



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

(21) **PI0613229-4 A2**



* B R P I 0 6 1 3 2 9 A 2 *

(22) Data de Depósito: 06/07/2006
(43) Data da Publicação: 04/01/2011
(RPI 2087)

(51) *Int.Cl.:*
C07D 209/16
C07D 333/62
C07D 333/58
C07D 307/81
C07D 235/14
C07D 215/12
A01N 43/12
A01N 43/38
A01N 43/52
A01N 43/42

(54) Título: **COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTO, COMPOSIÇÃO FUNGICIDA E MÉTODO PARA O COMBATE CURATIVO OU PREVENTIVO DE FUNGO FITOPATOGÊNICO**

(30) Prioridade Unionista: 12/07/2005 EP 05356116.3

(73) Titular(es): BAYER CROPSCIENCE SA

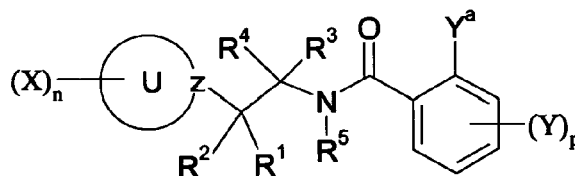
(72) Inventor(es): Alain Villier, Darren Mansfield, Heiko Rieck, Marie-Claire Grosjean-Cournoyer, Philippe Desbordes, Pierre Genix, Pierre-Yves Coqueron

(74) Procurador(es): PAOLA CALABRIA MATTIOLI

(86) Pedido Internacional: PCT EP2006063987 de 06/07/2006

(87) Publicação Internacional: WO 2007/006734 de 18/01/2007

(57) Resumo: COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTO, COMPOSIÇÃO FUNGICIDA E MÉTODO PARA O COMBATE CURATIVO OU PREVENTIVO DE FUNGO FITOPATOGÊNICO A presente invenção refere-se a novos derivados de benzoheterociclietilbenzamida de Fórmula (1) em que os substituintes estão no relatório descritivo, ao seu processo de preparação, ao seu uso como fungicidas, em particular, na forma de composições fungicidas e aos seus métodos para o controle de fungos de plantas.



PT 0613229-4

**“COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTO,
COMPOSIÇÃO FUNGICIDA E MÉTODO PARA O COMBATE CURATIVO OU
PREVENTIVO DE FUNGO FITOPATOGÊNICO”**

CAMPO DA INVENÇÃO

5 A presente invenção refere-se a novos derivados de benzoheterocicliletilbenzamida, ao seu processo de preparação, ao seu uso como fungicidas, em particular, na forma de composições fungicidas, e aos seus métodos para o controle de fungos fitopatogênicos de plantas utilizando estes compostos ou suas composições.

ANTECEDENTES DA INVENÇÃO

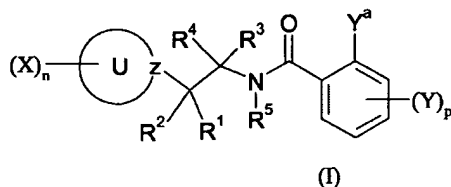
10 No pedido de patente chinês CN 1365971, certos derivados de benzoheterocicliletilbenzamida em que o benzoheterociclo é o 3-1H-2H-indolil são genericamente incluídos em uma descoberta ampla de numerosos compostos de N-acilriptamina. Entretanto, os ditos compostos não são
15 incluídos nos derivados de benzoheterocicliletilbenzamida relacionado pela presente invenção, e em adição, este documento não descreve especificamente nem sugere selecionar tais compostos.

 É sempre de grande interesse no campo dos agroquímicos utilizar novos compostos pesticidas a fim de evitar ou combater o desenvolvimento de
20 cepas resistentes aos ingredientes ativos utilizados pelo agricultor.

 A presente invenção revela uma nova família de compostos que possuem as características mencionadas acima.

DESCRIÇÃO DA INVENÇÃO

25 Conseqüentemente, a presente invenção refere-se a um derivado de benzoheterocicliletilbenzamida de Fórmula geral (I):

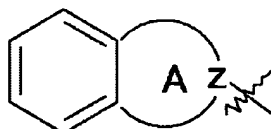


em que:

- n é 0, 1, 2, 3, 4, 5 ou 6;

- p é 1, 2, 3 ou 4;

- U é:



5

em que A representa um heterociclo de 5 ou 6 membros com um, dois ou três heteroátomos que podem ser o mesmo ou diferente; fundido com um anel fenila para formar um benzoheterociclo contanto que este benzoheterociclo seja diferente de 3-1*H*-2*H*-indolil;

10

- Z é um átomo de carbono ou um heteroátomo que não pode ser substituído por X;

15

- X é o mesmo ou diferente e é um átomo de halogênio, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo sulfanila, um grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanila, um grupo formila, um grupo formilóxi, um grupo formilamino, um grupo carbóxi, um grupo carbamoíla, um grupo N-hidroxicarbamoíla, um grupo carbamato, um grupo (hidroxiimino)alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, alquilamino C₁-C₈, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, dialquilamino C₁-C₈, alcóxi C₁-C₈, halogenoalcóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfanila C₁-C₈, halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquenilóxi C₂-C₈, halogenoalquenilóxi C₂-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquinilóxi C₃-C₈, halogenoalquinilóxi C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈, N-alquiloxicarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbamoíla C₁-C₈, N-alquil-C₁-C₈-alcoxycarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbonila C₁-C₈, halogenoalcoxycarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio,

25

alquilcarbonilóxi C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilamino C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, dialquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, alquioxycarbonilóxi C₁-C₈, alquilsulfenila C₁-C₈, halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfínila C₁-C₈, halogenoalquilsulfínila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfonila C₁-C₈, halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alcoxiimino C₁-C₆, (alcoxiimino-C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alqueniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alquiniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (benziloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, benzilóxi, benzilsulfanil, benziamino, fenóxi, fenilsulfanil, fenil ou fenilamino;

- R¹ e R² são os mesmos ou diferentes e são um átomo de hidrogênio, um grupo ciano, um grupo formila, um grupo carbóxi, um grupo carbamoíla, um grupo (hidroxiimino)-alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbonila C₁-C₈ ou halogenoalcoxycarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio;

- R³ e R⁴ são os mesmos ou diferentes e são um átomo de hidrogênio, um grupo formila, um grupo carbamoíla, um grupo (hidroxiimino)-alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈ ou alcoxycarbamoíla C₁-C₈;

- R⁵ é um átomo de hidrogênio, alquila C₁-C₆ ou cicloalquila C₃-C₇;

- Y é o mesmo ou diferente e é um átomo de hidrogênio, um átomo de

halogênio, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo sulfanila, um grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanila, um grupo formila, um grupo formilóxi, um grupo formilamino, um grupo carbóxi, um grupo carbamoila, um grupo N-hidroxycarbamoila, um grupo carbamato, um grupo (hidroxiimino)alquila C₁-C₆,
 5 alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, alquilamino C₁-C₈, dialquilamino C₁-C₈, alcóxi C₁-C₈, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalcóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfanila C₁-C₈, halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquenilóxi C₂-C₈, halogenoalquenilóxi C₂-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquinilóxi C₃-C₈, halogenoalquinilóxi C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoila C₁-C₈, dialquilcarbamoila C₁-C₈, N-alquiloxicarbamoila C₁-C₈, alcoxicarbamoila C₁-C₈, N-alquil-C₁-C₈-alcoxicarbamoila C₁-C₈, alcoxicarbonila C₁-C₈, halogenoalcoxicarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilóxi C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilamino C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, dialquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, alquiloxicarbonilóxi C₁-C₈, alquilsulfenila C₁-C₈, halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfonila C₁-C₈, halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfonila C₁-C₈, halogenoalquilsulfonila-C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alcoxiimino C₁-C₆, (alcoxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alqueniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alquiniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆ ou (benziloxiimino)-alquila C₁-C₆, e

25 - Y^a é um átomo de halogênio, um grupo ciano, 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 (hidroxiimino)alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈,

alquinila C₂-C₈, alcóxi C₁-C₈, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalcóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfanila C₁-C₈, halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquenilóxi C₂-C₈, halogenoalquenilóxi C₂-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquinilóxi C₃-C₈, halogenoalquinilóxi C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈, N-alquiloxycarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbamoíla C₁-C₈, N-alquil C₁-C₈-alcoxycarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbonila C₁-C₈, halogenoalcoxycarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilóxi C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilamino C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, dialquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, alquiloxycarbonilóxi C₁-C₈, alquilsulfenila C₁-C₈, halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfinila C₁-C₈, halogenoalquilsulfinila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfonila C₁-C₈, halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alcoxiiimino C₁-C₆, (alcoxiiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alqueniloxiiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆ ou (alquiniloxiiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (benziloxiiimino)-alquila C₁-C₆;

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

Em uma realização da presente invenção, A representa um heterociclo de 5 ou 6 membros com um, dois ou três heteroátomos que podem ser os mesmos ou diferentes; fundidos com um anel fenila para formar um benzoheterociclo desde que este benzoheterociclo seja diferente de 3-2H-indolil, então z, X, R¹, R², R³, R⁴, Y, Y^a são definidos conforme acima.

