

DATOS DEL SOLICITANTE

EP 1097932

(71) Nombres y Apellidos o Razón Social

Nihon Nohyaku Co., Ltd.

No. de Identificación

Representante Legal (Persona Jurídica)

País de Domicilio

JAPON

Departamento o Estado

Dirección

1-2-5, Nihonbashi, Chuo-ku, Tokio, Japón

Ciudad

Tokio

Teléfono

(74) DATOS DEL APODERADO

Nombre

GERMAN A. CUBILLOS MENDOZA

Dirección y Domicilio

Calle 17 No. 8-49 Of. 408, Bogotá, Colombia

Ciudad

Bogotá

Teléfono 2432835

DATOS DEL INVENTOR

(72) Nombre del Inventor(es)

1) Masahiro UEHARA 2) Masamitsu WATANABE, 3) Masayuki KIMURA
4) Masayuki MORIMOTO 5) Masanori YOSHIDA

Identificación

Dirección

1) 115-12, Joroku, Sakai-shi, Japón 2) 1-28-307, Nishinoyamacho, Kawachinagano-shi, Japón
3) 15-5, Midorigaokaminamimachi Kawachinagano-shi, Japón 4) 1-28-305 Nishinoyamacho,
Kawachinagano-shi, Japón 5) 5-3, Koyodai-2-chome, Hashimoto-shi, Japón

Ciudad

Teléfono

DATOS DE LA PATENTE DE INVENCION

(54) Título de la Invención

**"DERIVADOS (TIONA) AMINOQUINAZOLINONA SUSTITUIDOS O
SALES DE LOS MISMOS, COMPUESTOS INTERMEDIOS DE LOS MISMOS, Y
CONTROLADORES DE PLAGAS Y UN METODO PARA UTILIZACIÓN DE LOS MISMOS"**

PRIORIDAD REIVINDICADA

SI ☐

NO ☐

TIPO DE PRIORIDAD

ANDINA ☐

UNIONISTA ☒

(33) País

Japón
Japón

(32) Fecha

Noviembre 02 de 1999
Marzo 30 de 2000

(31) No. Solicitud

11-312297
2000-094493

Para Publicar a los

☐ 6 meses

☐ 12 meses

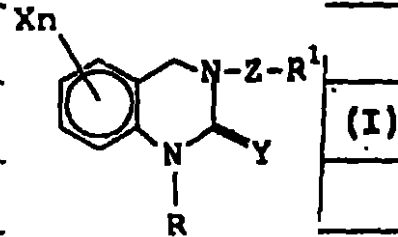
☐ 18 meses a partir de la fecha de la presente solicitud

(51) CLASIFICACION INTERNACIONAL

A01N 43/54

RESUMEN CON EL OBJETO Y LA FINALIDAD DE LA PATENTE DE LA INVENCION

Un controlador de plaga que contiene, como ingrediente activo, un derivado (tione) aminoquinazolinona sustituido o sal del mismo representado por la fórmula general (I):



En donde R es H, OH, grupo formilo, grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo hidroxil(C₁₋₆)alquilo, grupo alquenoilo (C₂₋₆), grupo alquilo(C₁₋₆)amino (sustituido), grupo aminocarbonilo (sustituido), grupo fenil(C₁₋₃)alquilo (sustituido), grupo fenilalquil(C₁₋₃)alquilo (sustituido), grupo 1, 3-dioxolana-2-il alquilo (C₁₋₃), grupo ftalimido(C₁₋₆)alquilo y lo similar; R¹ es grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros que posee 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste de O, S y N; Y es Q o S; Z es grupo de la fórmula -N-C(R²)- o -N(R²)-CH(R²) (en donde cada uno de R² y R² es átomo de hidrógeno, grupo alquilo (C₁₋₆) o lo similar); X es Br, I, OH, CN, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo alquenoilo (C₂₋₆), grupo aminocarbonilo (sustituido), grupo feniloxilo (sustituido) o lo similar; n es un entero de 0 a 4, y dicho derivado aminoquinazolinona sustituido o sal del mismo posee excelente efecto insecticida a bajas dosis contra la mosca blanca del invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*) etc., respecto a compuestos convencionales con estructura química análoga que no presentan el efecto insecticida deseado.

ANEXOS DE LA SOLICITUD

Certificado de Existencia y Representación Legal cuando el solicitante sea Persona Jurídica ☐

Los poderes debidamente otorgados, o mención de su protocolización ante la SIC ☒

Recibo de la tasa respectiva ☒

Recibo de la tasa por concepto de excedente de palabras en la publicación ☐

Si se reivindica prioridad Andina:

Copia de la primera solicitud ☐

Traducción oficial ☐

Si se reivindica prioridad Unionista:

Copia certificada primera solicitud: ☐

Nota: Debe presentarse dentro de los tres (3) meses, contados a partir de la fecha de radicación de la solicitud posterior

