 representa uma cicloalquila C_3-C_7 não substituída ou uma cicloalquila C_3-C_7 substituída por até 10 grupos ou átomos que podem ser iguais ou diferentes e que podem ser selecionados a
15 partir da lista que consiste em átomos de halogênio, uma alquila C_1-C_8 , uma halogenoalquila C_1-C_8 que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes, um alcoxi C_1-C_8 ou um halogenoalcoxi C_1-C_8 compreendendo até 9 de átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes. De maior preferência, Z^3 representa uma cicloalquila C_3-C_7 não
20 substituída; de maior preferência ainda, Z^3 representa um ciclopropil.

Outros compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são compostos da Fórmula (I) em que Z^4 e Z^5 representam independentemente um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio ou uma alquila C_1-C_8 substituída ou não substituída.

25 Outros compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, são compostos da Fórmula (I) em que R representa independentemente um átomo de hidrogênio; átomo de halogênio; ciano; alquilamino C_1-C_8 substituído ou não substituído; di-alquilamino C_1-C_8

substituído ou não substituído; tri(alquil C₁-C₈)silila substituída ou não substituída; alquila C₁-C₈ substituída ou não substituída; halogenoalquila C₁-C₈ que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alcoxi C₁-C₈ substituído ou não substituído; halogenoalcoxi C₁-C₈ 5 que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; alquilsulfanila C₁-C₈ substituída ou não substituída; amino; hidroxila; nitro; alcóxicarbonila C₁-C₈ substituída ou não substituída; alquiniloxi C₂-C₈ substituído ou não substituído.

As preferências mencionadas acima com relação aos 10 substituintes dos compostos, de acordo com a presente invenção, podem ser combinadas de diversas maneiras. Portanto, estas combinações de características preferidas fornecem subclasses de compostos de acordo com a presente invenção. Os exemplos de tais subclasses de compostos preferidos, de acordo com a presente invenção, podem ser combinados:

15 - as características preferidas de A com características preferidas de B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n, m e R;

- as características preferidas de B com características preferidas de A, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n, m e R;

20 - as características preferidas de Z¹ com características preferidas de A, B, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n, m e R;

- as características preferidas de Z² com características preferidas de A, B, Z¹, Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n, m e R;

- as características preferidas de Z³ com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z⁴, Z⁵, X, T, n, m e R;

25 - as características preferidas de Z⁴ com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁵, X, T, n, m e R;

- as características preferidas de Z⁵ com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, X, T, n, m e R;

- as características preferidas de X com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, T, n, m e R;

- as características preferidas de T com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, n, m e R;

5 - as características preferidas de n com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, m e R;

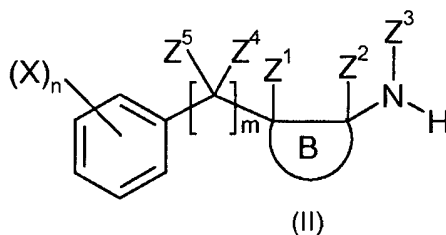
- as características preferidas de m com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n e R;

10 - as características preferidas de R com características preferidas de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n e m;

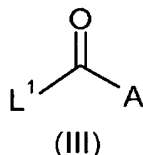
Nessas combinações de características preferidas dos substituintes dos compostos, de acordo com a presente invenção, ditas características preferidas também podem ser selecionadas dentre as características de maior preferência, de cada um de A, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, Z⁵, X, T, n, m e R, de modo a formar 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 dos compostos de Fórmula (I).

Portanto, de acordo com outro aspecto da presente invenção, é fornecido um processo P1 para a preparação de um composto de Fórmula (I), conforme definido no presente e em que T representa O e que compreende a reação do derivado de 2-fenilcicloalquilamino ou 2-benzilcicloalquilamino de Fórmula (II) ou um de seus sais:



em que X, n, m, B, Z¹, Z², Z³, Z⁴, e Z⁵ são conforme definidos no presente, com um ácido carboxílico derivado da Fórmula (III):



em que A é conforme definido no presente e L¹ representa um grupo de saída selecionado a partir da lista que consiste em um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, -OR^a, -OC(=O)R^a, R^a sendo uma alquila C₁-C₆ substituída ou não substituída, uma haloalquila C₁-C₆ substituída ou não substituída, uma benzila, um grupo 4-metoxibenzila ou pentafluorofenila, ou um grupo de fórmula O-C(=O)A; na presença de um catalisador e na presença de um agente de condensação no caso L¹ representa um grupo hidroxila e na presença de um ligante ácido no caso. L¹ representa um átomo de halogênio.

Os derivados de N-cicloalquilamina de Fórmula (II) podem ser preparados pelos processos, tais como a aminação redutiva do aldeído ou cetona (*Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters* (2006), 2.014), ou a redução de iminas (*Tetrahedron* (2005), 11.689), ou a substituição nucleofílica do halogênio, mesilato ou tosilato (*Journal of Medicinal Chemistry* (2002), 3.887).

Os derivados de ácido carboxílico de Fórmula (III) podem ser preparados pelos processos conhecidos.

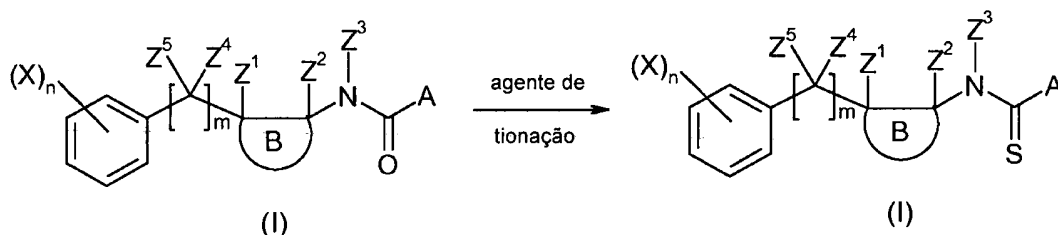
No caso de L¹ representar um grupo hidroxila, o processo, de acordo com a presente invenção, é realizado na presença do agente de condensação. O agente de condensação adequado pode ser selecionado a partir da lista não limitada que consiste no formador de haleto ácido, tal como o fosgênio, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, óxido de tricloreto de fósforo ou cloreto de tionila; formador de anidrido, tal como o cloroformato de etila, cloroformato metila, cloroformato de isopropila,

cloroformato-de isobutila ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidas, tais como o N,N'-di-ciclo-hexilcarbodiimida (DCC) ou outros agentes de condensação habituais, tal como o pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-diidroquinolina (EEDQ),
5 trifenilfosfina/ tetraclorometano, cloridrato de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolina ou hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfônio.

O processo de acordo com a presente invenção é realizado na presença de um catalisador. O catalisador adequado pode ser selecionado a partir da lista que consiste em 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol ou
10 dimetilformamida.

No caso de L¹ representar um átomo de halogênio, o processo, de acordo com a presente invenção, é realizado na presença de um ligante ácido. Os ligantes ácidos adequados para a realização do processo P1, de acordo com a presente invenção são, em cada caso, todos bases inorgânicas e
15 orgânicas que são usuais para tais reações. É dada preferência à utilização de metal alcalino terroso, hidreto de metal alcalino, hidróxidos de metal alcalino ou alcóxidos de metal alcalino, tal como o hidróxido de sódio, hidreto de sódio, hidróxido de cálcio, hidróxido de potássio, *terc*-butoxido de potássio ou outro hidróxido de amônio; carbonatos de metal alcalino, tais como o carbonato de
20 cério, carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio; acetatos de metais alcalinos ou metais alcalinos terrosos, tais como o acetato de sódio, acetato de potássio, acetato de cálcio e também aminas terciárias, tais como a trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetil-
25 aminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) ou diaza-bicycloundeceno (DBU). Também é possível trabalhar na ausência de um agente de condensação adicional ou empregar um excesso do componente amina, de modo que atue simultaneamente como um agente ligante ácido.

Com relação a um aspecto adicional, de acordo com a presente invenção, é fornecido um Processo P2 para a preparação de um composto de Fórmula (I), em que T representa S, a partir de um composto de Fórmula (I), em que T representa O e ilustrado de acordo com o seguinte esquema de reação:



PROCESSO P2

em que X, n, m, B, Z^1 , Z^2 , Z^3 , Z^4 , Z^5 e A são conforme definidos no presente, na presença opcional de uma quantidade catalítica ou estequiométrica ou mais de uma base, tal como uma base inorgânica e orgânica. É dada preferência à utilização de carbonatos de metal alcalino, tais como o carbonato de sódio, carbonato de potássio, bicarbonato de potássio, bicarbonato de sódio; bases aromáticas heterocíclicas, tais como piridina, picolina, lutidina, colidina; e também aminas terciárias, tais como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilaminopiridina ou N-metilpiperidina.

O processo P2, de acordo com a presente invenção, pode ser realizado na presença de um agente de tionação.

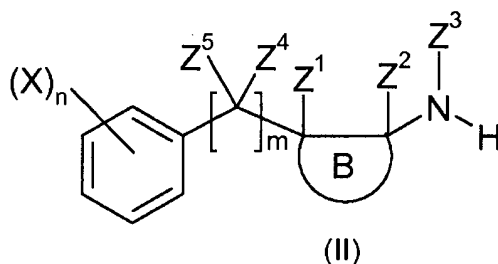
Os derivados de amida de partida de Fórmula (I) podem ser preparados de acordo com o Processo P1.

Os agentes de tionação adequados para a realização do processo P2, de acordo com a presente invenção, podem ser o enxofre (S), ácido sulfídrico (H_2S), sulfeto de sódio (Na_2S), hidrossulfeto de sódio ($NaHS$), trissulfureto de boro (B_2S_3), sulfeto de bis(dietilalumínio) ($(AlEt_2)_2S$), sulfeto de amônio ($(NH_4)_2S$), pentassulfeto de fósforo (P_2S_5), reagente de Lawesson (2,4-

bis(4-metoxifenil)-1,2,3,4-ditiodifosfetano 2,4-dissulfeto) ou um reagente de tionação com suporte em polímero, tal conforme descrito em *J. Chem. Soc. Perkin 1*, (2001), 358.

O composto, de acordo com a presente invenção, pode ser preparado de acordo com os processos gerais de preparação descritos acima. No entanto, será entendido que, com base no seu conhecimento geral e nas publicações disponíveis, o técnico no assunto será capaz de adaptar este método de acordo com as especificidades de cada um dos compostos, o qual se deseja sintetizar.

Em um aspecto adicional ainda, a presente invenção se refere aos compostos de Fórmula (II) úteis como compostos intermediários ou materiais para o processo de preparação de acordo com a presente invenção. A presente invenção, portanto, fornece os compostos de Fórmula (II):



em que X, n, m, Z¹, Z², Z³, Z⁴ e Z⁵ são conforme definidos no presente, e B representa um grupo ciclopropila, ciclobutila, ciclopentila, ciclohexila ou cicloheptila, com a exclusão de N-ciclopropil-2-fenilciclohexanamina.

Com base na presente descrição e no seu conhecimento geral e nas publicações, por exemplo, conforme descritos no documento da patente internacional WO 2006/122955, o técnico no assunto pode preparar o composto intermediário de Fórmula (II) de acordo com a presente invenção.

Em um aspecto adicional, a presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende uma quantidade efetiva e não

fitotóxica de um composto ativo de Fórmula (I).

A expressão "quantidade efetiva e não fitotóxica" significa uma quantidade da composição, de acordo com a presente invenção, que é suficiente para controlar ou destruir o fungo presente ou responsável por
5 aparecer nas culturas, e que não acarretam qualquer sintoma apreciável de fitotoxicidade em ditas culturas. Tal quantidade pode variar dentro de uma ampla gama dependendo do fungo a ser controlado, do tipo de cultura, das condições climáticas e dos compostos incluídos na composição fungicida, de acordo com a presente invenção. Esta quantidade pode ser determinada por
10 testes em campos sistemáticos, que estão dentro das capacidades de um técnico no assunto.

Desta maneira, de acordo com a presente invenção, é fornecida uma composição fungicida que compreende, como um ingrediente ativo, uma quantidade efetiva de um composto de Fórmula (I), conforme definido no
15 presente, e um suporte, veículo ou carga agricolamente aceitável.

De acordo com a presente invenção, o termo "suporte" se refere a um composto 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 aplicar, notavelmente nas partes da planta. Portanto, este suporte é,
20 em geral, inerte e deve ser agricolamente aceitável. 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, alcoóis, em particular o butanol, solventes orgânicos, óleos minerais e vegetais e seus derivados. As misturas de tais suportes também podem ser utilizadas.

25 A composição de acordo com a presente invenção também pode compreender os componentes adicionais. Em particular, a composição pode ainda compreender um tensoativo. O tensoativo pode ser um emulsificante, um agente dispersante ou um agente molhante 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 fenolsulfônico ou naftalenossulfônico, policondensados de óxido de etileno com alcoóis 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 alcoóis ou fenóis polioxietilenados, ésteres de ácido graxo de polióis e os derivados dos presentes compostos 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 de 5% a 40% em peso da composição.