No contexto da presente invenção:

- halogênio significa flúor, bromo, cloro ou iodo;

- carbóxi significa $-C(=O)OH$; carbonila significa $-C(=O)-$; I
significa $C(=O)NH_2$; N-hidroxicarbamóil significa $-C(=O)NHOH$;

- um grupo alquila, um grupo alquenila, um grupo alquinila, bem
5 como porções contendo estes termos, pode ser linear ou ramificado; e

- heteroátomo significa enxofre, nitrogênio ou oxigênio.

No contexto da presente invenção, também pode ser entendido
que no caso de radicais amino di-substituído e de carbamoíla di-substituída, os
dois substituintes podem formar junto com o átomo de nitrogênio que os
10 carrega, um anel heterocíclico saturado contendo de 3 a 7 átomos.

Quaisquer dos compostos da presente invenção podem existir em
uma ou mais formas isômeras ópticas ou quirais dependendo do número de
centros assimétricos no composto. Assim, a presente invenção refere-se
igualmente a isômeros ópticos e a suas misturas racêmicas ou escalêmicas (o
15 termo "escalêmico" denota uma mistura de enantiômeros em diferentes
proporções), e à misturas de todos os estereoisômeros possíveis, em todas as
proporções. Os diastereoisômeros e/ou os isômeros ópticos podem ser
separados de acordo com os métodos que são conhecidos *per se* pelo técnico
no assunto regular.

20 Quaisquer dos compostos da presente invenção podem existir em
uma ou mais formas de isômeros geométricos dependendo do número de
ligações duplas no composto. Assim, a presente invenção refere-se igualmente
a todos os isômeros geométricos e a todas as misturas possíveis, em todas as
proporções. Os isômeros geométricos podem ser separados de acordo com os
25 métodos gerais, que são conhecidos *per se* pelo técnico no assunto regular.

Quaisquer dos compostos de Fórmula geral (I) em que X
representa um hidróxi, um grupo sulfanil ou um grupo amino pode ser
encontrado em sua forma tautomérica resultando da troca do próton de dito

grupo hidróxi, sulfanil ou amino. Tais formas tautoméricas de tais compostos também são parte da presente invenção. De modo mais geral, todas as formas tautoméricas dos compostos de Fórmula geral (I), em que X representa um hidróxi, 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 destes processos, também são parte da presente invenção.

De acordo com a presente invenção, o grupo "U" pode ser substituído em qualquer posição por $(X)_n$, em que X e n são conforme definidos acima. De preferência, a presente invenção refere-se a um derivado de heterocicliletilbenzamida de Fórmula geral (I) em que as diferentes características podem ser selecionadas sozinhas ou em combinação como sendo:

- com relação a n, n é 0, 1 ou 2; e
- com relação a X, X é selecionado como sendo um grupo alquila C₁-C₄, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, um grupo alcóxi C₁-C₄, um alquiltio C₁-C₄, um alquilsulfonil C₁-C₄, um halogenoalquila C₁-C₄ que possui de 1 a 5 átomos de halogênio.

De acordo com a presente invenção, os átomos de carbono da porção carboxamida do composto de Fórmula (I) são substituídos por R¹, R², R³ e R⁴; R¹, R², R³ e R⁴ sendo conforme definido acima. De preferência, a presente invenção também se refere a um derivado de benzoheterocicliletilbenzamida de Fórmula geral (I) em que as diferentes características podem ser selecionadas sozinhas ou em combinação como sendo:

- com relação a R¹ e R², R¹ e R² são selecionados, independentemente de cada um, como sendo um átomo de hidrogênio, uma alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio; e

- com relação a R^3 e R^4 , R^3 e R^4 são selecionados, independentemente de cada um, como sendo um átomo de hidrogênio, uma alquila C_1-C_8 , alquenila C_2-C_8 , alquinila C_2-C_8 , cicloalquila C_3-C_8 , halogenocicloalquila C_3-C_8 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalquila C_1-C_8 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

De acordo com a presente invenção, o átomo de nitrogênio da porção carboxamida do composto de Fórmula (I) é substituído por R^5 , R^5 sendo um átomo de hidrogênio, uma alquila C_1-C_6 ou uma cicloalquila C_3-C_7 . De preferência, a cicloalquila C_3-C_7 é a ciclopropila.

De acordo com a presente invenção, a porção fenila é substituída na posição orto por Y^a e pode ser substituída em qualquer outra posição por $(Y)_p$, em que Y^a , Y e p são definidos conforme acima. De preferência, a presente invenção refere-se a um derivado de benzoheterocicliletilbenzamida de Fórmula geral (I) em que as diferentes características podem ser selecionadas sozinhas ou em combinação como sendo:

- Y^a , Y^a é selecionado como sendo um átomo de halogênio, um grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanil, alquila C_1-C_8 , halogenoalquila C_1-C_8 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio ou halogenoalcóxi C_1-C_8 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio;

- com relação a p , p é 1;

- com relação a Y , Y é selecionado como sendo um átomo de hidrogênio ou um átomo de halogênio, de maior preferência Y é um átomo de hidrogênio.

De acordo com a presente invenção, o grupo "U" do composto de Fórmula geral (I) é um benzoheterociclo onde o heterociclo fundido do anel fenila é um anel de 5 ou 6 membros com um, dois ou três heteroátomos que podem ser os mesmos ou diferentes. De preferência, a presente invenção também se refere a um derivado de benzoheterocicliletilbenzamida de Fórmula

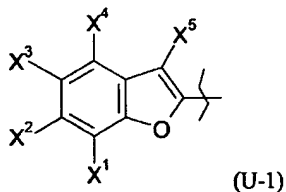
geral (I) em que as diferentes características podem ser selecionadas sozinhas ou em combinação como sendo:

- U é selecionado como sendo um 2-benzotiofeno, 3-benzotiofeno, 1-indol, 2-indol, 3-indol, desde que seja substituído na posição 1 ou 2, um 2-benzofurano, 3-benzofurano, 2-benzoxazol, 2-benzotiazol, 1-benzimidazol, 2-benzimidazol, 3-benz-1,2-isoxazol, 3-benz-2,1-isoxazol, 3-benz-1,2-isotiazol, 3-benz-2,1-isotiazol, 1-benzopirazol, 2-benzopirazol, 3-benzopirazol, 2-quinolina, 3-quinolina, 4-quinolina, 1-isoquinolina, 3-isoquinolina, 4-isoquinolina.

- U não é substituído ou substituído por 1, 2, 3, 4, 5 ou 6 grupos que são selecionados, independentemente de cada um, como sendo um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, um alquiltio C₁-C₄, uma alquilsulfonila C₁-C₄, uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

Os exemplos específicos do grupo "U" incluem:

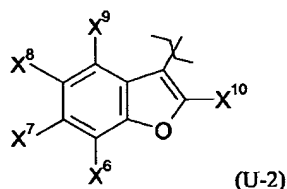
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-1)



em que:

- X¹, X², X³, X⁴ e X⁵ podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

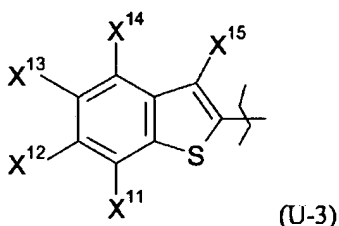
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-2)



em que:

- X^6 , X^7 , X^8 , X^9 e X^{10} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1 - C_4 , um grupo alcóxi C_1 - C_4 , alquiltio C_1 - C_4 , alquilsulfonila C_1 - C_4 ou uma halogenoalquila C_1 - C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

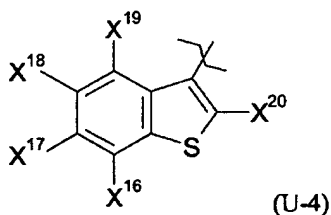
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-3)



em que:

- X^{11} , X^{12} , X^{13} , X^{14} e X^{15} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1 - C_4 , um grupo alcóxi C_1 - C_4 , alquiltio C_1 - C_4 , alquilsulfonila C_1 - C_4 ou uma halogenoalquila C_1 - C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

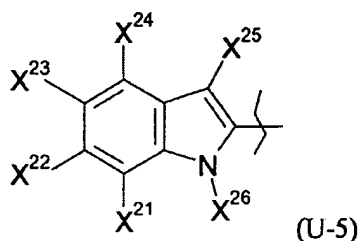
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-4)



em que:

- X^{16} , X^{17} , X^{18} , X^{19} e X^{20} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1 - C_4 , um grupo alcóxi C_1 - C_4 , alquiltio C_1 - C_4 , alquilsulfonila C_1 - C_4 ou uma halogenoalquila C_1 - C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

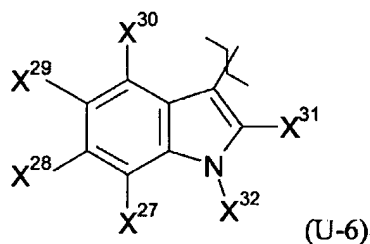
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-5)



em que:

- X²¹, X²², X²³, X²⁴ e X²⁵ podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-6)

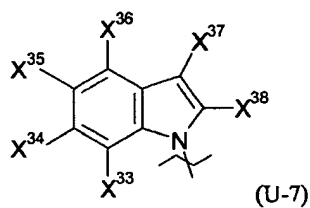


10

em que:

- X²⁷, X²⁸, X²⁹, X³⁰, X³¹ e X³² podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-7)



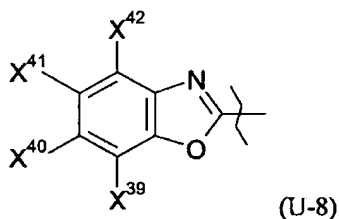
em que:

- X³³, X³⁴, X³⁵, X³⁶, X³⁷ e X³⁸ podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo

20

hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-8)



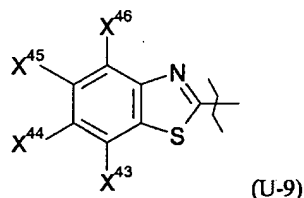
5

em que:

- X³⁹, X⁴⁰, X⁴¹, e X⁴² podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

10

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-9)

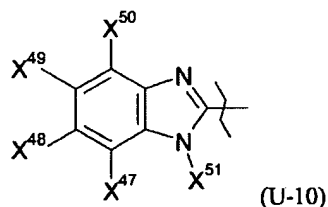


em que:

- X⁴³, X⁴⁴, X⁴⁵ e X⁴⁶ podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

15

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-10)

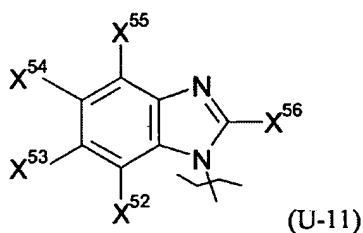


20

em que:

- X^{47} , X^{48} , X^{49} , X^{50} e X^{51} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

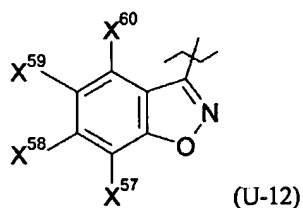
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-11)



em que:

- X^{52} , X^{53} , X^{54} , X^{55} e X^{56} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

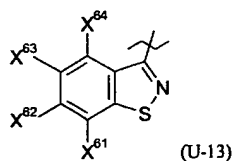
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-12)



em que:

- X^{57} , X^{58} , X^{59} e X^{60} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

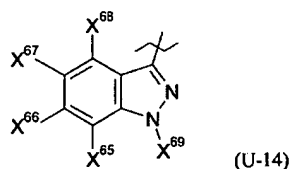
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-13)



em que:

- X^{61} , X^{62} , X^{63} e X^{64} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

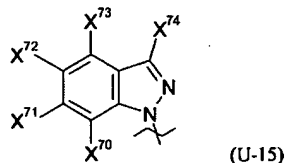
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-14)



em que:

- X^{65} , X^{66} , X^{67} , X^{68} e X^{69} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

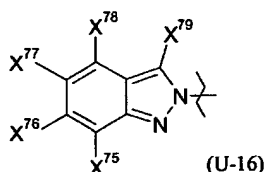
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-15)



em que:

- X^{70} , X^{71} , X^{72} , X^{73} e X^{74} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

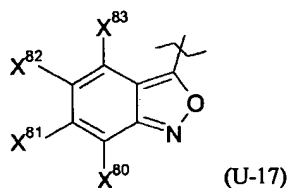
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-16)



em que:

- X^{75} , X^{76} , X^{77} , X^{78} e X^{79} podem ser os mesmos ou diferentes e
 5 podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-17)

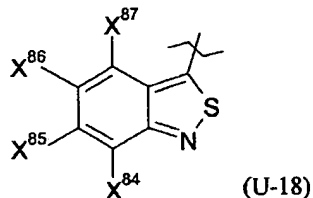


10

em que:

- X^{80} , X^{81} , X^{82} e X^{83} podem ser os mesmos ou diferentes e podem
 ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um
 grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio
 15 C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5
 átomos de halogênio.

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-18)

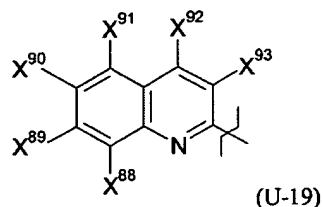


em que:

- X^{84} , X^{85} , X^{86} e X^{87} podem ser os mesmos ou diferentes e podem
 20 ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um
 grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio

C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-19)



5

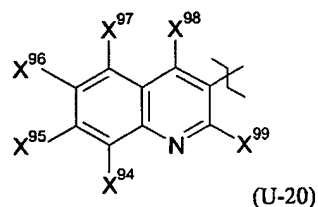
em que:

- X⁸⁸, X⁸⁹, X⁹⁰, X⁹¹, X⁹² e X⁹³ podem ser os mesmos ou diferentes

e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

10

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-20)



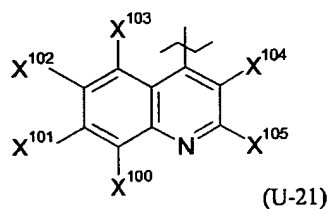
em que:

- X⁹⁴, X⁹⁵, X⁹⁶, X⁹⁷, X⁹⁸ e X⁹⁹ podem ser os mesmos ou diferentes

e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C₁-C₄, um grupo alcóxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonila C₁-C₄ ou uma halogenoalquila C₁-C₄ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

15

*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-21)

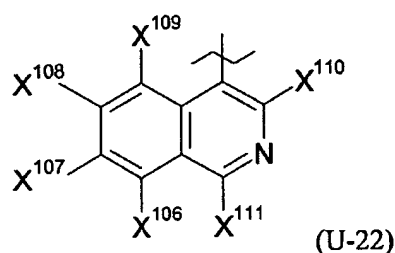


20

em que:

- X^{100} , X^{101} , X^{102} , X^{103} , X^{104} e X^{105} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

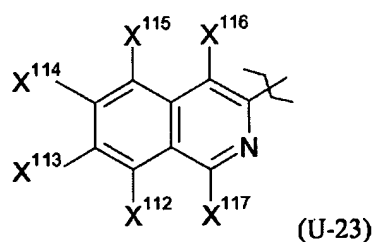
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-22)



em que:

- X^{106} , X^{107} , X^{108} , X^{109} , X^{110} e X^{111} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

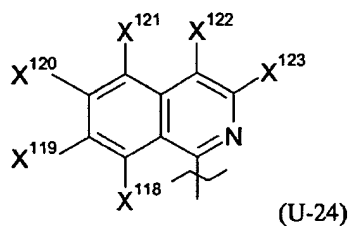
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-23)



em que:

- X^{112} , X^{113} , X^{114} , X^{115} , X^{116} e X^{117} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

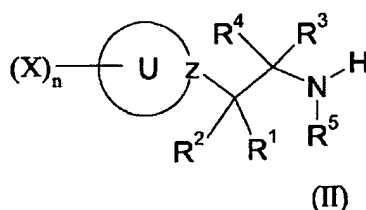
*U representa um benzoheterociclo de Fórmula geral (U-24)



em que:

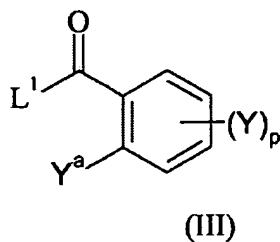
- X^{118} , X^{119} , X^{120} , X^{121} , X^{122} e X^{123} podem ser os mesmos ou diferentes e podem ser um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo nitro, uma alquila C_1-C_4 , um grupo alcóxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonila C_1-C_4 ou uma halogenoalquila C_1-C_4 possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

A presente invenção também se refere a um processo para a preparação do composto de Fórmula geral (I). Assim, de acordo com um aspecto adicional da presente invenção, é fornecido um processo para a preparação de um composto de Fórmula geral (I) conforme definido acima, que compreende a reação de um derivado de benzoheterociclietilamina de Fórmula geral (II) ou um de seus sais:



em que U, X, n, z, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 e R^5 são conforme definido acima;

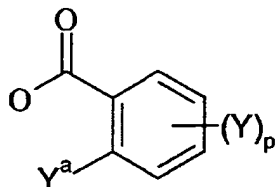
com um derivado de ácido carboxílico de Fórmula geral (III)



em que:

- Y^a , Y e p são conforme definidos acima; e

- L^1 é um grupo de partida selecionado como sendo um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, $-OR^6$, $-OCOR^6$, R^6 sendo uma alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , benzila, 4-metoxibenzila, pentafluorofenila ou um grupo de Fórmula



na presença de um catalisador e, se L^1 for um grupo hidroxila, na presença de um agente de condensação.