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

Em geral, a composição de acordo com a presente invenção pode 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 de várias formas, tal como dispensador aerossol, suspensão em cápsula, concentrado de nebulização a frio, pó empoeirável, concentrado emulsificável, emulsão óleo em água, emulsão água em óleo, grânulo encapsulado, grânulo fino, concentrado com capacidade de fluxo para o tratamento de sementes, gás (sob pressão), produto gerador de gás, grânulo, concentrado de nebulização a quente, macrogrânulo, microgrânulo, pó dispersível de óleo, concentrado com capacidade de fluxo miscível em óleo,

líquido miscível em óleo, pasta, filamento vegetal, pó para o tratamento de sementes secas, semente revestida com um pesticida, concentrado solúvel, pó solúvel, solução para o tratamento de semente, concentrado de suspensão (concentrado com capacidade de fluxo), líquido de volume ultra baixo (ULV),
5 suspensão de volume ultra baixo (UVL), grânulos ou tabletes dispersíveis em água, pó dispersível em água para o tratamento em calda, grânulos ou tabletes hidrossolúveis, pó hidrossolúvel para o tratamento de semente e pó molhável. Estas composições incluem não apenas composições que estão prontas para serem aplicadas na planta ou semente a ser tratada por meio de um dispositivo
10 apropriado, tais como um dispositivo de aspersão ou pulverização, mas também 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 um ou mais inseticidas, fungicidas, bactericidas,
15 atrativos, substância ativa de feromônio ou acaricidas ou outros compostos com atividade biológica. As misturas assim obtidas possuem normalmente um espectro ampliado de atividade. As misturas com outros compostos fungicidas são particularmente vantajosas.

Os exemplos de associações apropriadas de mistura de
20 fungicidas podem ser selecionados a partir da seguinte lista:

(1) Inibidores da biossíntese de ergosterol, por exemplo, (1.1) o aldimorf (1.704-28-5), (1.2) azaconazol (60.207-31-0), (1.3) bitertanol (55.179-31-2), (1.4) bromuconazol (116.255-48-2), (1.5) ciproconazol (113.096-99-4), (1.6) diclobutrazol (75.736-33-3), (1.7) difenoconazol (119.446-68-3), (1.8)
25 diniconazol (83.657-24-3), (1.9) diniconazol-M (83.657-18-5), (1.10) dodemorf (1.593-77-7), (1.11) acetato de dodemorf (31.717-87-0), (1.12) epoxiconazol (106.325-08-0), (1.13) etaconazol (60.207-93-4), (1.14) fenarimol (60.168-88-9), (1.15) fenbuconazol (114.369-43-6), (1.16) fenexamida (126.833-17-8), (1.17)

fenpropidina (67.306-00-7), (1.18) fenpropimorf (67.306-03-0), (1.19) fluquinconazol (136.426-54-5), (1.20) flurprimidol (56.425-91-3), (1.21) flusilazol (85.509-19-9), (1.22) flutriafol (76674-21-0), (1.23) furconazol (112.839-33-5), (1.24) cis-furconazole (112.839-32-4), (1.25) hexaconazol (79.983-71-4), (1.26) imazalil (60.534-80-7), (1.27) sulfato de imazalil (58.594-72-2), (1.28) imibenconazol (86.598-92-7), (1.29) ipconazol (125.225-28-7), (1.30) metconazol (125.116-23-6), (1.31) miclobutanil (88.671-89-0), (1.32) naftifina (65.472-88-0), (1.33) nuarimol (63.284-71-9), (1.34) oxpoconazol (174.212-12-5), (1.35) paclobutrazol (76.738-62-0), (1.36) pefurazoato (101.903-30-4), (1.37) penconazol (66.246-88-6), (1.38) piperalin (3.478-94-2), (1.39) procloraz (67.747-09-5), (1.40) propiconazol (60.207-90-1), (1.41) protioconazol (178.928-70-6), (1.42) piributicarb (88.678-67-5), (1.43) pirifenox (88.283-41-4), (1.44) quinconazol (103.970-75-8), (1.45) simeconazol (149.508-90-7), (1.46) spiroxamina (118.134-30-8), (1.47) tebuconazol (107.534-96-3), (1.48) terbinafina (91.161-71-6), (1.49) tetraconazol (112.281-77-3), (1.50) triadimefon (43.121-43-3), (1.51) triadimenol (89.482-17-7), (1.52) tridemorf (81412-43-3), (1.53) triflumizol (68.694-11-1), (1.54) triforina (26.644-46-2), (1.55) triticonazol (131983-72-7), (1.56) uniconazol (83657-22-1), (1.57) uniconazol-p (100761-65-7), (1.58) viniconazol (77.174-66-4), (1.59) voriconazol (137.234-62-9), (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)ciclo-heptanol (129.586-32-9), (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazole-5-carboxilato de metila (111.323-95-0), (1.62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propóxi]fenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]imidoformamida e (1.64) O-{1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil} 1H-imidazol-1-carbotioato (111.226-71-2).

(2) inibidores da respiração no complexo I ou II, por exemplo, (2.1) o bixafen (581.809-46-03), (2.2) boscalid (188.425-85-6), (2.3) carboxina

(5.234-68-4), (2.4) diflumetorim (130.339-07-0), (2.5) fenfuram (24.691-80-3), (2.6) fluopiram (658.066-35-4), (2.7) flutolanil (66.332-96-5), (2.8) furametpir (123.572-88-3), (2.9) furmeciclo (60.568-05-0), (2.10) isoprazam (mistura do racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS e do racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR) (881.685-58-1), (2.11) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.12) isopirazam (enantiômero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.13) isopirazam (enantiômero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.14) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS, 4SR, 9RS), (2.15) isopirazam (enantiômero sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.16) isopirazam (enantiômero sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.17) mepronila (55.814-41-0), (2.18) oxicarboxina (5.259-88-1), (2.19) penflufen (494.793-67-8), (2.20) pentiopirad (183.675-82-3), (2.21) sedaxano (874.967-67-6), (2.22) tifluzamida (130.000-40-7), (2.23) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetóxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.24) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetóxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida e seus sais.

(3) inibidores da respiração no complexo III, por exemplo, (3.1) o amisulbrom (348.635-87-0), (3.2) azoxistrobina (131.860-33-8), (3.3) ciazofamida, (120.116-88-3), (3.4) dimoxistrobina (141.600-52-4), (3.5) enestroburina (238.410-11-2) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.6) famoxadona (131.807-57-3) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.7) fenamidona (161.326-34-7) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.8) fluoxastrobin (361.377-29-9) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.9) cresoxim-metila (143.390-89-0) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.10) metominostrobin (133.408-50-1) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.11) orisastrobina (189.892-69-1) (conhecido a partir do

documento WO 2004/058723), (3.12) picoxistrobina (117.428-22-5) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.13) piraclostrobina (175.013-18-0) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.14) pirametostrobina (915.410-70-7) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.15) 5 piraoxistrobina (862.588-11-2) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.16) piribencarb (79.9247-52-2) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.17) trifloxistrobina (141.517-21-7) (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.18) (2E)-2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenóxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (conhecido a partir do documento WO 2004/058723), (3.19) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[[{(LE)-I-[3 (trifluorometil)fenil]etilideno}amino)oxi]metil}fenil]etanamida (conhecido a partir do documento WO 2004/058723) e seus sais, (3.20) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[(E)-{(1-3- (trifluorometil)fenil]etoxi}imino)metil}fenil]etanamida (158169-73-4), (3.21) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-{[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi}fenil]etilideno]amino}oxi)metil}fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (326.896 - 28-0), (3.22) (2E)-2-{2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-ilideno]amino}oxi)metil}fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.23) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida (119899-14-8), (3.24) 5-metoxi-2-metil-4-(2-{[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil] etilideno]fenil]etilideno}amino)oxi]metil}fenil)-2,4-diidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.25) 2-{2-[[{ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil}sulfanil]metil}fenil}-3- metoxiacrilato de metila (149601-03-6), (3.26) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2- 25 hidroxibenzamida (226.551-21-9) e seus sais.

(4) inibidores da mitose e da divisão celular como, por exemplo, (4.1) benomila (17.804-35-2), (4.2) carbendazim (10.605-21-7), (4.3) clorfenazol (3574-96-7) (4.4) dietofencarb (87.130-20-9), (4.5) etaboxam (162.650-77-3),

(4.6) fluopicolida (239.110-15-7), (4.7) fuberidazol (3.878-19-1), (4.8) pencycurona (66.063-05-6), (4.9) tiabendazol (148-79-8), (4.10) tiofenato-metila (23.564-05-8), (4.11) tiofenato (23.564-06-9), (4.12) zoxamida (156.052-68-5) e (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazol[1,5-a]pirimidina (214.706-53-3).

(5) compostos capazes de possuir uma ação multilocal, por exemplo, (5.1) a mistura Bordeaux (8.011-63-0), (5.2) captafol (2.425-06-1), (5.3) captan (133-06-2) (conhecido a partir do documento WO 02/12172), (5.4) clorotalonil (1.897-45-6), (5.5), hidróxido de cobre (20.427-59-2), (5.6) naftenato de cobre (1.338-02-9), (5.7) óxido de cobre (1.317-39-1), (5.8) oxicloreto de cobre (1.332-40-7), (5.9) sulfato de cobre (²⁺) (7.758-98-7), (5.10) diclofluanida (1.085-98-9), (5.11) ditianon (3.347-22-6), (5.12) dodina (2.439-10-3), (5.13) base livre de dodina, (5.14) ferbam (14.484-64-1), (5.15) fluorofolpet (719-96-0), (5.16) folpet (133-07-3), (5.17) guazatina (108.173-90-6), (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminoctadina (13.516-27-3), (5.20) albesilato de iminoctadina (169.202-06-6), (5.21) triacetato de iminoctadina (57.520-17-9), (5.22) mancobre (53.988-93-5), (5.23) mancozeb (2.234.562), (5.24) maneb (12.427-38-2), (5.25) metiram (9.006-42-2), (5.26) metiram de zinco (9.006-42-2), (5.27) oxina cobre (10.380-28-6), (5.28) propamidina (104-32-5), (5.29) propineb (12.071-83-9), (5.30) enxofre e preparações de enxofre incluindo o polissulfureto de cálcio (7.704-34-9), (5.31) tiram (137-26-8), (5.32) tolilfluanid (731-27-1), (5,33) zineb (12.122-67-7), (5.34) ziram (137-30-4) e seus sais.

(6) compostos capazes de induzir uma defesa do hospedeiro, por exemplo, (6.1) o acibenzolar-S-metila (135.158-54-2), (6.2) isotianila (224.049-04-1), (6.3) probenazol (27.605-76-1) e (6.4) tiadinila (223.580-51-6).

(7) inibidores da biossíntese de aminoácido e/ou proteína, por exemplo, (7.1) o andoprim (23.951-85-1), (7.2) blasticidin-S (2.079-00-7), (7.3) ciprodinil (121.552-61-2), (7.4) casugamicina (6.980-18-3), (7.5) hidrato de

hidroclorato de casugamicina (19.408-46-9), (7.6) mepenipirim (110.235-47-7) e (7.7) pirimetanil (53.112-28-0).

(8) inibidores da produção de ATP, por exemplo, (8.1) o acetato de fenantín, (900-95-8), (8.2) cloreto de fenantín (639-58-7), (8.3) hidróxido de fenantín (76-87-9), (8.4) e siltiofam (175.217-20-6).

(9) inibidores da síntese de parede celular, por exemplo, (9.1) o bentiavalicarb (177.406-68-7), (9.2) dimetomorf (110.488-70-5), (9.3) flumorf (211.867-47-9), (9.4) iprovalicarb (140.923-17-7), (9.5) mandipropamida (374.726-62-2), (9.6) polioxinas (11.113-80-7), (9.7) polioxorim (22.976-86-9), (9.8) validamicina A (37.248-47-8) e (9.9) valifenalato (283.159-94-4; 283.159-90-0).

(10) inibidores da síntese de lipídio e de membrana, por exemplo, (10.1) a bifenila (92-52-4), (10.2) cloroneb (2.675-77-6), (10.3) diclorana (99-30-9), (10.4) edifenfós (17.109-49-8), (10.5) etridiazol (2.593-15-9), (10.6) iodocarb (55.406-53-6), (10.7) ipobenfós (26.087-47-8), (10.8) isoprotiolano (50.512-35-1), (10.9) propamocarb (25.606-41-1), (10.10) cloreto de propamocarb (25.606-41-1), (10.11) protiocarb (19.622-08-3), (10.12) pirazofós (13.457-18-6), (10.13) quintozeno (82-68-8), (10.14) tecnazeno (117-18-0) e (10.15) tolclófós-metila (57.018-04-9).

(11) inibidores da biossíntese de melanina, por exemplo, (11.1) o carpropamida (104.030-54-8), (11.2) diclocimet (139.920-32-4), (11.3) fenoxanil (115.852-48-7), (11.4) ftalida (27.355-22-2), (11.5) piriqilon (57.369-32-1) e (11.6) triciclazol (41.814-78-2).

(12) inibidores da síntese de ácido nucléico, por exemplo, (12.1) benalaxil (71.626-11-4), (12.2) benalaxil-M (98.243-83-5) (12.3) bupirimato (41.483-43-6), (12.4) clozelacon (67.932-85-8), (12.5) dimetirimol (5.221-53-4), (12.6) etirimol (23.947-60-6), (12.7) furalaxil (57.646-30-7), (12.8) himexazol (10.004-44-1), (12.9) metalaxil (57.837-19-1), (12.10) metalaxil -M (70.630-17-

0), (12.11) ofurace (58.810-48-3), (12.12) oxadixil (77.732-09-3) e (12.13) ácido oxolínico (14698-29-4).