O processo de acordo com a presente invenção é realizado na presença de um catalisador. O catalisador apropriado pode ser selecionado como sendo o 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidróxi-benzotriazol ou dimetilformamida.

No caso de L^1 ser um grupo hidróxi, o processo de acordo com a presente invenção é realizado na presença de um agente de condensação. O agente de condensação apropriado pode ser selecionado como sendo formador de haleto ácido, tal como o fosgeno, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, óxido tricloreto de fósforo ou cloreto de tionila; formador de anidrido, tal como cloroformato de etila, cloroformato de metila, cloroformato de isopropila, cloroformato de isobutila ou cloreto de metanossulfonila; carbodiimidias, tais como N,N' -díciclohexilcarbodiimida (DCC), PS-DCC ou outros agentes de condensação costumeiros, tais como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N' -carbonil-diimidazol, 2-etóxi-N-etoxicarbonila-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/ tetraclorometano, hidreto de cloreto de 4-(4,6-dimetóxi-[1,3,5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinium ou bromo-tripirrolidino-fosfônio-hexafluorofosfato, 1-hidroxibenzotriazol (HOBT).

Quando R^5 é um átomo de hidrogênio, o processo mencionado acima para a preparação do composto de Fórmula geral (I) pode ser opcionalmente completado por uma etapa adicional de acordo com o seguinte esquema de reação:

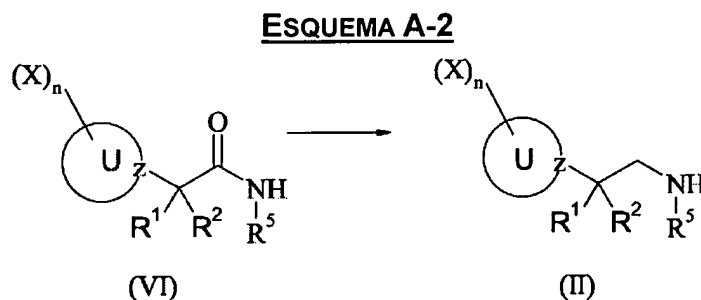
em que:

- U, X, n, Z e R⁵ são conforme definidos acima;
- R¹ é um átomo de hidrogênio ou uma alquila C₁-C₆; e
- R² é um átomo de hidrogênio ou uma alquila C₁-C₆;

5 que compreende a transformação de um ácido carboxílico benzoheterocíclico de Fórmula geral (V) para fornecer um derivado de benzoheterociclil-amida de Fórmula geral (VI), na presença de um derivado amina e um agente de condensação, em uma temperatura de 0° C a 200° C;

- uma segunda etapa de acordo com o esquema de reação A-2:

10



em que:

- U, X, n, z e R⁵ são conforme definidos acima;
- R¹ é um átomo de hidrogênio ou uma alquila C₁-C₆; e
- R² é um átomo de hidrogênio ou uma alquila C₁-C₆;

15

que compreende a redução de um composto de Fórmula geral (VI) para fornecer um derivado de benzoheterocicliletilamina de Fórmula geral (II), na presença de um doador de hidreto, em uma temperatura de 0° C a 200° C.

20 A primeira etapa (etapa A-1) é realizada na presença de um agente de condensação. O agente de condensação apropriado pode ser selecionado como sendo um formador de haleto ácido, tal como o fosgeno, tribrometo de fósforo, tricloreto de fósforo, pentacloreto de fósforo, óxido tricloreto de fósforo ou cloreto de tionila; cloreto de sulfurila; formador de anidrido, tal como o cloroformato de etila, cloroformato de metila, cloroformato de isopropila, cloroformato de isobutila ou cloreto de metanossulfonila.

25

A primeira etapa (etapa A-1) de acordo com a presente invenção é realizada em uma temperatura de 0° C a 200° C. De preferência, a primeira etapa (etapa A-1) é realizada em uma temperatura de 0° C a 120° C.

5 A primeira etapa (etapa A-1) de acordo com a presente invenção pode ser realizada na presença de um solvente ou não. Quando o solvente é utilizado, o solvente é selecionado, de preferência, como sendo a água, um solvente orgânico ou uma mistura de ambos. Os solventes orgânicos apropriados podem, por exemplo, ser o solvente alifático, alicíclico ou aromático.

10 A segunda etapa (etapa A-2) de acordo com a presente invenção é realizada na presença de um doador de hidreto. De preferência, o doador de hidreto é selecionado como sendo hidretos metálicos ou metalóides, tais como LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

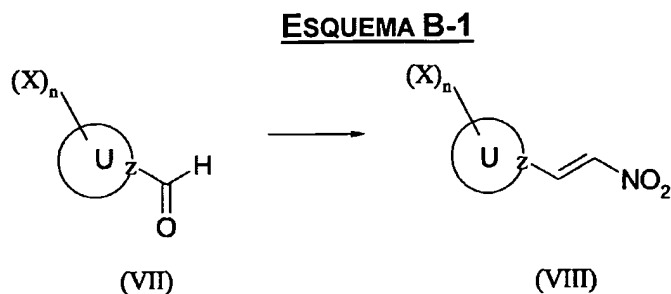
15 A segunda etapa (etapa A-2) de acordo com a presente invenção pode ser realizada na presença de um catalisador. De preferência, o catalisador é selecionado como sendo um ácido de Lewis, tal como o TiCl_4 , AlCl_3 , $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$, CeCl_3 .

20 A segunda etapa (etapa A-2) de acordo com a presente invenção é realizada em uma temperatura de 0° C a 200° C. De preferência, a temperatura é de 10° C a 120° C. De maior preferência, a temperatura é de 10° C a 80° C.

A segunda etapa (etapa A-2) de acordo com a presente invenção pode ser realizada na presença de um solvente orgânico, de água ou de uma de suas misturas. De preferência, o solvente é selecionado como sendo o éter, álcool, ácido carboxílico, ou uma mistura dos mesmos com água ou água pura.

25 Quando R^5 é um átomo de hidrogênio, o derivado de amina de Fórmula geral (II) também pode ser preparado de acordo com o processo que compreende:

- uma primeira etapa de acordo com o esquema de reação B-1:

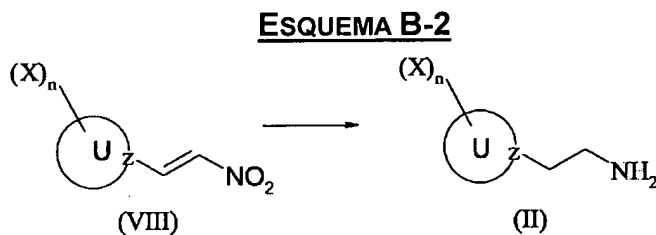


em que:

- X, U, z e n são conforme definidos acima;

5 que compreende a transformação de um aldeído benzoheterocíclico de Fórmula geral (VII) para fornecer um derivado de benzoheterociclil-nitroalqueno de Fórmula geral (VIII), em uma temperatura de 0° C a 200° C;

- uma segunda etapa de acordo com o esquema de reação B-2:



em que:

- X, U, z e n são conforme definidos acima;

15 que compreende a redução de um composto de Fórmula geral (VIII) para fornecer um derivado de benzoheterociclil-etilamina de Fórmula geral (II), na presença de um doador de hidreto, em uma temperatura de 0° C a 200° C.

A primeira etapa (etapa B-1) de acordo com a presente invenção é realizada em uma temperatura de 0° C a 200° C. De preferência, a primeira etapa (etapa A-1) é realizada em uma temperatura de 10° C a 150° C, de maior preferência, em uma temperatura de 50° C a 150° C.

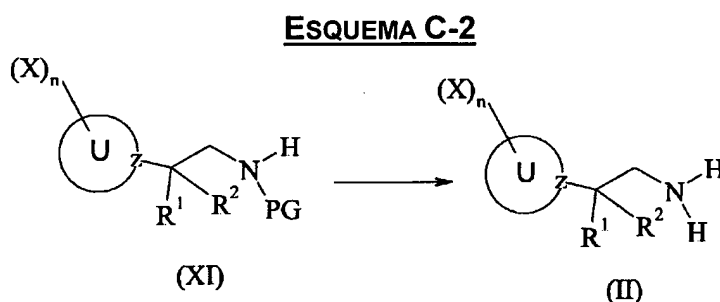
20 A primeira etapa (etapa B-1) de acordo com a presente invenção pode ser realizada na presença de um solvente orgânico, de água ou de uma de suas misturas. De preferência, o solvente é selecionado como sendo o éter,

- L^3 é um grupo de partida selecionado como sendo um grupo $-OR^7$ ou um grupo $-OCOR^7$, R^7 sendo uma alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , benzila, 4-metoxibenzila ou pentafluorofenila;

- PG representa um grupo protetor que pode ser um grupo $-COOR^7$ ou um grupo $-COR^7$, R^7 sendo uma alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , benzila, 4-metoxibenzila ou pentafluorofenila;

que compreende a redução, por hidrogenação ou por um doador hidreto, de um composto de Fórmula geral (IX), na presença de um catalisador e na presença de um composto de Fórmula geral (X) para produzir um composto de Fórmula geral (XI), em uma temperatura de $0^\circ C$ a $150^\circ C$ e sob uma pressão de 1 bar e 100 bar;

- uma segunda etapa de acordo com o esquema de reação C-2:



em que:

- X, U, z e n são conforme definidos acima;

- R^1 é um átomo de hidrogênio ou uma alquila C_1-C_6 ;

- R^2 é um átomo de hidrogênio ou uma alquila C_1-C_6 ;

- PG representa um grupo protetor que pode ser um grupo $-COOR^7$ ou um grupo $-COR^7$, R^7 sendo uma alquila C_1-C_6 , haloalquila C_1-C_6 , benzila, 4-metoxibenzila ou pentafluorofenila;

que compreende a reação de desproteção, em um meio ácido ou em um meio básico, de um composto de Fórmula geral (XI) para fornecer um derivado amina de Fórmula geral (II) ou um de seus sais.

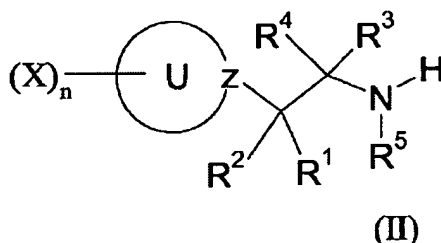
O composto de acordo com a presente invenção pode ser

preparado de acordo com os processos gerais de preparação descritos acima. No entanto, será entendido que, na base de seu conhecimento geral e das publicações disponíveis, o técnico no assunto será capaz de adaptar este método de acordo com as especificações de cada um dos compostos, que é

5 desejado sintetizar.

Na base de seu conhecimento geral e das publicações disponíveis, o técnico no assunto também será capaz de preparar os compostos intermediários de Fórmula (V), (VII) e (IX) de acordo com a presente invenção.

10 A presente invenção também se refere a um derivado de benzoheterocicliletilamina de Fórmula geral (II) ou um de seus sais, e ao seu uso como composto intermediário no processo de preparação descrito acima:



em que U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴ e R⁵ são conforme definidos

15 acima.

A presente invenção também se refere a uma composição fungicida que compreende uma quantidade eficaz de um composto de Fórmula geral (I). Assim, de acordo com a presente invenção, é fornecida uma composição fungicida que compreende, como um ingrediente ativo, uma

20 quantidade eficaz de um composto de Fórmula geral (I) conforme definido no presente e um suporte, veículo ou carga agricolamente aceitável.

De acordo com a presente invenção, o termo "suporte" refere-se a um material natural ou sintético, orgânico ou inorgânico com o qual o material ativo é combinado para torná-lo mais fácil de aplicar, notavelmente nas partes

25 da planta. Portanto, este suporte é, 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, álcoois, em particular o butanol, solventes orgânicos, óleos minerais e de plantas e seus derivados. As misturas
5 de tais suportes também podem ser utilizadas.

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

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

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

em peso.

As composições de acordo com a presente invenção podem ser utilizadas em várias formas, tal como dispensador aerossol, suspensão em cápsula, concentrado de nebulização a frio, pó empoeirável, concentrado emulsificável, emulsão de óleo-em-água, emulsão água-em-óleo, grânulo encapsulado, grânulo fino, concentrado com capacidade de fluxo para o tratamento de sementes, gás (sob pressão), produto gerador de gás, grânulo, concentrado de nebulização a quente, macrogrânulo, microgrânulo, pó dispersível em óleo, concentrado com capacidade de fluxo miscível em óleo, líquido miscível em óleo, pasta, bastonete de planta, 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), suspensão de volume ultra baixo (UVL), grânulos ou tabletes dispersíveis em água, pó dispersível em água para o tratamento de calda, grânulos ou tabletes hidrossolúveis, pó hidrossolúvel para o tratamento de semente e pó umidificável.

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

Os compostos da presente invenção também podem ser misturados com um ou mais inseticidas, fungicidas, bactericidas, atrativos, acaricidas ou feromônios ou outros compostos com atividade biológica. As misturas assim obtidas possuem um espectro ampliado de atividade. As misturas com outros compostos fungicidas são particularmente vantajosas. Os exemplos de associações em mistura de fungicidas apropriados podem ser selecionados na seguinte lista:

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

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

(B3) um composto capaz de inibir a respiração, por exemplo,
- como um inibidor da respiração CI como o diflumentorim;
- como um inibidor da respiração CII como o boscalid, carboxina,
10 fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronila, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida;

- como um inibidor da respiração CIII como o azoxistrobin, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, cresoxim-metila, metominostrobina, orisastrobina, piraclostrobina,
15 picoxistrobina, trifloxistrobina;

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

(B14) um composto selecionado da seguinte lista: amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicin, carvona, chinometionat, cloropicrin, cufraneb,

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

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

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

As composições fungicidas da presente invenção podem ser utilizadas para controlar de maneira curativa ou preventiva o fungo fitopatogênico de plantas ou culturas. Deste modo, de acordo com um aspecto adicional da presente invenção, é fornecido um método para o controle curativo ou preventivo do fungo fitopatogênico de plantas ou culturas, caracterizado em que uma composição fungicida conforme definido anteriormente é aplicada à semente, à planta e/ou à fruta da planta ou ao solo em que a planta está crescendo ou em que é desejável que ela cresça.

A composição conforme utilizada contra fungos fitopatogênicos de culturas compreende uma quantidade eficaz e não fitotóxica de um material ativo de Fórmula geral (I).

A expressão "quantidade eficaz e não fitotóxica" significa uma quantidade de composição de acordo com a presente invenção é suficiente para controlar ou destruir o fungo presente ou sujeito a aparecer em culturas, e que não implica em qualquer sintoma notável de fitotoxicidade para dita cultura.

Tal quantidade pode variar dentro de um amplo intervalo dependendo do fungo a ser controlado, o tipo de cultura, as condições climáticas e os compostos incluídos na composição fungicida de acordo com a presente invenção.

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

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

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

raízes de beterraba); horticulturas e culturas em florestas; bem como homólogos geneticamente modificados destas culturas.

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

5 menção a:

Doenças do oídio, tais como:

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

10 - 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*;

15 Doenças da Ferrugem, tais como:

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

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

20 - Doença da Phakopsora, causada, por exemplo, pela *Phakopsora pachyrhizi* ou *Phakopsora meibomiae*;

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

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

Doenças de oomicetes, tais como:

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

- Doença da Peronospora, causada, por exemplo, pela

Peronospora pisi ou *P. brassicae*;

- Doença da Phytophthora, causada, por exemplo, pela

Phytophthora infestans;

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

5 *viticola*;

- Doença da Pseudoperonospora, causada, por exemplo, pela

Pseudoperonospora humuli ou *Pseudoperonospora cubensis*;

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

ultimum;

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

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

solani;

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

15 *beticola*;

- Doença da Cladosporium, causada, por exemplo, pela

Cladosporium cucumerinum;

- Doença da Cochliobolus, causada, por exemplo, pela

Cochliobolus sativus;

20 - Doença da Colletotrichum, causada, por exemplo, pela

Colletotrichum lindemuthanium;

- Doença da Cycloconium, causada, por exemplo, pela

Cycloconium oleaginum;

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

25 *citri*;

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

fawcettii;

- Doença da Gloeosporium causada, por exemplo, pela

Gloeosporium laeticolor,

- Doença da Glomerella, causada, por exemplo, pela *Glomerella cingulata*;

5 - Doença da Guignardia, causada, por exemplo, pela *Guignardia bidwelli*;

- Doença da Leptosphaeria, causada, por exemplo, pela *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;

- Doença da Magnaporthe, causada, por exemplo, pela *Magnaporthe grisea*;

10 - Doença da Mycosphaerella, causada, por exemplo, pela *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