(13) inibidores da transdução de sinal, por exemplo, (13.1) o clozolinato (84.332-86-5), (13.2) fenpiclonil (74.738-17-3), (13.3) fludioxonil
5 (131.341-86-1), (13.4) iprodiona (36.734-19-7), (13.5) procimidona (32.809-16-8), (13.6) quinoxifen (124.495-18-7) e (13.7) vinclozolina (50.471-44-8).

(14) compostos capazes de agir como um desacoplador como, por exemplo, (14.1) o binapacril (485-31-4), (14.2) dinocap (131-72-6), (14.3) ferimzona (89.269-64-7), (14.4) fluazinam (79.622-59-6) e (14.5) meptildinocap
10 (131-72-6).

(15) compostos adicionais como, por exemplo, (15.1) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-diidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.2) 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil 1H-imidazol-1-carbotioato (111.227-17-9),
15 (15.3) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina (13.108-52-6), (15.4) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona (221.451-58-7), (15.5) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-diidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-il)etanona, (15.6) 2-butoxi-6-iodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.7) 2-fenilfenol e sais (90-43-7), (15.8) 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrila (17.824-85-0), (15.9) 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, (15.10) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.11) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.12) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.13) 5-cloro-N'-fenil-N'-prop-2-in-1-iltiofeno-2-sulfonoidrazida (134-31-6), (15.14) 5-metil-6-octil-3,7-diidro[1,2,4]triazol[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.15) ametocradin (865.318-97-4), (15.16) bentiazol (21.564-17-0), (15.17) betoxazin (163.269-30-5), (15.18) capsimicin (70.694-08-5), (15.19) carvona (99-49-0), (15.20) quinometinato (2439-01-2), (15.21) clazafenona (688.046-61-9), (15.22) cufraneb (11.096-18-7), (15.23)

ciflufenamida (180.409-60-3), (15.24) cimoxanil (57.966-95-7), (15.25)
 cipro sulfamida (221.667-31-8), (15.26) dazomet (533-74-4), (15.27) debacarb
 (62.732-91-6), (15.28) diclorfeno (97-23-4), (15.29) diclomezina (62.865-36-5),
 (15.30) difenzoquat (43222-48-6), (15.31) metilsulfato de difenzoquat (43.222-
 5 48-6), (15.32) difenilamina (122-39 -4), (15.33) ecomate, (15.34) (2Z)-3-amino-
 2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de etila, (15.35) flumetover (154.025-04-4), (15.36)
 fluoroimida (41.205-21-4), (15.37) flusulfamida (106.917-52-6), (15.38) flutianil
 (304.900-25-2), (15.39) fosetil alumínio (39.148-24-8), (15.40) fosetil cálcio,
 (15.41) fosetil sódio (39.148-16-8), (15.42) hexaclorobenzeno (118-74-1),
 10 (15.43) irumamicina (81.604-73-1), (15.44) metassulfocarb (66.952-49-6),
 (15.45) isotiocianato de metila (556-61-6), (15.46) metrafenona (220.899-03-6),
 (15.47) mildiomicina (67.527-71-3), (15.48) N-(4-clorobenzil)-3-[3-metóxi-4-
 (prop-2-in-1-ilóxi)fenil]propanaimida, (15.49) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-
 methóxi-4-(prop-2-in-1-ilóxi)fenil]propanamida, (15.50) N-[(5-bromo-3-
 15 cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, (15.51) N-[1-(5-bromo-
 3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, (15.52) N-[1-(5-bromo-
 3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluor-4-iodopiridina-3-carboxamida, (15.53) N-[(E)-
 [(ciclopropilmetóxi)imino][6-(difluorometóxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-
 fenilacetamida, (15.54) N-[(Z)-[(ciclopropilmetóxi)imino][6-(difluorometóxi)-2,3-
 20 difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida (221.201-92-9), (15.55) natamicina (7681-
 93 -8), (15.56) dimetilditiocarbamato de níquel (15.521-65-0), (15.57) nitrotal
 isopropílico (10.552-74-6), (15.58) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-
 pirazol-1-il]acetil}piperidina-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetra-hidronaftalen-1-il]-1,3-
 tiazol-4-carboxamida, (15.59) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-
 25 1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetra-hidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-
 carboxamida, (15.60) octilinona (26.530-20-1), (15.61) oxamocarb (917.242-12-
 7), (15.62) oxifentiina (34.407-87-9), (15.63) pentaclorofenol e sais (87-86-5),
 (15.64) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilideno]amino]oxi]metil}piridin-2-

il) carbamato de pentila, (15.65) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.66) fenotrina, (15.67) ácido fosfórico e seus sais (13.598-36-2), (15.68) fosetilato de propamocarb, (15.69) propanosina de sódio (88.498-02-6), (15.70) proquinazid (189.278-12-4), (15.71) pirrolnitrina (1.018-71-9) (conhecido a partir de EP-A 1 559 320), (15.72) quinolin-8-ol (134-31-6), (15.73) sulfato de quinolin-8-ol (2:1) (sal) (134-31-6), (15.74) fenpirazamina (473.798-59-3), (15.75) tebufloquin (376.645-78-2), (15.76) tecloftalam (76.280-91-6), (15.77) tolifenida (304.911-98-6), (15.78) triazoxida (72.459-58-6), (15.79) triclamida (70.193-21-4), (15.80) zarilamid (84.527-51-5) e seus sais.

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 a partir da seguinte lista: bronopol, diclorofeno, 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, também 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 de fungos fitopatogênicos de plantas ou culturas, caracterizado pelo fato de que um composto de Fórmula (I) ou uma composição fungicida, de acordo com a presente invenção, é aplicada à semente, à planta ou ao fruto da planta ou ao solo em que a planta cresce ou é desejável que 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 transplantadas e plantas, ou plantas transplantadas. Este método de tratamento também pode ser útil para 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
 5 talos, folhas, flores e frutos da planta em questão.

Dentre as plantas que podem ser protegidas pelo método de acordo com a presente invenção, pode ser feita menção ao algodão; linho; vinha; culturas de frutos ou vegetais tais como *Rosaceae sp.* (por exemplo, frutos com caroço tais como maçãs e peras, mas também frutos de um caroço
 10 tais como damasco, amêndoa e pêssegos), *Ribesioideae sp.*, *Junglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (por exemplo, bananeiras e bananas tipo plantain), *Rubiaceae sp.*, *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por exemplo, limões, laranjas e toronja); *Solanaceae sp.* (por
 15 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, morangos); culturas maiores tais como *Graminae sp.* (por exemplo, milho, grama ou cereais, tais como trigo, arroz, cevada e tritcale), *Asteraceae sp.* (por
 20 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); *Elaeis sp.* (por exemplo, óleo de palma); horticulturas e culturas em florestas; bem como homólogos geneticamente modificados destas culturas.

25 O método de tratamento de acordo com a presente invenção pode ser utilizado no tratamento dos organismos geneticamente modificados (GMOs), por exemplo, vegetais ou sementes. Os vegetais geneticamente modificados (ou plantas transgênicas) são vegetais em que um gene

heterólogo foi integrado estavelmente no genoma. A expressão "gene heterólogo" significa essencialmente um gene que é fornecido ou montado fora do vegetal e então introduzido no genoma nuclear, do cloroplasto ou mitocondrial e fornece à planta transformada novas ou melhores propriedades agronômicas ou outras propriedades pela expressão de uma proteína ou polipeptídeo de interesse ou pela regulação negativa ou pelo silenciamento de outro(s) gene(s) que estão presentes no vegetal (utilizando, por exemplo, a tecnologia antisenso, tecnologia de co-supressão ou RNA de interferência – tecnologia do RNAi). Um gene heterólogo que está localizado no genoma também é denominado um transgene. Um transgene que é definido por sua localização particular no genoma vegetal é denominado uma transformação ou um evento transgênico.

Dependendo das espécies vegetais ou dos cultivares vegetais, sua localização e condições de crescimento (solos, clima, período de vegetação, dieta), o tratamento de acordo com a presente invenção também pode resultar em efeitos superaditivos ("sinérgicos"). Portanto, por exemplo, as taxas de aplicação reduzidas e/ou a ampliação do espectro de atividade e/ou um aumento na atividade dos compostos e composições ativas que podem ser utilizadas de acordo com a presente invenção, melhor crescimento vegetal, maior tolerância às temperaturas altas ou baixas, maior tolerância à aridez ou ao teor de água ou sal do solo, maior desempenho de florescimento, colheita mais fácil, maturação acelerada, maiores rendimentos da colheita, frutos maiores, maior altura do vegetal, cor da folha mais verde, florescimento precoce, maior qualidade e/ou um valor nutricional maior dos produtos colhidos, maior concentração de açúcar dentro dos frutos, melhor estabilidade de armazenamento e/ou processabilidade dos produtos colhidos são possíveis, que excedem os efeitos que eram realmente os esperados.

Em determinadas taxas de aplicação, as combinações do

composto ativo de acordo com a presente invenção também podem possuir um efeito de fortificação nos vegetais. Consequentemente, elas também são apropriadas para a mobilização do sistema de defesa no vegetal contra o ataque pelo fungo e/ou microorganismo e/ou vírus fitopatogênico indesejável.

- 5 Isto pode, caso apropriado, ser uma das razões da maior atividade das combinações de acordo com a presente invenção, por exemplo, contra o fungo. As substâncias de fortificação do vegetal (indução da resistência) devem ser entendidas como significando, no presente contexto, aquelas substâncias ou as combinações de substâncias que são capazes de estimular o sistema de
- 10 defesa dos vegetais de tal modo que, quando subsequentemente inoculado com o fungo e/ou os microorganismos e/ou os vírus fitopatogênicos indesejados, os vegetais tratados mostram um grau substancial de resistência a estes fungos e/ou microorganismos e/ou vírus fitopatogênico indesejados. No presente caso, o fungo e/ou microorganismos e/ou vírus fitopatogênicos
- 15 indesejados devem ser entendido significando o fungo, a bactéria e o vírus fitopatogênico. Portanto, as substâncias de acordo com a presente invenção podem ser empregadas para a proteção de vegetais contra o ataque dos patógenos mencionados acima dentro de certo período de tempo após o tratamento. O período de tempo cuja proteção é realizada se prolonga, em
- 20 geral, de 1 a 10 dias, de preferência, de 1 a 7 dias, após o tratamento dos vegetais com os compostos ativos.

Os cultivares de vegetais e os vegetais que devem, de preferência, ser tratados de acordo com a presente invenção incluem todos os vegetais que possuem o material genético que proporciona traços úteis,

25 particularmente vantajosos para estes vegetais (caso obtido pela reprodução e/ou por meios biotecnológicos).

Os cultivares de vegetais e os vegetais que também devem ser tratados de acordo com a presente invenção são resistentes contra um ou mais

problemas bióticos, isto é, ditos vegetais mostram uma melhor defesa contra as pestes animais e microbianas, tal como contra os nemátodos, insetos, ácaros, fungos fitopatogênicos, bactéria, vírus e/ou viróides.

Os cultivares de vegetais e os vegetais que também podem ser
5 tratados de acordo com a presente invenção são aqueles vegetais que são resistentes a um ou mais problemas bióticos. As condições do problema biótico podem incluir, por exemplo, a aridez, a exposição à baixa temperatura, exposição ao calor, problema osmótico, encharcamento, maior salinidade do solo, maior exposição mineral, exposição ao ozônio, alta exposição à luz,
10 disponibilidade limitada de nutrientes de nitrogênio, disponibilidade limitada dos nutrientes fosforosos, rejeição da sombra.

Os cultivares de vegetais e os vegetais que também podem ser tratados de acordo com a presente invenção são aqueles vegetais caracterizados pelas melhores características de rendimento. O maior
15 rendimento em ditos vegetais pode ser resultado, por exemplo, da melhor fisiologia do vegetal, crescimento e desenvolvimento, tal como a eficiência do uso de água, eficiência de retenção de água, melhor utilização de nitrogênio, melhor assimilação do carbono, melhor fotossíntese, melhor eficiência da germinação e maturação acelerada. O rendimento pode ainda ser afetado pela
20 melhor arquitetura vegetal (sob condições de tensão e não tensão), incluindo, mas não limitado a, florescimento precoce, controle do florescimento para a produção de semente híbrida, vigor da muda, tamanho do vegetal, número e distância de internodos, crescimento da raiz, tamanho da semente, tamanho do fruto, tamanho da vagem, número de vagem ou espiga, número de semente
25 por vagem ou espiga, massa da semente, melhor preenchimento da semente, dispersão reduzida da semente, deiscência da vagem reduzida e resistência ao acamamento. Os traços de rendimento adicionais incluem a composição da semente, tal como o teor de carboidrato, teor de proteína, teor de óleo e

composição, valor nutricional, redução em compostos antinutricionais, melhor processabilidade e melhor estabilidade de armazenamento.