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

15 - Doença da Pyrenophora, causada, por exemplo, pela *Pyrenophora teres*;

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

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

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

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

25 - Doença da Venturia, causada, por exemplo, pela *Venturia inaequalis*;

Doenças da raiz e do caule, tais como:

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

graminearum;

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

oxysporum;

- Doença da Gaeumannomyces, causada, por exemplo, pela

5 *Gaeumannomyces graminis*;

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

solani;

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

acuformis;

10 - Doença da Thielaviopsis, causada, por exemplo, pela

Thielaviopsis basicola;

Doenças da orelha e da panícula, tal como:

- Doença da Alternaria, causada, por exemplo, pela *Alternaria spp.*;

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

15 *flavus*;

- Doença da Cladosporium, causada, por exemplo, pela

Cladosporium spp.;

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

purpurea;

20 - Doença da Fusarium, causada, por exemplo, pela *Fusarium*

culmorum;

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

zeae;

- Doença da Monographella, causada, por exemplo, pela

25 *Monographella nivalis*;

Doença da fuligem e dos esporos, tais como:

- Doença da Sphacelotheca, causada, por exemplo, pela

Sphacelotheca reiliana;

- Doença da Tilletia, causada, por exemplo, pela *Tilletia caries*;
- Doença da Urocystis, causada, por exemplo, pela *Urocystis occulta*;
- Doença da Ustilago, causada, por exemplo, pela *Ustilago nuda*;

Doenças da decomposição da fruta e do mofo, tais como:

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

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

expansum;

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

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

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

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

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

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

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

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

- Doença da Microdochium, causada, por exemplo, pela *Microdochium nivale*;

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

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

Doenças da deterioração, tal como:

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

5 Doenças da pústula da folha ou do enrolamento da folha, tal como:

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

Doença do declínio das plantas de madeira, tais como:

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

Doenças das flores e das sementes, tal como:

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

Doenças do tubérculo, tal como:

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

A composição fungicida de acordo com a presente invenção também pode ser utilizada contra as doenças fúngicas sujeitas a crescerem em ou dentro de troncos. O termo "tronco" significa todos os tipos de espécies de 20 madeira, e todos os tipos de trabalho nesta madeira pretendida para a construção, por exemplo, madeira sólida, madeira de alta densidade, madeira laminada e compensada. O método para o tratamento do tronco, de acordo com a presente invenção consiste principalmente em colocar em contato um ou mais compostos de acordo da presente invenção ou uma composição de 25 acordo com a presente invenção; isto inclui, por exemplo, a aplicação direta, aspersão, imersão, injeção ou quaisquer outros meios apropriados.

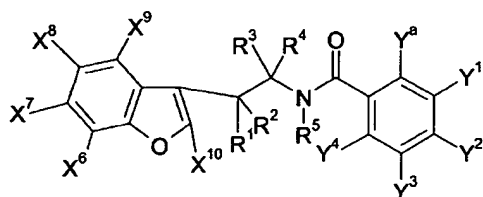
A dose do material ativo geralmente aplicada no método de tratamento de acordo com a presente invenção é, em geral e vantajosamente, de

10 a 800 g/ha, de preferência, de 50 a 300 g/ha, para as aplicações no tratamento foliar. A dose de substância ativa aplicada é, em geral e vantajosamente, entre 2 e 200 g por 100 kg de semente, de preferência, entre 3 e 150 g por 100 kg de semente no caso do tratamento de semente. Está claramente entendido que as doses indicadas no presente são dadas como exemplos ilustrativos da presente invenção. Um técnico no assunto irá saber como adaptar as doses de aplicação de acordo com a natureza da cultura a ser tratada.

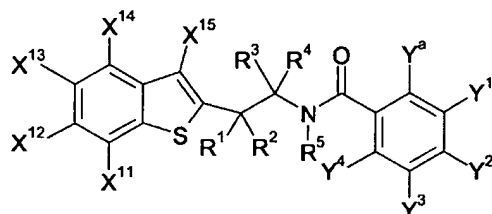
A composição fungicida de acordo com a presente invenção também pode ser utilizada no tratamento de organismos geneticamente modificados com os compostos de acordo com a presente invenção ou as composições agroquímicas de acordo com a presente invenção. As plantas geneticamente modificadas são plantas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

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

Os diversos aspectos da presente invenção serão agora ilustrados com referência às seguintes tabelas de compostos e exemplos. A seguinte tabela ilustra de um modo não limitante os exemplos de compostos de acordo com a presente invenção. Nos seguintes exemplos, $M + 1$ (ou $M - 1$) significa o pico de íon molecular, mais ou menos 1 a.m.u. (unidade de massa atômica) respectivamente, conforme observado na espectrometria de massa e M ($ApCl^+$) significa o pico de íon molecular

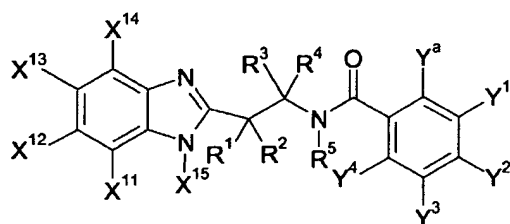
TABELA C

Comp.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰	M + 1
C-1	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	H	344
C-2	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	H	392
C-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	334

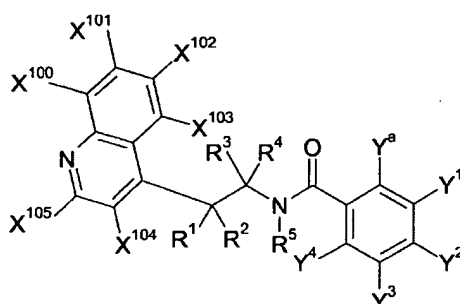
TABELA D

Comp.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M + 1
D-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	364
D-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	398
D-3	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	422
D-4	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	374
D-5	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	408
D-6	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	364
D-7	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	330
D-8	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	456
D-9	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	380
D-10	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	310
D-11	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	346

5

TABELA E

Comp.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M	
																+ 1	
E-1	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	362
E-2	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	420

TABELA F

Comp.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹⁰⁰	X ¹⁰¹	X ¹⁰²	X ¹⁰³	X ¹⁰⁴	X ¹⁰⁵	M
																	+ 1
F-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H		H	H	345

EXEMPLOS

Exemplos do processo para a preparação do composto de

5 Fórmula geral (I).

SÍNTESE DE N-[2-(5-CLORO-1-BENZOTIEN-3-IL)ETIL]-2-(TRIFLUOROMETILA)-

BENZAMIDA (COMPOSTO B-4)

PREPARAÇÃO DO [2-(5-CLORO-1-BENZOTIEN-3-IL)ETIL]CARBAMATO DE TERC-BUTILA

A uma solução agitada de (5-cloro-1-benzotien-3-il)acetonitrila
 10 (5,30 g, 25,6 mmol), hexahidrato de cloreto de níquel (II) (6,05g, 25,6 mmol), e
 dicarbonato de di-*terc*-butila (11,1 g, 51,0 mmol) em metanol (150 mL) sob uma
 atmosfera inerte de nitrogênio foi adicionado o borohidreto de sódio (4,8 g, 126
 mmol) em porções sobre um período de 10 min, mantendo a temperatura
 abaixo de 45° C. A mistura da reação foi agitada por 16 horas e diluída com
 15 acetato de etila (300 mL) e lavada com salmoura (300 mL). A camada orgânica
 foi seca (MgSO₄), filtrada e concentrada em vácuo para fornecer um óleo. A
 purificação por cromatografia por *flash* utilizando uma mistura 4:1 de heptano:

acetato de etila forneceu 7,8 g (98%) de [2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]carbamato *terc*-butila.

¹HNMR (250 MHz, CDCl₃): δ 7,76 – 7,69 (2H, m); 7,36 – 7,15 (2H, m); 4,72 – 4,60 (N-H, b); 3,57 – 3,40 (2H, m); 3,1 – 2,95 (2H, m); 1,4 (9H, s).

5

PREPARAÇÃO DO 2-(5-CLORO-1-BENZOTIEN-3-IL)ETANAMINA

A uma solução agitada de [2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]carbamato de *terc*-butila (7,80 g, 25,1 mmol) em diclorometano (100 mL) foi tratado com ácido trifluoroacético (28,5 g, 250 mmol) e a mistura de reação foi agitada a TA por 16 horas. Uma solução aquosa de hidróxido de sódio (200 mL, 1N) foi cuidadosamente adicionada e a temperatura foi mantida abaixo de 20° C. A mistura de reação foi agitada por 30 min e a camada orgânica foi seca (MgSO₄), filtrada e concentrada em vácuo para fornecer 4,9 g da amina desejada (92%).