Os vegetais que podem ser tratados de acordo com a presente invenção são vegetais híbridos que já expressam a característica de heterose ou vigor híbrido que resulta, em geral, no maior rendimento, vigor, saúde e resistência em relação aos fatores de tensão bióticos e abióticos. Tais vegetais são tipicamente fabricados ao cruzar uma linhagem progenitora de macho estéril natural (a progenitora fêmea) com outra linhagem progenitora de macho fértil natural (o progenitor macho). A semente híbrida é tipicamente colhida a partir dos vegetais de macho estéril e comercializadas aos cultivadores. Os vegetais estéreis machos podem ser, algumas vezes, produzidos (por exemplo, no milho) pelo despendoamento, isto é, a remoção mecânica dos órgãos reprodutivos macho (ou as flores macho) mas, tipicamente, a esterilidade do macho é o resultado dos determinantes genéticos no genoma vegetal. Neste caso e, especialmente quando a semente é o produto desejado a ser cultivado a partir dos vegetais híbridos, é tipicamente útil assegurar que a fertilidade do macho nos vegetais híbridos é completamente restabelecida. Isto pode ser realizado ao assegurar que os progenitores machos possuem genes restabelecadores da fertilidade apropriados que são capazes de restabelecer a fertilidade do macho nos vegetais híbridos que contêm os determinantes genéticos responsáveis pela esterilidade do macho. Os determinantes genéticos para a esterilidade do macho podem estar localizados no citoplasma. Os exemplos da esterilidade macho citoplasmática (CMS) foram, por exemplo, descritos nas espécies de Brassica (documentos WO 1992/005251, WO 1995/009910, WO 1998/27806, WO 2005/002324, WO 2006/021972 e US 6.229.072). Entretanto, os determinantes genéticos para a esterilidade do macho também podem estar localizados no genoma nuclear. Os vegetais estéreis machos também podem ser obtidos pelos métodos biotecnológicos do

vegetal, tais como de engenharia genética. Um meio particularmente útil para a obtenção dos vegetais estéreis machos é descrito no documento WO 1989/10396 em que, por exemplo, uma ribonuclease, tal como a barnase é expressa seletivamente nas camadas de células nos estames. A fertilidade
5 pode ser então restabelecida pela expressão na camada de células de um inibidor de ribonuclease, tal como o barstar (por exemplo, no documento WO 1991/002069).

Os cultivares de vegetais e os vegetais (obtidos pelos métodos biotecnológicos vegetais, tais como de engenharia genética) que também
10 podem ser tratados de acordo com a presente invenção são vegetais tolerantes a herbicidas, isto é, vegetais tornados tolerantes a um ou mais determinados herbicidas. Tais vegetais podem ser obtidos por transformação genética, ou pela seleção de vegetais contendo uma mutação que proporciona tal tolerância herbicida.

15 Os vegetais tolerantes ao herbicida são, por exemplo, vegetais tolerantes ao glifosato, isto é, vegetais tornados tolerantes ao glifosato herbicida ou seus sais. Os vegetais podem ser produzidos tolerantes ao glifosato através de meios diferentes. Por exemplo, os vegetais tolerantes ao glifosato podem ser obtidos pela transformação do vegetal com um gene
20 codificador da enzima 5-enolpiruvilchiquimato-3-fosfato sintase (EPSPS). Os exemplos de tais genes EPSPS são o gene AroA (mutante CT7) da bactéria *Salmonella typhimurium* (Comai et al., *Science* (1983), 221, 370-371), o gene CP4 da bactéria *Agrobacterium sp.* (Barry et al., *Curr. Topics Plant Physiol.* (1992), 7, 139-145), os genes que codificam uma petúnia EPSPS (Shah et al.,
25 *Science* (1986), 233, 478-481), o tomate EPSPS (Gasser et al., *J. Biol. Chem.* (1988), 263, 4280-4289), ou um Eleusine EPSPS (documento WO 2001/66704). Também pode ser um EPSPS mutado, conforme descrito, por exemplo, nos documentos EP-A 0837944, WO 2000/066746, WO 2000/066747

ou WO 2002/026995. Os vegetais tolerantes ao glifosato também podem ser obtidos pela expressão de um gene que codifica uma enzima glifosato óxido redutase conforme descrito nos documentos US 5.776.760 e US 5.463.175. Os vegetais tolerantes ao glifosato também podem ser obtidos pela expressão de

5 um gene que codifica uma enzima glifosato acetil transferase conforme descrito, por exemplo, nos documentos WO 2002/036782, WO 2003/092360, WO 2005/012515 e WO 2007/024782. Os vegetais tolerantes ao glifosato também podem ser obtidos pela seleção de vegetais contendo mutações de ocorrência natural dos genes mencionados acima, conforme descrito, por

10 exemplo, nos documentos WO 2001/024615 ou WO 2003/013226. Outros vegetais resistentes ao herbicida são, por exemplo, vegetais que são produzidos tolerantes aos herbicidas inibindo a enzima glutamina sintase, tal como o bialafós, a fosfinotricina ou o glufosinato. Tais vegetais podem ser obtidos pela expressão de uma enzima detoxificante do herbicida ou uma

15 enzima glutamina sintase mutante que é resistente à inibição. Tal enzima detoxificante eficiente é uma enzima que codifica uma fosfinotricina acetiltransferase (tal como a proteína bar ou pat das espécies *Streptomyces*). Os vegetais que expressam uma acetiltransferase fosfinotricina exógena são, por exemplo, descritos nos documentos US 5.561.236; US 5.648.477; US

20 5.646.024; US 5.273.894; US 5.637.489; US 5.276.268; US 5.739.082; US 5.908.810 e US 7.112.665.

Os vegetais tolerantes ao herbicida adicionais também são vegetais que são produzidos tolerantes aos herbicidas que inibem a enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenase (HPPD). As hidroxifenilpiruvatodioxigenases

25 são enzimas que catalisam a reação em que a *para*-hidroxifenilpiruvato (HPP) é transformada em homogentisato. Os vegetais tolerantes aos inibidores HPPD podem ser transformados com um gene que codifica uma enzima HPPD resistente de ocorrência natural ou um gene que codifica uma enzima HPPD

mutada conforme descrito nos documentos WO 1996/038567, WO 1999/024585 e WO 1999/024586. A tolerância dos inibidores HPPD também pode ser obtida pela transformação dos vegetais com os genes que codificam determinadas enzimas que possibilitam a formação de homogentisato apesar da inibição da enzima HPPD nativa pelo inibidor de HPPD. Tais vegetais e genes são descritos nos documentos WO 1999/034008 e WO 2002/36787. A tolerância dos vegetais aos inibidores HPPD também pode ser melhorada pela transformação de vegetais com um gene que codifica uma enzima prefenato desidrogenase em adição a um gene que codifica uma enzima tolerante ao HPPD, conforme descrito no documento WO 2004/024928.

Ainda, os vegetais resistentes ao herbicida adicionais são vegetais que são produzidos tolerantes aos inibidores da acetolactase sintase (ALS). Os inibidores ALS conhecidos incluem, por exemplo, os herbicidas de sulfoniluréia, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos e/ou sulfonilaminocarbonil triazolinona. As mutações diferentes na enzima ALS (também conhecidas como acetohidroxiácido sintase, AHAS) são conhecidas por conferir tolerância aos diferentes herbicidas e grupos de herbicidas, conforme descritos, por exemplo, em Tranel and Wright, *Weed Science* (2002), 50, 700 – 712, mas também nos documentos US 5.605.011, US 5.378.824, US 5.141.870 e US 5.013.659. A produção dos vegetais tolerantes de sulfoniluréia e dos vegetais tolerantes de imidazolinona é descrita nos documentos US 5.605.011; US 5.013.659; US 5.141.870; US 5.767.361; US 5.731.180; US 5.304.732; US 4.761.373; US 5.331.107; US 5.928.937; e US 5.378.824; e no documento WO 1996/033270. Outros vegetais tolerantes de imidazolinona também são descritos, por exemplo, nos documentos WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351 e WO 2006/060634. Os vegetais tolerantes de sulfoniluréia e de imidazolinona adicionais também são descritos, por exemplo,

no documento WO 2007/024782.

Os vegetais tolerantes a imidazolinona e/ou sulfoniluréia podem ser obtidos pela mutagênese induzida, pela seleção em culturas de células na presença do herbicida ou reprodução da mutação, conforme descrito, por exemplo, para as sojas no documento US 5.084.082, para o arroz no documento WO 1997/41218, para o açúcar de beterraba nos documentos US 5.773.702 e WO 1999/057965, para a alface no documento US 5.198.599, ou para o girassol no documento WO 2001/065922.

Os cultivares de vegetais e os vegetais (obtidos pelos métodos biotecnológicos vegetais, tais como de engenharia genética), que também podem ser tratados de acordo com a presente invenção, são vegetais transgênicos resistentes aos insetos, isto é, vegetais tornados resistentes ao ataque de determinados insetos alvo. Tais vegetais podem ser obtidos pela transformação genética, ou pela seleção de vegetais contendo uma mutação que proporciona tal resistência ao inseto.

Um “vegetal transgênico resistente ao inseto”, conforme utilizado no presente, inclui qualquer vegetal que contém pelo menos um transgene que compreende uma sequência codificadora que codifica:

(1) uma proteína cristal inseticida do *Bacillus thuringiensis* ou uma porção do mesmo inseticida, tal como as proteínas de cristal inseticida listadas por Crickmore et al., *Microbiology and Molecular Biology Reviews* (1998), 62, 807-813, atualizado por Crickmore et al., (2005) na nomenclatura da toxina do *Bacillus thuringiensis*, online em: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), ou suas porções inseticidas, por exemplo, proteínas das classes de proteína Cry como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa ou Cry3Bb ou suas porções inseticidas; ou

(2) uma proteína cristal do *Bacillus thuringiensis* ou uma porção do mesmo, que é inseticida na presença de uma segunda proteína cristal do

Bacillus thuringiensis ou uma porção do mesmo, tal como a toxina binária fabricada das proteínas cristal Cry34 e Cry35 (Moellenbeck et al., *Nat. Biotechnol.* (2001), 19, 668 – 72; Schnepf et al., *Applied Environm. Microbiol.* (2006), 71, 1765 – 1774); ou

5 (3) uma proteína inseticida híbrida que compreende as partes de diferentes proteínas cristal inseticida do *Bacillus thuringiensis*, tal como um híbrido das proteínas de (1) acima ou um híbrido das proteínas de (2) acima, por exemplo, a proteína Cry1A.105 produzida pelo evento do milho MON98034 (documento WO 2007/027777); ou

10 (4) uma proteína de qualquer um de (1) a (3) acima, em que alguns, particularmente, de 1 a 10 aminoácidos foram substituídos por outros aminoácidos para obter uma maior atividade inseticida em uma espécie de inseto alvo e/ou para expandir o intervalo das espécies de inseto alvo afetadas, e/ou por causa das mudanças introduzidas na codificação do DNA durante a
15 clonagem ou a transformação, tal como a proteína Cry3Bb1 nos eventos do milho MON863 ou MON88017, ou a proteína Cry3A no evento do milho MIR604;

 (5) uma proteína inseticida secretada pelo *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus* ou uma porção inseticida do mesmo, tal como as proteínas
20 inseticidas vegetativas (VIP) listadas em: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por exemplo, as proteínas da classe de proteína VIP3Aa; ou

 (6) uma proteína secretada pelo *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus* que é inseticida na presença de uma segunda proteína secretada do
25 *Bacillus thuringiensis* ou *Bacillus cereus*, tal como a toxina binária constituída das proteínas VIP1A e VIP2A (documento WO 1994/21795); ou

 (7) uma proteína inseticida híbrida que compreende as partes de diferentes proteínas secretadas diferentes pelo *Bacillus thuringiensis* ou

Bacillus cereus, tal como um híbrido das proteínas em (1) acima ou um híbrido de proteínas em (2) acima; ou

(8) uma proteína de qualquer um de (1) a (3) acima, em que alguns, particularmente, de 1 a 10 aminoácidos foram substituídos por outros aminoácidos para obter uma maior atividade inseticida em uma espécie de inseto alvo e/ou para expandir o intervalo das espécies de inseto alvo afetadas, e/ou por causa das mudanças introduzidas na codificação do DNA durante a clonagem ou a transformação (enquanto ainda codifica uma proteína inseticida), tal como a proteína VIP3Aa no evento do algodão COT102.

Obviamente, um vegetal transgênico resistente ao inseto, conforme utilizado no presente, também inclui qualquer vegetal que compreende uma combinação de genes que codifica as proteínas de qualquer uma das classes acima de 1 a 8. Em uma realização, um vegetal resistente ao inseto contém mais de um transgene que codifica uma proteína de qualquer uma das classes acima de 1 a 8, para expandir o intervalo de espécies de inseto alvo afetadas na utilização de diferentes proteínas direcionadas em diferentes espécies de insetos alvo, ou para atrasar o desenvolvimento da resistência do inseto às plantas pela utilização de diferentes proteínas inseticidas nas mesmas espécies de inseto alvo, mas possuindo um diferente mecanismo de ação, tal como a ligação a diferentes sítios de ligação ao receptor no inseto.

Os cultivares de vegetais e os vegetais (obtidos pelos métodos biotecnológicos vegetais, tais como engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a presente invenção são tolerantes às tensões abióticas. Tais vegetais podem ser obtidos pela transformação genética ou pela seleção de vegetais que contêm uma mutação que proporciona tal resistência à tensão. Os vegetais de tolerância à tensão particularmente úteis incluem:

(a) vegetais que contêm um transgene capaz de reduzir a

expressão e/ou a atividade do gene poli(ADP ribose)polimerase (PARP) nas células vegetais ou nos vegetais conforme descrito nos documentos WO 2000/004173 ou WO 2006/045633 ou PCT/EP 07/004142;

5 (b) vegetais que contém um transgene intensificador da tolerância à tensão capaz de reduzir a expressão e/ou a atividade dos genes que codificam o PARG dos vegetais ou células vegetais, conforme descrito, por exemplo, no documento WO 2004/090140;

10 (c) vegetais que contém um transgene intensificador da tolerância à tensão que codifica uma enzima funcional vegetal da via de síntese da nicotinamida adenina dinucleotídeo selvagem incluindo a nicotinamidase, nicotinato fosforribosiltransferase, ácido nicotínico mononucleotídeo adenil transferase, nicotinamida adenina dinucleotídeo sintetase ou nicotina amida fosforribosiltransferase, conforme descrito, por exemplo, nos documentos WO 2006/032469 ou WO 2006/133827 ou PCT/EP 07/002433.

15 Os cultivares de vegetais e os vegetais (obtidos pelos métodos biotecnológicos vegetais, tais como de engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a presente invenção mostram uma quantidade, qualidade e/ou estabilidade de armazenamento alterada do produto colhido e/ou propriedades alteradas dos ingredientes específicos do
20 produto colhido, tal como:

(1) vegetais transgênicos que sintetizam um amido modificado, que, em suas características físico-químicas, em particular, o teor de amilose ou a proporção de amilose/ amilopectina, o grau de ramificação, o comprimento de cadeia médio, a distribuição da cadeia lateral, o comportamento da
25 viscosidade, a força gelificante, o tamanho do grão de amido e/ou a morfologia do grão de amido são mudadas em comparação com o amido sintetizado nas plantas ou células vegetais do tipo selvagem, tal que isto é mais apropriado para aplicações especiais. Ditos vegetais transgênicos que sintetizam um

amido modificado estão descritos, por exemplo, nos documentos EP 0.571.427, WO 1995/004826, EP 0.719.338, WO 1996/15248, WO 1996/19581, WO 1996/27674, WO 1997/11188, WO 1997/26362, WO 1997/32985, WO 1997/42328, WO 1997/44472, WO 1997/45545, WO 1998/27212, WO 1998/40503, WO99/58688, WO 1999/58690, WO 1999/58654, WO 2000/008184, WO 2000/008185, WO 2000/008175, WO 2000/28052, WO 2000/77229, WO 2001/12782, WO 2001/12826, WO 2002/101059, WO 2003/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 2000/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 2002/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP 07090007.1, EP 07090009.7, WO 2001/14569, WO 2002/79410, WO 2003/33540, WO 2004/078983, WO 2001/19975, WO 1995/26407, WO 1996/34968, WO 1998/20145, WO 1999/12950, WO 1999/66050, WO 1999/53072, US 6.734.341, WO 2000/11192, WO 1998/22604, WO 1998/32326, WO 2001/98509, WO 2001/98509, WO 2005/002359, US 5.824.790, US 6.013.861, WO 1994/004693, WO 1994/009144, WO 1994/11520, WO 1995/35026, WO 1997/20936;

(2) vegetais transgênicos que sintetizam polímeros de carboidrato não amido ou que sintetizam polímeros de carboidrato de não amido com propriedades alteradas em comparação com os vegetais do tipo selvagem sem modificação genética. Os exemplos são os vegetais que produzem a polifrutose, especialmente do tipo inulina e levan, conforme descrito nos documentos EP 0.663.956, WO 1996/001904, WO 1996/021023, WO 1998/039460, e WO 1999/024593, vegetais que produzem alfa 1,4 glicanos, conforme descrito nos documentos WO 1995/031553, US 2002/031826, US 6.284.479, US 5.712.107, WO 1997/047806, WO 1997/047807, WO

1997/047808 e WO 2000/014249, vegetais que produzem alfa-1,6 ramificado alfa-1,4-glicanos, conforme descrito no documento WO 2000/73422, vegetais que produzem alternan, conforme descrito nos documentos WO 2000/047727, EP 06077301.7, US 5.908.975 e EP 0.728.213;

- 5 (3) vegetais transgênicos que produzem hialuronan, por exemplo, como os descritos nos documentos WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006/304779 e WO 2005/012529.

Os cultivares de vegetais e os vegetais (obtidos pelos métodos biotecnológicos vegetais, tais como de engenharia genética) que também
10 podem ser tratados de acordo com a presente invenção são os vegetais, tais como os vegetais de algodão, com características de fibra alteradas. Tais vegetais podem ser obtidos pela transformação genética ou pela seleção de vegetais que contém uma mutação que proporciona tais características de fibra alteradas e incluem:

- 15 (a) vegetais, tais como os vegetais de algodão, contendo uma forma alterada de genes de celulose sintase, conforme descrito no documento WO 1998/000549;

- (b) vegetais, tais como os vegetais de algodão, contendo uma forma alterada de ácidos nucleicos homólogos do rsw2 ou rsw3 conforme
20 descrito no documento WO 2004/053219;

- (c) vegetais, tais como os vegetais de algodão, com uma maior expressão de sacarose fosfato sintase, conforme descrito no documento WO 2001/017333;

- (d) vegetais, tais como os vegetais de algodão, com uma maior
25 expressão de sacarose sintase, conforme descrito no documento WO 02/45485;

- (e) vegetais, tais como os vegetais de algodão, em que o tempo de ativação plasmodesmatal na base da célula da fibra é alterado, por

exemplo, através da regulação negativa da fibrasseletiva β 1,3-glucanase, conforme descrito no documento WO 2005/017157;

(f) vegetais, tais como os vegetais de algodão, possuindo fibras com reatividade alterada, por exemplo, através da expressão do gene N-acetilglicosamina transferase, incluindo os genes nodC e quitinsintase, conforme descrito no documento WO 2006/136351.

Os cultivares de vegetais e os vegetais (obtidos pelos métodos biotecnológicos vegetais, tais como de engenharia genética) que também podem ser tratados de acordo com a presente invenção são os vegetais, tais como as sementes oleaginosas de colza ou os vegetais de Brassica relacionados, com características de perfil de óleo alteradas. Tais vegetais podem ser obtidos pela transformação genética ou pela seleção de vegetais que contém uma mutação que proporciona tais características de óleo alteradas e incluem:

(a) vegetais, tais como as plantas de sementes oleaginosas de colza, produzindo óleo que possui um alto teor de ácido oléico, conforme descrito, por exemplo, nos documentos US 5.969.169, US 5.840.946 ou US 6.323.392 ou US 6.063.947;

(b) vegetais, tais como as plantas de sementes oleaginosas de colza, produzindo óleo que possui um baixo teor de ácido linolênico, conforme descrito nos documentos US 6.270.828, US 6.169.190 ou US 5.965.755;

(c) vegetais, tais como as plantas de sementes oleaginosas de colza, produzindo óleo que possui um baixo nível de ácidos graxos saturados, conforme descrito, por exemplo, no documento US 5.434.283.

Os vegetais transgênicos particularmente úteis que podem ser tratados de acordo com a presente invenção são os vegetais que compreendem um ou mais genes que codificam uma ou mais toxinas, tais como as seguintes que são comercializadas com os nomes comerciais Yield

Gard[®] (por exemplo, milho, algodão, sementes de soja), KnockOut[®] (por exemplo, milho), BiteGard[®] (por exemplo, milho), Bt-Xtra[®] (por exemplo, milho), StarLink[®] (por exemplo, milho), Bollgard[®] (algodão), Nucotn[®] (algodão), Nucotn 33B[®] (algodão), NatureGard[®] (por exemplo, milho), Protecta[®] e NewLeaf[®] (batata). Os exemplos de vegetais tolerantes ao herbicida que podem ser mencionados são as variedades de milho, variedades de algodão e variedades de semente de soja que são comercializadas com o nome comercial de Roundup Ready[®] (tolerância ao glifosato, por exemplo, milho, algodão, sementes de soja), Liberty Link[®] (tolerância à fosfinotricina, por exemplo, a semente oleaginosa de colza), IMI[®] (tolerância à imidazolinonas) e STS[®] (tolerância às sulfoniluréias, por exemplo, o milho). Os vegetais resistentes ao herbicida (vegetais gerados do modo convencional para a tolerância herbicida) que podem ser mencionados incluem as variedades comercializadas com o nome de Clearfield[®] (por exemplo, milho).

Os vegetais transgênicos particularmente úteis que podem ser tratados de acordo com a presente invenção são os vegetais que contêm os eventos de transformação ou a combinação dos eventos de transformação, que estão listados, por exemplo, nas bases de dado a partir das diversas agências regulatórias nacional e regional (vide, por exemplo, http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx e <http://www.agbios.com/dbase.php>).

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

Doenças do oídio, tais como:

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

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

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

5 Doenças da Ferrugem, tais como:

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

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

10 - Doença da *Phakopsora*, causada, por exemplo, pela *Phakopsora pachyrhizi* ou *Phakopsora meibomia*;

- Doença da *Puccinia*, causada, por exemplo, pela *Puccinia recondite*, *Puccinia graminis* ou *Puccinia striiformis*;

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

Doenças de oomicetes, tais como:

- Doença da *Albugo*, causada, por exemplo, pela *Albugo candida*;

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

20 - 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*;

25 - 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*;
- 5 - Doença da Cercospora, causada, por exemplo, pela *Cercospora beticola*;
- Doença da Cladosporium, causada, por exemplo, pela *Cladosporium cucumerinum*;
- 10 - Doença da Cochliobolus, causada, por exemplo, pela *Cochliobolus sativus* (Conidiaform: *Drechslera*, Sin: *Helminthosporium*) ou *Cochliobolus miyabeanus*;
- Doença da Colletotrichum, causada, por exemplo, pela *Colletotrichum lindemuthianum*;
- 15 - Doença da Cycloconium, causada, por exemplo, pela *Cycloconium oleaginum*;
- Doença da Diaporthe, causada, por exemplo, pela *Diaporthe citri*;
- Doença da Elsinoe, causada, por exemplo, pela *Elsinoe fawcettii*;
- 20 - 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*
- 25 *bidwelli*;
- 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 *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

5 - Doença da *Phaeosphaeria*, causada, por exemplo, pela *Phaeosphaeria nodorum*;

- Doença da *Pyrenophora*, causada, por exemplo, pela *Pyrenophora teres* ou *Pyrenophora tritici repentis*;

10 - Doença da *Ramularia*, causada, por exemplo, pela *Ramularia collo-cygni* ou *Ramularia areola*;

- Doença da *Rhynchosporium*, causada, por exemplo, pela *Rhynchosporium secalis*;

- Doença da *Septoria*, causada, por exemplo, pela *Septoria apii* ou *Septoria lycopersici*;

15 - 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:

20 - Doença da *Corticium*, causada, por exemplo, pela *Corticium graminearum*;

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

25 - Doença da *Gaeumannomyces*, causada, por exemplo, pela *Gaeumannomyces graminis*;

- Doença da *Rhizoctonia*, causada, por exemplo, pela *Rhizoctonia solani*;

- Doenças do *Sarocladium*, causadas, por exemplo, pelo

Sarocladium oryzae;

- Doenças *Sclerotium*, causadas, por exemplo, pela *Sclerotium oryzae*;

5 - Doença da *Tapesia*, causada, por exemplo, pela *Tapesia acuformis*;

- Doença da *Thielaviopsis*, causada, por exemplo, pela *Thielaviopsis basicola*;

Doenças da espiga e da panícula, tal como:

10 - 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 *Cladosporium spp.*;

15 - 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 zaeae*;

- Doença da *Monographella*, causada, por exemplo, pela *Monographella nivalis*;

Doença da fuligem e dos esporos, tais como:

25 - 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 do fruto 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 do Rhizopus, causada, por exemplo, pela *Rhizopus stolonifer*;

10 - Doença da Sclerotinia, causada, por exemplo, pela *Sclerotinia sclerotiorum*;

- Doença da Verticilium, causada, por exemplo, pela *Verticilium alboatrum*;

15 Decomposição da semente e dos habitantes do solo, doenças do mofo, apodrecimento da planta, decomposição e cacho seco:

- Doença da Alternaria, causada, por exemplo, pela *Alternaria brassicicola*;

- Doença da Aphanomyces, causada, por exemplo, pela *Aphanomyces euteiches*;

20 - Doença da Ascochyta, causada, por exemplo, pela *Ascochyta lentis*;

- Doença da Aspergillus, causada, por exemplo, pela *Aspergillus flavus*;

25 - Doença da Cladosporium, causada, por exemplo, pela *Cladosporium herbarum*;

- Doença da Cochliobolus, causada, por exemplo, pela *Cochliobolus sativus* (Conidiaform: *Drechslera*, Sin: *Helminthosporium*);

- Doença da Colletotrichum, causada, por exemplo, pela

Colletotrichum coccodes;

- Doença do Fusarium, causada, por exemplo, pela *Fusarium culmorum*;

5 - Doença da Gibberella, causada, por exemplo, pela *Gibberella zeae*;

- Doença da Macrophomina, causada, por exemplo, pela *Macrophomina phaseolina*;

- Doença da Monographella, causada, por exemplo, pela *Monographella nivalis*;

10 - Doença da Penicillium, causada, por exemplo, pela *Penicillium expansum*;

- Doença da Phoma, causada, por exemplo, pela *Phoma lingam*;

- Doença de Phomopsis, causada, por exemplo, pela *Phomopsis sojae*;

15 - Doença da Phytophthora, causada, por exemplo, pela *Phytophthora cactorum*;

- Doença da Pyrenophora, causada, por exemplo, pela *Pyrenophora graminea*;

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

20 *oryzae*;

- Doença da Pythium, causada, por exemplo, pela *Pythium ultimum*;

- Doença da Rhizoctonia, causada, por exemplo, pela *Rhizoctonia solani*;

25 - Doença do Rhizopus, causada, por exemplo, pela *Rhizopus orizae*;

- Doença da Sclerotium, causada, por exemplo, pela *Sclerotium rolfsii*;

- Doença da Septoria, causada, por exemplo, pela *Septoria nodorum*;

- Doença da Typhula, causada, por exemplo, pela *Typhula incarnata*;

5 - Doença da Venturia, causada, por exemplo, pela *Venturia dahliae*;

Doenças do cancro, da giesta e da doença progressiva, tal como:

- Doença da Nectria, causada, por exemplo, pela *Nectria galligena*;

10 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:

- Doença da Exobasidium, causada, por exemplo, pela
15 *Exobasidium vexans*;

- 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*
20 *clamydospora*;

- Doença da Eutypa, causada, por exemplo, pela *Eutypa lata*;

- Doença da Ganoderma, causada, por exemplo, pela *Ganoderma boninense*;

- Doenças da Rigidoporus, causada por exemplo, pela
25 *Rigidoporus lignosus*;

Doenças das flores e das sementes, tal como:

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

Doenças do tubérculo, tal como:

- Doença da Rhizoctonia, causada, por exemplo, pela *Rhizoctonia solani*;

- Doença do Helminthosporium, causada, por exemplo, pela *Helminthosporium solani*;

5 Doenças da hérnia das crucíferas, tais como:

- Doença da Plasmodiophora, causada, por exemplo, pela *Plasmodiophora brassicae*;

Doenças causadas por organismos bacterianos, tais como:

- a espécie Xanthomonas, por exemplo, *Xanthomonas campestris*
10 *pv. oryzae*,

- as espécies de Pseudomonas, por exemplo, *Pseudomonas syringae pv. lachrymans*;

- as espécies de Erwinia, por exemplo, a *Erwinia amylovora*.