¹HNMR (250 MHz, CDCl₃): δ 7,82 – 7,70 (2H, m); 7,40 – 7,10 (2H, m); 3,16 – 2,90 (4H, m); 1,6 – 1,4 (NH₂, b).

O sal de hidrocloreto foi obtido pela adição de ácido clorídrico etéreo e a filtração do precipitado incolor.

SÍNTESE DE N-[2-(5-CLORO-1-BENZOTIEN-3-IL)ETIL]-2-(TRIFLUOROMETILA)-BENZAMIDA (COMPOSTO B-4)

Uma mistura de 2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etanamina (90,0 mg, 42,5 mmol) e trietilamina (43,5 mg, 42,5 mmol) em THF (5 ml) foi tratada com cloreto de 2-trifluorometilbenzoíla (89,0 mg, 42,5 mmol) e a mistura foi aquecida no refluxo por 2 horas. Após o resfriamento à TA, a mistura foi concentrada em vácuo e o resíduo recolhido em acetato de etila (50 mL) e lavado com água (50 mL). A camada orgânica foi seca (MgSO₄), filtrada e concentrada em vácuo. A purificação do resíduo por cromatografia por *flash* utilizando uma mistura 4:1 de heptano: acetato de etila forneceu 160 mg (94%) de N-[2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]-2-(trifluorometila)-benzamida (Composto B-4).

Espectro de massa: $[M + 1] = 384$.

EXEMPLOS DA ATIVIDADE BIOLÓGICA DO COMPOSTO DE FÓRMULA GERAL (I)

EXEMPLO A: TESTE *IN VIVO* EM *ALTERNARIA BRASSICAE*

O ingrediente ativo testado é preparado pela homogeneização em cerâmica em uma formulação do tipo suspensão concentrada a 100 g/L. Esta suspensão é então diluída em água para obter a concentração do material ativo desejado.

As plantas de rabanete (variedade Pernot) em copos iniciadores, semeadas em um substrato solo de turfa – pozolana 50/50 e cultivada a 18 – 20° C, são tratadas no estágio de cotilédones pela 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 pela pulverização com uma suspensão aquosa de esporos de *Alternaria brassicae* (40.000 esporos por cm³). Os esporos são coletados de uma cultura de 12 – 13 dias.

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

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

Nestas condições, de proteção boa (pelo menos 50%) à total é observada em uma dose de 330 ppm com os seguintes compostos: D1, D2, D3 e D4 de acordo com a presente invenção e em uma dose de 500 ppm com os seguintes compostos: B1, B2, C3, D6, D8 e E1 de acordo com a presente invenção.

Pelo contrario, a proteção fraca (menos de 30%) à nenhuma proteção é observada com os compostos de N-benzoiltriptamina. Estes compostos de N-benzoiltriptamina são respectivamente:

- N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida, testado em uma dose de 330 ppm;

- N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-clorobenzamida, testado em uma dose de 500 ppm;

5 - N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(difluorometil)benzamida, testado em uma dose de 500 ppm.

Estes resultados mostram que os compostos de acordo com a presente invenção possuem uma atividade biológica muito melhor do que os compostos estruturalmente mais próximos descritos no pedido de patente chinês CN 1.365.971.

EXEMPLO B: TESTE IN VIVO NA PYRENOPHORA TERES

O ingrediente ativo testado é preparado pela homogeneização em cerâmica em uma formulação do tipo suspensão concentrada a 100 g/L. Esta suspensão é então diluída em água para obter a concentração do material ativo desejado.

As plantas de cevada (variedade Express) em copos iniciadores, semeadas em um substrato solo de turfa – pozolana 50/50 e cultivadas a 12° C, são tratadas no estágio da primeira folha (10 cm de altura) pela 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 pela pulverização das mesmas com uma suspensão aquosa de esporos de *Pyrenophora teres* (12.000 esporos por mL). Os esporos são coletados de uma cultura de 12 dias. As plantas de cevada contaminadas são incubadas por 24 horas a cerca de 20° C e a 100% de umidade relativa e, então, por 12 dias a 80% de umidade relativa.

A classificação é realizada 12 dias após a contaminação, em comparação com as plantas controle.

Nestas condições, de proteção boa (pelo menos 50%) à total é

observada em uma dose de 330 ppm com os seguintes compostos: D1 e D2 e em uma dose de 500 ppm com os seguintes compostos: C3, D3, D8 e F1.

Pelo contrário, nenhuma proteção é observada com os compostos de N-benzoiltriptamina. Estes compostos de N-benzoiltriptamina são respectivamente:

- N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida, testado em uma dose de 330 ppm;

- N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-clorobenzamida, testado em uma dose de 500 ppm;

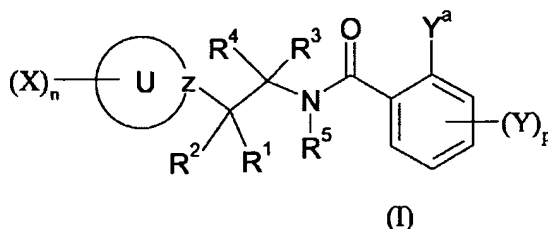
- N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-iodobenzamida, testado em uma dose de 500 ppm;

- N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(difluorometil)benzamida, testado em uma dose de 500 ppm.

Novamente, estes resultados mostram que os compostos de acordo com a presente invenção possuem uma atividade biológica muito melhor do que os compostos estruturalmente mais próximos descritos no pedido de patente chinês CN 1.365.971.

REIVINDICAÇÕES

1. COMPOSTO, de Fórmula geral (I):



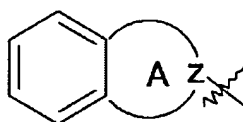
caracterizado pelo fato de que:

5

- n é 0, 1, 2, 3, 4, 5 ou 6;

- p é 1, 2, 3 ou 4;

- U é:



10 sendo que A representa um heterociclo de 5 ou 6 membros com um, dois ou três heteroátomos que podem ser os mesmos ou diferentes; fundido com um anel fenila para formar um benzoheterociclo contanto que este benzoheterociclo seja diferente de 3-1H-2H-indolil;

- Z é um átomo de carbono ou um heteroátomo que não pode ser substituído por X;

15

- X é o mesmo ou diferente e é um átomo de halogênio, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo sulfanila, um grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanila, um grupo formila, um grupo formilóxi, um grupo formilamino, um grupo carbóxi, um grupo carbamoíla, um grupo N-hidroxicarbamoíla, um grupo carbamato, um grupo (hidroxiimino)alquila C₁-C₆,
 20 uma alquila C₁-C₈, uma alquenila C₂-C₈, uma alquinila C₂-C₈, um alquilamino C₁-C₈, uma halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, um dialquilamino C₁-C₈, um alcóxi C₁-C₈, um halogenoalcóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilsulfanila C₁-C₈, uma halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, um alquenilóxi C₂-C₈, um

halogenoalquenilóxi C₂-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, um alquinilóxi C₃-C₈, um halogenoalquinilóxi C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma cicloalquila C₃-C₈, uma halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilcarbonila C₁-C₈, uma

5 halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilcarbamoíla C₁-C₈, uma dialquilcarbamoíla C₁-C₈, uma N- uma alquiloxicarbamoíla C₁-C₈, uma alcoxicarbamoíla C₁-C₈, uma N-alquil C₁-C₈-alcoxicarbamoíla C₁-C₈, uma alcoxicarbonila C₁-C₈, uma halogenoalcoxicarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, um

10 alquilcarbonilóxi C₁-C₈, um halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, um alquilcarbonilamino C₁-C₈, um halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, um dialquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, um alquiloxicarbonilóxi C₁-C₈, uma alquilsulfenila C₁-C₈, uma

15 halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilsulfenila C₁-C₈, uma halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma alquilsulfonila C₁-C₈, uma halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, um alcoxiimino C₁-C₆, uma (alcoxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, uma (alqueniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆,

20 uma (alquiniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, uma (benziloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, um benzilóxi, um benzilsulfanil, um benziamino, um fenóxi, um fenilsulfanil, um fenil ou um fenilamino;

- R¹ e R² são os mesmos ou diferentes e são um átomo de hidrogênio, um grupo ciano, um grupo formila, um grupo carbóxi, um grupo

25 carbamoíla, um grupo (hidroxiimino)-alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1

a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈, alcóxicarbamoíla C₁-C₈, alcóxicarbonila C₁-C₈ ou halogenoalcóxicarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio;

- R³ e R⁴ são os mesmos ou diferentes e são um átomo de hidrogênio, um grupo formila, um grupo carbamoíla, um grupo (hidroxiimino)-alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈ ou alcóxicarbamoíla C₁-C₈;

- R⁵ é um átomo de hidrogênio, alquila C₁-C₆ ou cicloalquila C₃-C₇;