A composição de acordo com a presente invenção também pode
15 ser utilizada contra as doenças fúngicas sujeitas a crescerem sobre ou dentro
de troncos. O termo "tronco" significa todos os tipos de espécies de madeira, e
todos os tipos de trabalho nesta madeira destinada 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
20 presente invenção consiste principalmente em colocar em contato um ou mais
compostos da 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 composto ativo geralmente aplicada no método de
25 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 aplicações no
tratamento foliar. A dose de substância ativa aplicada é, em geral e
vantajosamente, de 2 a 200 g por 100 kg de semente, de preferência, de 3 a

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 de acordo com a presente invenção. Um técnico no assunto saberá como adaptar as doses de aplicação, notavelmente de acordo com a natureza da planta ou da cultura a ser tratada.

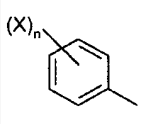
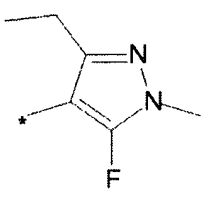
Os compostos ou misturas, de acordo com a presente invenção, também podem ser utilizados para a preparação da composição útil para tratar de maneira curativa ou preventiva as doenças fúngicas animais ou humanas tais como, por exemplo, micoses, dermatoses, doenças de *Trichophyton* e candidíases ou doenças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

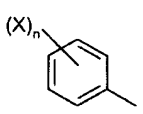
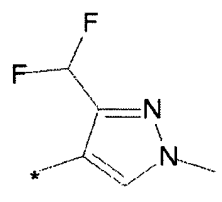
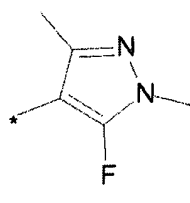
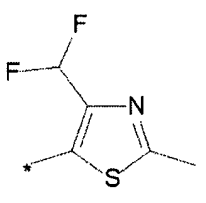
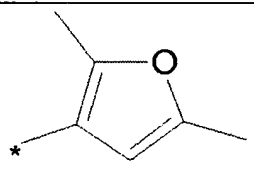
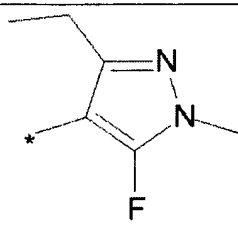
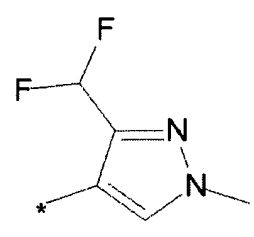
Os diversos aspectos da presente invenção serão agora ilustrados com referência à seguinte tabela dos compostos e exemplos e os seguintes exemplos de preparação ou eficácia.

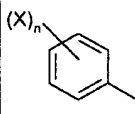
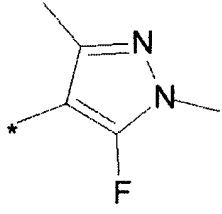
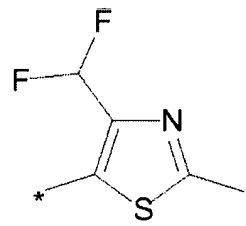
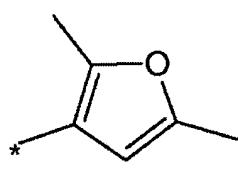
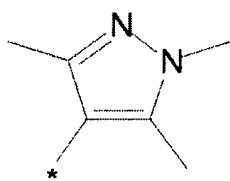
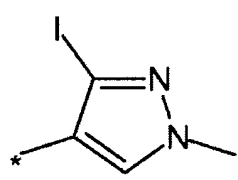
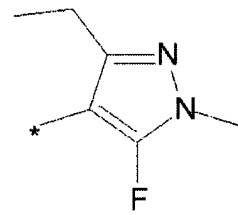
A tabela a seguir ilustra de maneira não limitante os exemplos dos compostos de Fórmula (I) de acordo com a presente invenção.

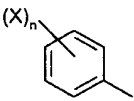
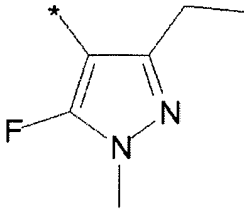
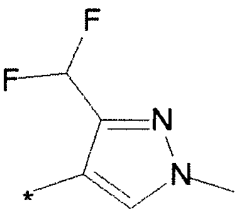
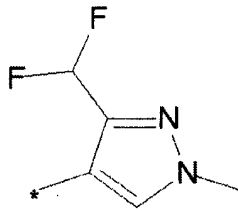
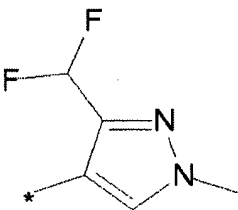
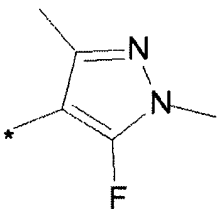
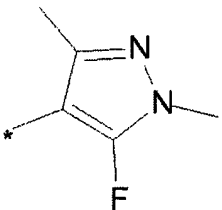
Na Tabela 1, M+H (Apcl+) significa o pico de íon molecular mais 1 a.m.u. (unidade de massa atômica) conforme observado em espectroscopia de massa por meio de ionização química com pressão atmosférica positiva.

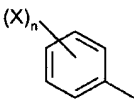
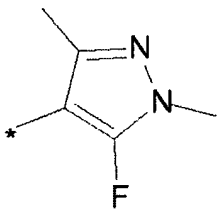
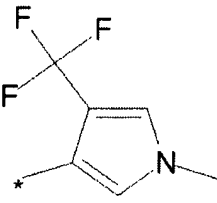
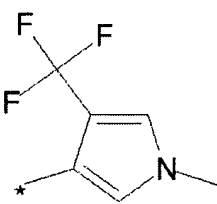
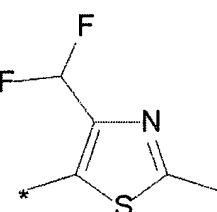
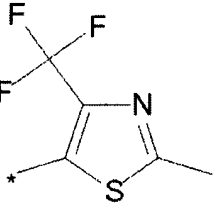
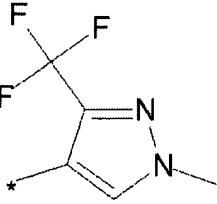
TABELA 1

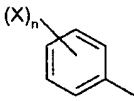
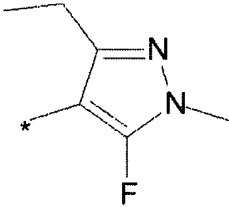
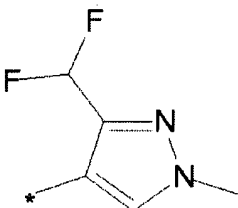
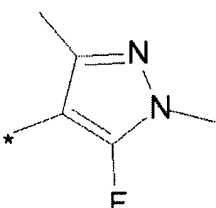
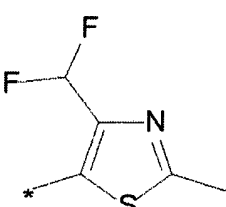
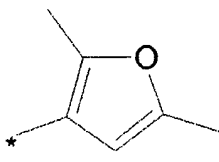
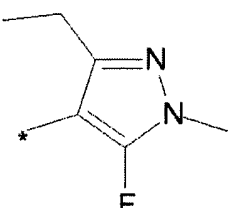
Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M +H)
1		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2-clorofenila	390

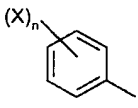
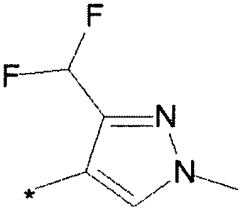
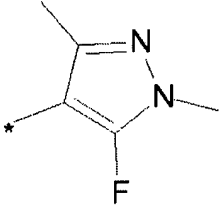
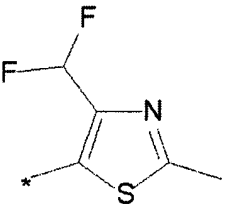
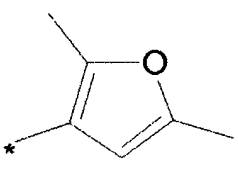
Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M +H)
2		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2- clorofenila	394
3		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2- clorofenila	376
4		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2- clorofenila	411
5		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2- clorofenila	358
6		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2,4- diclorofenila	424
7		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2,4- diclorofenila	428

Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M +H)
8		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2,4-diclorofenila	410
9		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2,4-diclorofenila	445
10		O	H	H	cPr	0			ciclopentila	2,4-diclorofenila	392
11		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	352
12		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	450
13		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	370

Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M + H)
14		O	H	H	cPr	1	H	H	ciclohexila	fenila	384
15		O	H	H	cPr	0			cis-ciclohexila	fenila	374
16		O	H	H	cPr	1	H	H	ciclohexila	fenila	388
17		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	374
18		O	H	H	cPr	0			cis-ciclohexila	fenila	356
19		O	H	H	cPr	1	H	H	ciclohexila	fenila	370

Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M + H)
20		S	H	H	cPr	0			cis-ciclohexila	fenila	372
21		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	391
22		S	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	407
23		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	391
24		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	409
25		O	H	H	cPr	0			trans-ciclohexila	fenila	392

Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M +H)
26		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2-clorofenila	404
27		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2-clorofenila	408
28		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2-clorofenila	390
29		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2-clorofenila	425
30		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2-clorofenila	372
31		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2,4-diclorofenila	438

Ex.	A	T	Z1	Z2	Z3	m	Z4	Z5	B		Massa (M + H)
32		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2,4-diclorofenila	442
33		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2,4-diclorofenila	424
34		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2,4-diclorofenila	459
35		O	H	H	cPr	0			ciclohexila	2,4-diclorofenila	406

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

EXEMPLOS

EXEMPLO 1

PREPARAÇÃO DO CIS-N-CICLOPROPIL-5-FLUOR-1,3-DIMETIL-N-(2-FENIL CICLOEXIL)-1H-PIRAZOL-4-CARBOXAMIDA (COMPOSTO 18)

Etapa 1: preparação do cis e trans-N-ciclopropil-2-

fenilciclohexanamina.

Em uma solução refrigerada de 2,78 mL (40 mmol) de ciclopropilamina e 2,87 mL (50 mmol) de ácido acético, junto com 5 g de peneiras moleculares de 3A, em 50 mL de metanol, são adicionados 3,5 g (20 mmol) de 2-fenilciclohexanona. A reação da mistura é agitada por 3,5 horas em refluxo. A mistura de reação é então resfriada a 0°C e 3 g (50 mmol) cianoboroidreto de sódio são adicionados lentamente e a mistura de reação é ainda agitada por 2 horas em refluxo. A mistura de reação resfriada é filtrada sobre uma torta de terra diatomácea. A torta é lavada duas vezes em 80 mL de metanol e os extratos metanólicos combinados são concentrados a vácuo. 100 mL de água são adicionados ao resíduo e o pH é ajustado para 12 com uma solução de hidróxido de sódio 1. A camada aquosa é extraída com 100 mL de acetato de etila. A camada orgânica é lavada duas vezes com salmoura e é secada por um sulfato de magnésio para gerar, após a concentração, 3,52 g de um óleo amarelo. A coluna cromatografia de sílica gel (gradiente de heptano/acetato de etila) produz 1,0 g (23% de rendimento) do cis-N-ciclopropil-2-fenilciclohexalamina como um óleo amarelo ($M + H = 216$) e 1,9 g (44% de rendimento) do trans-N-ciclopropil-2-fenilciclohexalamina como um óleo incolor ($M + H = 216$).

Etapa 2: preparação do cis-N-ciclopropil-5-fluoro-1,3-dimetil-N-(2-fenilciclohexil)-1H-pirazol-4-carboxamida.

À temperatura ambiente, uma solução de 180 mg (1,02 mmol) de cloreto de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonil em 1 mL de tetrahidrofurano é adicionada em gota a gota a uma solução de 200 mg (0,93 mmol) de cis-N-ciclopropil-2-fenilciclohexalamina e 100 mg (1,02 mmol) de trietilamina em 5 mL de tetrahidrofurano. A mistura de reação é agitada durante 2 horas a 70 °C. O solvente é removido a vácuo e 100 mL de água são adicionados ao resíduo. A camada aquosa é extraída duas vezes com acetato

de etila (2 x 50 mL) e as camadas orgânicas combinadas são sucessivamente lavadas com uma solução de 1 N de HCl, uma solução saturada de carbonato de potássio e salmoura e secas sobre um cartucho ChemElut™ para gerar, após a concentração, 380 mg de um óleo amarelo. A cromatografia em coluna
5 de sílica gel (gradiente de heptano/ acetato de etila) produz 160 mg (46% de rendimento) do cis-N-ciclopropil-5-fluoro-1,3-dimetil-N-(2-fenilciclohexil)-1H-pirazol-4-carboxamida como um óleo incolor (M + H = 356).

EXEMPLO DA PREPARAÇÃO GERAL

TIONAÇÃO DE UMA AMIDA DE FÓRMULA (I) EM APARELHOS CHEMSPEED.

10 Em um frasco de 13 mL Chemspeed™ é pesado 0,27 mmol de pentassulfito de fósforo (P₂S₅). 3 mL de uma solução 0,18 molar do amido (I) (0,54 mmol) em dioxano são adicionados e a mistura é aquecida em refluxo por duas horas. A temperatura é então resfriada a 80 °C e 2,5 mL de água são adicionados. A mistura é aquecida a 80 °C por mais uma hora. 2 mL de água
15 são então adicionados e a mistura de reação é extraída duas vezes com 4 mL de diclorometano. A fase orgânica é depositada em um cartucho de alumina básica (2 g) e eluída duas vezes por 8 mL de diclorometano. Os solventes são removidos e a derivativa tioamida bruta é analisada por LCMS e RMN. Os compostos insuficientemente puros são ainda purificados por LCMS
20 preparativo.

EXEMPLO A

TESTE IN VIVO DE PUCCINIA RECONDITA (FERRUGEM DA FOLHA)

Os ingredientes ativos testados são preparados por homogeneização em uma mistura de acetona/tween/DMSO e, em seguida
25 diluído em água para obter o material ativo desejado.

As plantas de trigo (variedade Scipion) semeadas em um solo de turfa 50/50 – substrato Pozzolana em recipientes iniciais e cultivadas a 12 °C, são tratadas no estágio de 1 folha (10 cm de altura) por pulverização com a

suspensão aquosa descrita acima.

As plantas, utilizadas como controles, são tratadas com uma solução aquosa não contendo o material ativo.

Após 24 horas, as plantas são contaminadas por pulverização das
5 folhas com uma suspensão aquosa de esporos de *Puccinia recondita* (100.000 esporos por mL). Os esporos são coletados de um trigo contaminado de 10 dias e são suspensos em água contendo 2,5 mL / 1 de tween 80 a 10%. As plantas de trigo contaminadas são incubadas por 24 horas a 20 °C e a 100% de umidade relativa, e em seguida, por 10 dias a 20 °C e 70% de umidade
10 relativa.

A classificação é realizada 10 dias após a contaminação, em comparação com as plantas controle.

Nestas condições, a proteção boa ou total (pelo menos 70%) é observada com uma dose de 500 ppm, com os seguintes compostos: 13, 17 e
15 18.

EXEMPLO B

TESTE IN VIVO DE *MYCOSPHAERELLA GRAMINICOLA* (MANCHA DA FOLHA DE TRIGO)

Os ingredientes ativos testados são preparados por homogeneização em uma mistura de acetona/ tween/ DMSO e, em seguida
20 diluídos em água para obter a concentração desejada do material ativo.

As plantas de trigo (variedade Scipion) semeadas em um solo de turfa 50/50 – substrato Pozzolana em recipientes iniciais e cultivadas a 12 °C, são tratadas no estágio de 1 folha (10 cm de altura) por pulverização com a suspensão aquosa descrita acima. As plantas, utilizadas como controles, são
25 tratadas com uma solução aquosa não contendo o material ativo.

Após 24 horas, as plantas são contaminadas por pulverização com uma suspensão aquosa de esporos de *Mycosphaerella graminicola* (500.000 esporos por mL). Os esporos são coletados de uma cultura de 7 dias .

As plantas de trigo contaminadas são incubadas por 72 horas a 18 °C e a 100% de umidade relativa, e em seguida, por 21 a 28 dias, 90% de umidade relativa.

5 A classificação (% de eficácia) é realizada 21 a 28 dias após a contaminação, em comparação com as plantas controle.

Nestas condições, a proteção boa ou total (pelo menos 70%) é observada em uma dose de 500 ppm, com os seguintes compostos: 13, 15, 17, 18, 21 e 25.

EXEMPLO C

10 TESTE IN VIVO DE *ALTERNARIA BRASSICAE* (MANCHA DA FOLHA DE CRUCÍFERAS)

Os ingredientes ativos testados são preparados por homogeneização em uma mistura de acetona/ tween/ DMSO e, em seguida diluídos em água para obter o material ativo desejado.

15 As plantas de rabanete (variedade Pernot), semeadas em um solo de turfa 50/50 – substrato Pozzolana em recipientes iniciais e cultivadas de 18 a 20 °C, são tratadas na fase de cotilédones por pulverização com o ingrediente ativo preparado como descrito acima.

As plantas, utilizadas como controles, são tratadas com a mistura de acetona / tween / água não contendo o material ativo.

20 Após 24 horas, as plantas são contaminadas por pulverização com uma suspensão aquosa de esporos de *Alternaria brassicae* (40.000 esporos por cm³). Os esporos são coletados de uma cultura de 12 a 13 dias.

As plantas de rabanete contaminadas são incubadas por 6 a 7 dias em cerca de 18 °C, sob uma atmosfera úmida.

25 A classificação é realizada 6 a 7 dias após a contaminação, em comparação com as plantas controle.

Nestas condições, uma boa proteção (pelo menos 70%) é observada em uma dose de 500 ppm, com os seguintes compostos: 12, 13, 15,

17, 21, 23 e 25.

EXEMPLO D

TESTE IN VIVO DE *SPHAEROTHECA FULIGINEA* (OÍDIO DE CUCURBITÁCEAS)

Os ingredientes ativos testados são preparados por
5 homogeneização em uma mistura de acetona/ tween/ DMSO e, em seguida
diluídos em água para obter o material ativo desejado.

As plantas Gherkin (variedade Vert petit de Paris) em recipientes
iniciais copos de início, semeadas em um solo de turfa 50/50 –substrato
Pozzalana e cultivadas de 20 °C a 23 °C, são tratadas no estágio Z10 do
10 cotilédone por pulverização com a suspensão aquosa descrito acima. As
plantas utilizadas como controle são tratadas com uma solução aquosa não
contendo o material ativo.

Após 24 horas, as plantas são contaminadas por pulverização
com uma suspensão aquosa de esporos de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000
15 esporos por mL). Os esporos são coletados a partir de uma planta
contaminada. As plantas de pepino contaminadas são incubadas a cerca de 20
°C/ 25 °C e a 60/70% de umidade relativa.

A classificação (% de eficácia) é realizada 12 dias após a
contaminação, em comparação com as plantas controle.

20 Nestas condições, a proteção boa ou total (pelo menos 70%) é
observada em uma dose de 500 ppm, com os seguintes compostos: 12, 13, 17,
18, 21 e 25.

EXEMPLO E

TESTE IN VIVO DE *PYRENOPHORA TERES* (CEVADA) / PREVENTIVO

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

Emulsificante: 1 parte em peso de alquilarilpoliglicoléter

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 em 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. Um dia após este tratamento, as plantas são inoculadas com uma suspensão aquosa de esporos de *Pyrenophora teres*. As plantas permanecem por 48 horas em uma incubadora a cerca de 22 °C e uma umidade atmosférica relativa de 100%. Posteriormente, as plantas são colocadas em uma estufa em uma temperatura de cerca de 20 °C e uma umidade atmosférica relativa de cerca de 80%.

O teste é avaliado de 7 a 9 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 mostraram uma eficácia de 70% ou ainda maior em uma concentração de 500 ppm de ingrediente ativo: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 14, 16, 20, 27, 28, 32 e 33.

EXEMPLO F

TESTE IN VIVO DE *VENTURIA INAEQUALIS* (SARNA DA MACIEIRA) / PREVENTIVO

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

Emulsificante: 1 parte em peso de éter 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 em 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 a secagem do revestimento de pulverização, as plantas são

inoculadas com uma suspensão aquosa de conídios do agente causal da sarna da macieira (*Venturia inaequalis*) e permanecem por um dia em uma estufa a cerca de 20 °C e umidade atmosférica de 100%.

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

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

10 Neste teste, os seguintes compostos de acordo com a presente invenção mostraram uma eficácia de 70% ou ainda maior em uma concentração de 100 ppm de ingrediente ativo: 14 e 19.

EXEMPLO G

TESTE IN VIVO DE SEPTORIA TRITICI (TRIGO) / PREVENTIVO

15 Solvente: 49 partes em peso de N,N-dimetilformamida
Emulsificante: 1 parte em peso de éter 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 em água à concentração desejada.

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

25 Após a secagem do revestimento de pulverização, as plantas são pulverizadas com uma suspensão de esporos de *Septoria tritici*. As plantas permanecem por 48 horas em uma incubadora a cerca de 20 °C e umidade atmosférica relativa de aproximadamente 100% e após 60 horas em aproximadamente 15 °C em uma incubadora translúcida a umidade atmosférica relativa de aproximadamente 100%.

As plantas são colocadas em uma estufa a uma temperatura de aproximadamente 15 °C e uma umidade atmosférica relativa de aproximadamente 80%.

5 O teste é avaliado 21 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 ainda maior em uma concentração de 500 ppm de ingrediente ativo: 14, 16 e 19.

10

EXEMPLO H

TESTE IN VIVO DE *LEPTOSPHAERIA NODORUM* (TRIGO) / PREVENTIVO

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

Emulsificante: 1 parte em peso de éter poliglicol alquilarila

15 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 em água à concentração desejada.

20 Para o teste da atividade de proteção, as plantas jovens são pulverizadas com uma preparação do composto ativo na taxa determinada de aplicação. Após a secagem do revestimento de pulverização, as plantas são pulverizadas com uma suspensão de esporos de *Leptosphaeria nodorum*. As plantas permanecem por 48 horas em uma incubadora a 20 °C e umidade atmosférica relativa de 100%.

25 As plantas são colocadas em uma estufa a cerca de 15 °C e uma umidade atmosférica relativa de 80%.

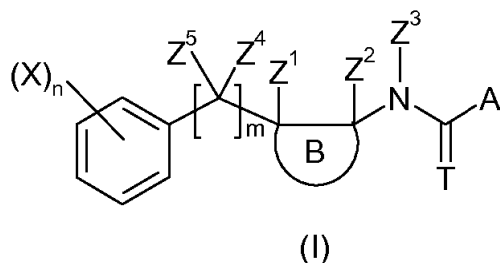
O teste é avaliado 10 dias após a inoculação. 0% significa uma eficácia que corresponde àquela do controle, enquanto que uma eficácia de 100% significa que não foi observada nenhuma doença.

Nestas condições, uma proteção boa (pelo menos 70% ou mais do controle da doença) é observada em uma dose de 500 ppm, com os seguintes compostos: 7 e 32, de acordo com a presente invenção, em que a proteção fraca (menos do que 10% do controle da doença) é observada em
5 uma dose de 500 ppm com os compostos do exemplo 1,001 descritos na patente internacional WO 2007/134799. O Exemplo 1,001 descrito na patente WO 2007/134799 corresponde ao seguinte composto: cis-N-[2-(4-clorofenil)ciclopropil]-3-(metil-difluoro)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estes resultados mostram que os compostos, de acordo com a
10 presente invenção, apresentam uma atividade biológica muito melhor do que os compostos mais próximos estruturalmente descritos na patente WO 2007/134799.