- Y é o mesmo ou diferente e é um átomo de hidrogênio, um átomo de halogênio, um grupo nitro, um grupo ciano, um grupo hidroxila, um grupo amino, um grupo sulfanila, um grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanila, um grupo formila, um grupo formilóxi, um grupo formilamino, um grupo carbóxi, um grupo carbamoíla, um grupo N-hidroxicarbamoíla, um grupo carbamato, um grupo (hidroxiimino)alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, alquilamino C₁-C₈, dialquilamino C₁-C₈, alcóxi C₁-C₈, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalcóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfanila C₁-C₈, halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquenilóxi C₂-C₈, halogenoalquenilóxi C₂-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquinilóxi C₃-C₈, halogenoalquinilóxi C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈, N-alquiloxicarbamoíla C₁-C₈, alcóxicarbamoíla C₁-C₈, N-alquil alcóxicarbamoíla C₁-C₈, alcóxicarbonila C₁-C₈, halogenoalcóxicarbonila C₁-C₈

possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilóxi C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilamino C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, dialquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, alquiloxicarbonilóxi C₁-C₈, alquilsulfenila C₁-C₈, halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfinila C₁-C₈, halogenoalquilsulfinila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfonila C₁-C₈, halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alcoxiimino C₁-C₆, (alcoxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alqueniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alquiniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆ ou (benziloxiimino)-alquila C₁-C₆, e

- Y^a é um átomo de halogênio, um grupo ciano, um grupo sulfanila, um grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanila, um grupo formila, um grupo formilóxi, um grupo formilamino, um grupo carbamoíla, um grupo N-hidroxycarbamoíla, um grupo carbamato, um grupo (hidroxiimino)alquila C₁-C₆, alquila C₁-C₈, alquenila C₂-C₈, alquinila C₂-C₈, alcóxi C₁-C₈, halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, halogenoalcóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfanila C₁-C₈, halogenoalquilsulfanila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquenilóxi C₂-C₈, halogenoalquenilóxi C₂-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquinilóxi C₃-C₈, halogenoalquinilóxi C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, cicloalquila C₃-C₈, halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonila C₁-C₈, halogenoalquilcarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbamoíla C₁-C₈, dialquilcarbamoíla C₁-C₈, N-alquiloxicarbamoíla C₁-C₈, alcoxicarbamoíla C₁-C₈, N-alquilalcoxicarbamoíla C₁-C₈, alcoxycarbonila C₁-C₈, halogenoalcoxycarbonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilcarbonilóxi C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilóxi C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio,

alquilcarbonilamino C₁-C₈, halogenoalquilcarbonilamino C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, dialquilaminocarbonilóxi C₁-C₈, alquiloxicarbonilóxi C₁-C₈, alquilsulfenila C₁-C₈, halogenoalquilsulfenila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfinila C₁-C₈, halogenoalquilsulfinila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alquilsulfonila C₁-C₈, halogenoalquilsulfonila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, alcoxiimino C₁-C₆, (alcoxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (alqueniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆ ou (alquiniloxiimino C₁-C₆)-alquila C₁-C₆, (benziloxiimino)-alquila C₁-C₆;

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

2. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1, caracterizado pelo fato de que n é 0, 1 ou 2.

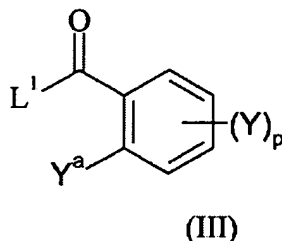
3. COMPOSTO, de acordo com a reivindicação 1 ou 2, 15 caracterizado pelo fato de que X é selecionado como sendo um grupo alquila C₁-C₄, um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, um grupo amina, um grupo nitro, um grupo alcóxi C₁-C₄, um alquiltio C₁-C₄, uma alquilsulfonila C₁-C₄, uma halogenoalquila C₁-C₄ que possui de 1 a 5 átomos de halogênio.

4. COMPOSTO, de acordo com uma das reivindicações de 1 20 a 3, caracterizado pelo fato de que R¹ e R² são selecionados, independentemente de cada um, como sendo um átomo de hidrogênio, uma alquila C₁-C₈, uma alquenila C₂-C₈, uma alquinila C₂-C₈, uma cicloalquila C₃-C₈, uma halogenocicloalquila C₃-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio, uma halogenoalquila C₁-C₈ possuindo de 1 a 5 átomos de halogênio.

25 5. COMPOSTO, de acordo com uma das reivindicações de 1 a 4, caracterizado pelo fato de que R³ e R⁴ são selecionados, independentemente de cada um, como sendo um átomo de hidrogênio, uma alquila C₁-C₈, uma alquenila C₂-C₈, uma alquinila C₂-C₈, uma cicloalquila C₃-C₈,

uma das reivindicações de 1 a 9;

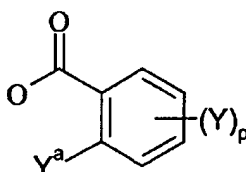
com um derivado de ácido carboxílico de Fórmula geral (III)



em que:

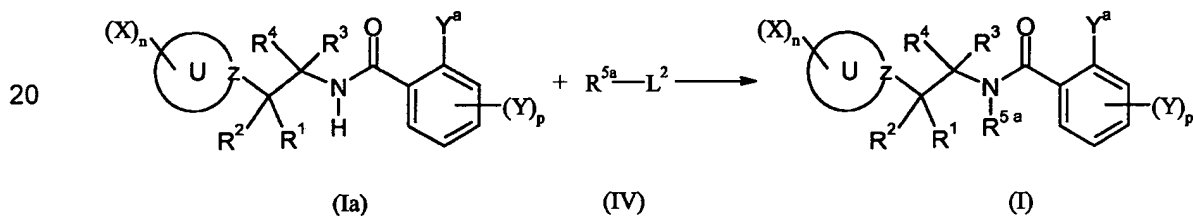
5 - Y^a, Y e p são conforme descritos em uma das reivindicações de 1 a 8; e

- L¹ é um grupo de partida selecionado como sendo um átomo de halogênio, um grupo hidroxila, -OR⁶, -OCOR⁶, R⁶ sendo uma alquila C₁-C₆, uma haloalquila C₁-C₆, uma benzila, uma 4-metoxibenzila, uma pentafluorofenila ou um grupo de Fórmula



na presença de um catalisador e, se L¹ for um grupo hidroxila, na presença de um agente de condensação.

11. PROCESSO, de acordo com a reivindicação 10, caracterizado em que R⁵ é um átomo de hidrogênio, e que o processo é completado por uma etapa adicional conforme o seguinte esquema de reação:



em que:

25 - U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴, Y^a, Y e p são conforme descritos na reivindicação 10;

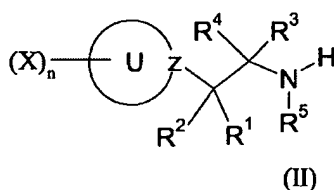
- R^{5a} é uma alquila C₁-C₆ ou uma cicloalquila C₃-C₇;

- L² é um grupo de partida selecionado como sendo um átomo de halogênio, um 4-metil fenilsulfonilóxi ou um metilsulfonilóxi;

que compreende a reação de um composto de Fórmula geral (Ia)

5 com um composto de Fórmula geral (IV) para fornecer um composto de Fórmula geral (I).

12. COMPOSTO, de Fórmula geral (II)



caracterizado pelo fato de que U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴ e R⁵ são

10 conforme descritos em uma das reivindicações 1, 2, 3, 4, 5 ou 9.

13. COMPOSIÇÃO FUNGICIDA, caracterizada pelo fato de que compreende uma quantidade eficaz de um composto conforme descrito em uma das reivindicações de 1 a 9 e um suporte agricolamente aceitável.

14. MÉTODO PARA O COMBATE CURATIVO OU
 15 PREVENTIVO DE FUNGO FITOPATOGÊNICO de culturas, caracterizado pelo fato de que uma quantidade eficaz e não fitotóxica de uma composição conforme descrita na reivindicação 13 é aplicada à semente de plantas, ou às folhas de plantas e/ou às frutas de plantas ou ao solo em que as plantas estão crescendo ou em que é desejável que elas cresçam.

RESUMO**“COMPOSTOS, PROCESSO PARA A PREPARAÇÃO DE COMPOSTO,
COMPOSIÇÃO FUNGICIDA E MÉTODO PARA O COMBATE CURATIVO OU
PREVENTIVO DE FUNGO FITOPATOGÊNICO”**

5 A presente invenção refere-se a novos derivados de benzoheterociclietilbenzamida de Fórmula (I) em que os substituintes estão no relatório descritivo, ao seu processo de preparação, ao seu uso como fungicidas, em particular, na forma de composições fungicidas e aos seus métodos para o controle de fungos de plantas.