REIVINDICAÇÕES

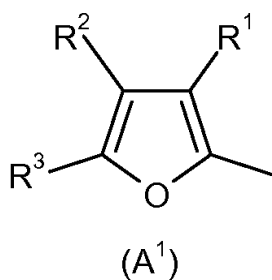
1. COMPOSTO, caracterizado pelo fato de que apresenta a Fórmula (I):



em que

5 - A é selecionado da lista que consiste em:

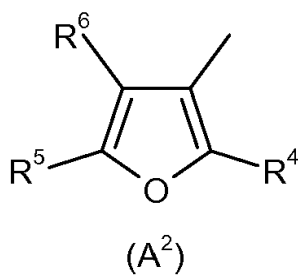
- um heterociclo de Fórmula (A¹)



em que:

R¹ a R³, que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A²)

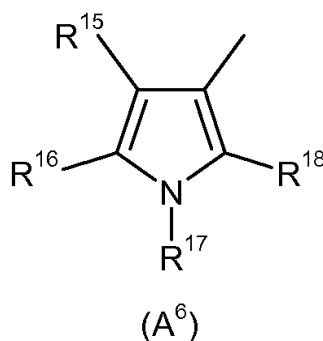


em que:

R⁴ a R⁶, que podem ser iguais ou diferentes representam um

átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

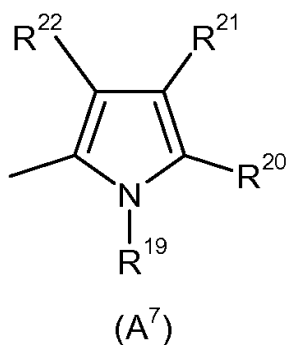
- um heterociclo de Fórmula (A⁶)



5 em que:

R¹⁵, R¹⁶ e R¹⁸, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

10 R¹⁷ representa um átomo de hidrogênio ou C₁-C₅ alquila;
- um heterociclo de Fórmula (A⁷)

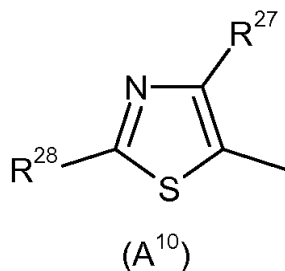


em que:

R¹⁹ representa um átomo de hidrogênio ou uma C₁-C₅ alquila;

15 R²⁰ a R²², que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹⁰)

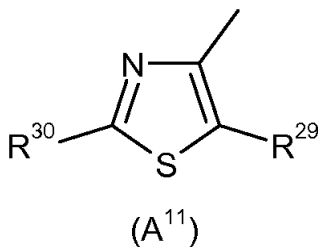


em que:

R²⁷ e R²⁸, que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser

5 iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹¹)

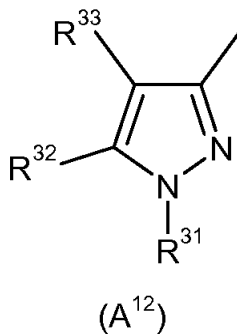


em que:

R²⁹ e R³⁰, que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser

10 iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹²)

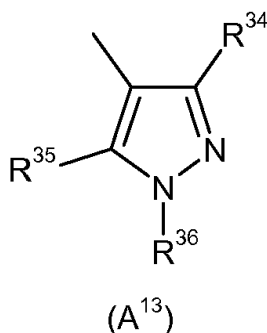


em que:

R^{31} representa um átomo de hidrogênio ou uma C_1 - C_5 alquila;

R^{32} e R^{33} , que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser

- um heterociclo de Fórmula (A^{13})

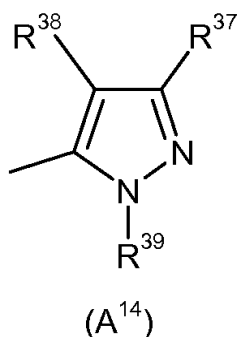


em que:

R^{34} e R^{35} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser

R^{36} representa um átomo de hidrogênio ou C_1 - C_5 alquila;

- um heterociclo de Fórmula (A^{14})



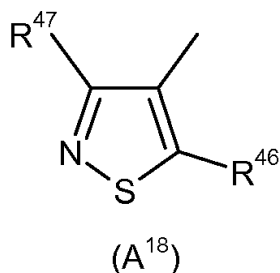
em que:

R^{37} e R^{38} , que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5

halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

R^{39} representa um átomo de hidrogênio ou C_1 - C_5 alquila;

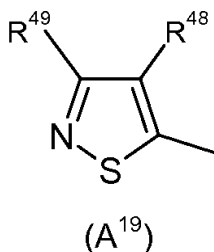
- um heterociclo de Fórmula (A^{18})



5 em que:

R^{46} e R^{47} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

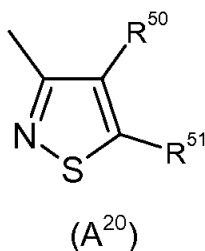
- 10
- um heterociclo de Fórmula (A^{19})



em que:

R^{49} e R^{48} , que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser iguais ou diferentes;

- 15
- um heterociclo de Fórmula (A^{20})



em que:

R⁵⁰ e R⁵¹, que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila; ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio, que podem ser
 5 iguais ou diferentes;

- T representa O ou S;

- B representa um carbociclo não aromático de 5-, ou 6- membros que pode ser substituído por um a quatro grupos C₁-C₈ alquila;

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

10 - m representa 0 ou 1;

- X representa um átomo de halogênio; C₁-C₈ alquila não substituída; ou C₁-C₈ halogenoalquila com 1 a 5 átomos de halogênio;

- Z¹ e Z² representam independentemente um átomo de hidrogênio; ou uma C₁-C₈ alquila não substituída;

15 - Z³ representa uma ciclopropila não substituída ou uma ciclopropila substituída por até 2 átomos ou grupos que podem ser iguais ou diferentes e que são selecionados a partir da lista que consiste em C₁-C₈ alquila;

- Z⁴ e Z⁵ representam independentemente um átomo de hidrogênio;

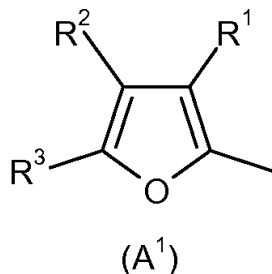
20 uma C₁-C₈ alquila não substituída;

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

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que A é selecionado a partir da lista que consiste

em:

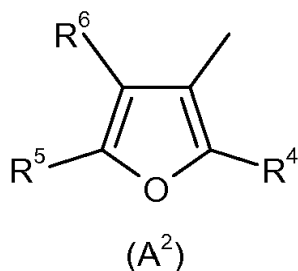
- um heterociclo de Fórmula (A¹)



em que:

R¹ a R³, que podem ser iguais ou diferentes representam um
 5 átomo de hidrogênio; ou C₁-C₅ alquila não substituída;

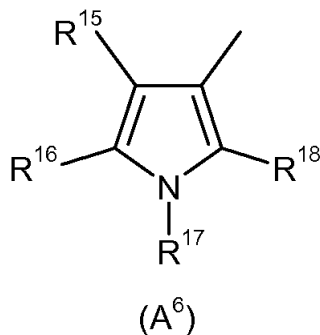
- um heterociclo de Fórmula (A²)



em que:

R⁴ a R⁶, que podem ser iguais ou diferentes representam um
 átomo de hidrogênio; ou C₁-C₅ alquila não substituída;

10 - um heterociclo de Fórmula (A⁶)



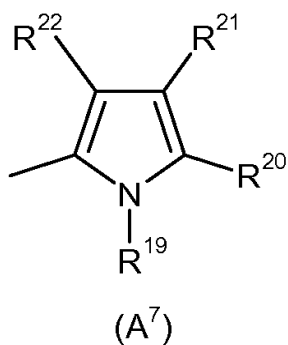
em que:

R¹⁵ representa uma C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9
 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

R^{16} e R^{18} , que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio;

R^{17} representa uma C_1 - C_5 alquila não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A^7)

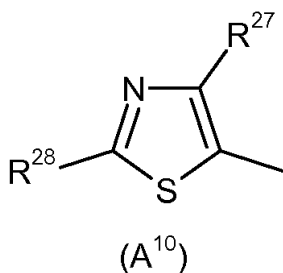


5 em que:

R^{19} representa uma alquila C_1 - C_5 ;

R^{20} a R^{22} , que podem ser iguais ou diferentes, representam um átomo de hidrogênio ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

10 - um heterociclo de Fórmula (A^{10})

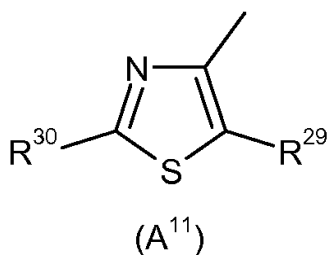


em que:

R^{27} representa uma C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

R^{28} representa uma C_1 - C_5 alquila não substituída;

15 - um heterociclo de Fórmula (A^{11})



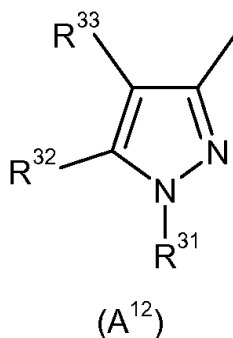
em que:

R²⁹ representa uma C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

R³⁰ representa uma C₁-C₅ alquila não substituída;

5

- um heterociclo de Fórmula (A¹²)

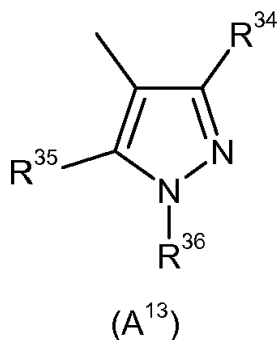


em que:

R³¹ representa uma C₁-C₅ alquila não substituída;

R³² e R³³ que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C₁-C₅ alquila não substituída ou
 10 C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹³)

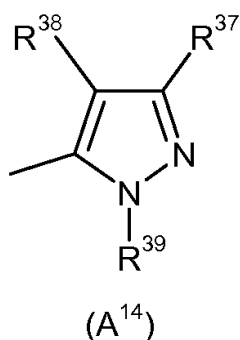


em que:

R^{34} e R^{35} que podem ser iguais ou diferentes representam um átomo de hidrogênio; um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser
5 iguais ou diferentes;

R^{36} representa uma alquila C_1 - C_5 não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A^{14})

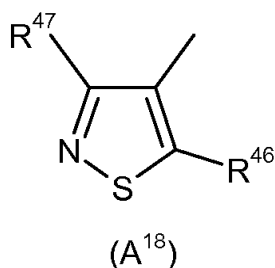


em que:

R^{37} e R^{38} , que podem ser iguais ou diferentes representam um
10 átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio; C_1 - C_5 alquila; C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

R^{39} representa uma C_1 - C_5 alquila não substituída;

- um heterociclo de Fórmula (A^{18})

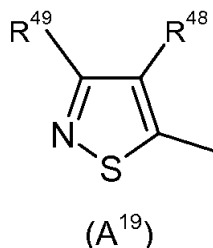


15 em que:

R^{46} e R^{47} , que podem ser iguais ou diferentes representam uma C_1 - C_5 alquila; ou C_1 - C_5 halogenoalquila que compreende até 9 átomos de

halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A¹⁹)

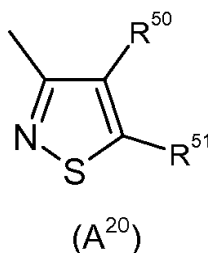


em que:

R⁴⁸ e R⁴⁹, que podem ser iguais ou diferentes representam C₁-C₅

5 alquila ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes;

- um heterociclo de Fórmula (A²⁰)



em que:

R⁵⁰ e R⁵¹, que podem ser iguais ou diferentes representam uma

10 C₁-C₅ alquila ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes.

3. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1 ou 2, caracterizado pelo fato de que A é selecionado a partir da lista que consiste em A²; A⁶; A¹⁰ e A¹³.

15 4. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 3, caracterizado pelo fato de que A representa A¹³, em que R³⁴ representa uma C₁-C₅ alquila ou C₁-C₅ halogenoalquila que compreende até 9 átomos de halogênio que podem ser iguais ou diferentes; R³⁵ representa um átomo de hidrogênio ou um átomo de halogênio e R³⁶ representa C₁-C₅ alquila.

5. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 4, caracterizado pelo fato de que T representa O.

6. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 5, caracterizado pelo fato de que n representa 0, 1 ou 2.

5 7. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 6, caracterizado pelo fato de que B representa carbociclo ciclopentila ou ciclohexila que pode ser substituído por um a quatro grupos metila.

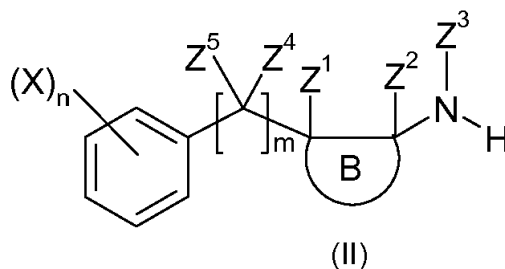
8. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 7, caracterizado pelo fato de que X representa independentemente um átomo de halogênio.

9. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 8, caracterizado pelo fato de que Z^1 e Z^2 representam independentemente um átomo de hidrogênio.

15 10. COMPOSTO, de acordo com qualquer uma das reivindicações 1 a 9, caracterizado pelo fato de que Z^3 representa uma ciclopropila não substituída.

11. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, caracterizada pelo fato de que compreende, como um ingrediente ativo, uma quantidade eficaz de um composto de Fórmula (I), conforme definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 10, e um suporte, veículo ou carga agricolamente aceitável.

12. COMPOSTO, caracterizado pelo fato de apresenta a Fórmula (II)



em que X, n, m, Z¹, Z², Z³, Z⁴ e Z⁵ são conforme definidos em qualquer uma das reivindicações 1 a 10, e B representa um grupo ciclopentila ou ciclohexila.

13. MÉTODO PARA O CONTROLE DE FUNGOS
5 FITOPATOGÊNICOS DE CULTURAS, caracterizado pelo fato de que uma quantidade agricolamente eficaz e substancialmente não fitotóxica de um composto, conforme definido em qualquer uma das reivindicações 1 a 10, ou uma composição, conforme definida na reivindicação 11, é aplicado ao solo em
10 que as plantas crescem ou são capazes de crescer, às folhas e/ou aos frutos das plantas ou às sementes das plantas.