Traducción simple ☒

Capítulo descriptivo ☒

Dibujos, planos necesarios ☒

Capítulo reivindicatorio ☒

Tarjeta archivo propietario según formato ☒

Tarjeta archivo temático según formato ☒

Extracto para publicación según formato ☒

Arte final 12 x 12 cms y 6x6 cms ☒

Otros Documentos ☐

SOLICITO LA CONCESION DE LA PATENTE DE LA INVENCION
QUE LA INVENCION ES NUEVA Y DE MI PROPIEDAD

Y DECLARO

FIRMA

NOMBRE GERMAN A. CUBILLOS MENDOZA CC. 19'397.479

T.P. Nº 38422 C

CAPITULO DESCRIPTIVO

DERIVADOS (TIONA) AMINOQUINAZOLINONA SUSTITUIDOS O SALES DE
LOS MISMOS. COMPUESTOS INTERMEDIOS DE LOS MISMOS. Y
CONTROLADORES DE PLAGAS Y UN MÉTODO PARA UTILIZACIÓN DE LOS
MISMOS

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Campo de la invención

La presente invención se refiere al derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o sales de los mismos, compuestos intermedios de los mismos para preparar el mismo, controladores de plaga y un método por usar el mismo.

Técnica anterior

La publicación de patente Japonesa no examinada, JP-A8-325239 describe que los derivados de aminoquinazolinona son útiles como controladores de plaga.

SUMARIO DE LA INVENCION

Como consecuencia de investigación seriamente dirigida a encontrar a un novedoso controlador de plaga, los presentes inventores encontraron que los compuestos de la presente invención y que poseen sustituyentes en el grupo fenilo que pertenece al anillo quinazolinona, poseen el mismo o mejor efecto insecticida en una baja dosificación en comparación con los compuestos de los Ejemplos descriptos en la JP-A-8-325239 mencionada precedentemente. Particularmente los compuestos de la presente invención poseen el suficiente efecto insecticida contra mosca blanca considerada perjudicial en los campos

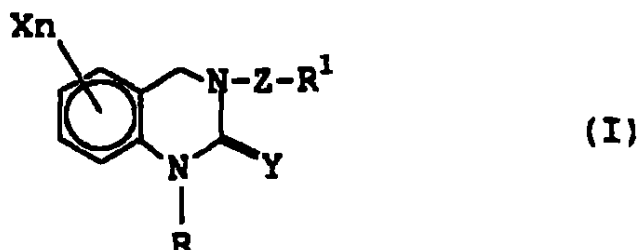
agrícolas y hortícolas, por consiguiente los presentes inventores han realizado la presente invención.

El derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o sales del mismo representadas por la fórmula general (I) y los compuestos representados por la fórmula general (II) los cuales son compuestos intermedios para preparar los derivados de la fórmula general (I) son compuestos novedosos que no se han conocido en ninguna literatura de la técnica anterior. Además, los controladores de plaga contienen, como ingrediente activo, el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido representado por la fórmula general (I) o sales del mismo posee el efecto insecticidal excelente contra los diversos insectos en una baja dosificación en comparación con los controladores de plaga convencionales.

Los inventores presentes han realizado seriamente una investigación en los derivados (tiona) aminoquinazolinona para desarrollar un nuevo controlador de plaga que posee un extenso espectro insecticida. Finalmente, los inventores han encontrado el hecho que los derivados de aminoquinazolinona novedosos que poseen átomo de bromo, átomo de iodo, grupo perfluoroalquilo, grupo perfluoroalcoxilo o lo similar en el anillo quinazolina poseen una excelente actividad insecticida como controladores de plaga.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION

La presente invención se refiere a derivados (tiona) aminoquinazolinona sustituido representados por la fórmula general (I), o sales de los mismos:



[donde R es un átomo de hidrógeno; un grupo hidroxilo; un grupo formilo; grupo alquilo (C₁₋₁₂); un grupo halo (C₁₋₆) alquilo; un grupo hidroxil(C₁₋₆)alquilo; un grupo alquenilo (C₂₋₆); un (C₂₋₆) grupo alquinilo; un grupo alcoxilo (C₁₋₆); un grupo halo (C₁₋₆) alcoxilo; un grupo alcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₃); un grupo alcoxi (C₁₋₆)alcoxi(C₁₋₃)alquilo(C₁₋₃); un grupo alquiltio(C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C₁₋₆); un grupo alquilsulfonilo (C₁₋₆); un grupo alquiltio (C₁₋₆) alquilo (C₁₋₃); un grupo dialcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₃) en el cual los grupos alcoxilos (C₁₋₆) pueden ser iguales o diferentes; un grupo alquil(C₁₋₆)amino sin sustituir; un grupo alquil(C₁₋₆)amino sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, (C₁₋₆) grupo alquenilo y grupo alquinilo (C₂₋₆); un grupo ciano(C₁₋₆)alquilo;

un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo hidroxycarbonil(C_{1-6})alquilo; un grupo alcoxycarbonil (C_{1-6})alquilo(C_{1-6}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo cicloalquil (C_{1-6})alquilo(C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcóxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxilo, (C_{1-6}) grupo alquiltio y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxilo (C_{1-6}), grupo halo (C_{1-6})alcóxilo, grupo (C_{1-6}) alquiltio y grupo halo(C_{1-6}) alquiltio; un grupo feniltio sin sustituir; un grupo feniltio sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxilo (C_{1-6}), grupo halo

(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆) alquiltio; un grupo fenilsulfonilo sin sustituir; un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆) alquilsulfonilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆) alquilsulfonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; grupo feniloxycarbonilo sin sustituir; un grupo feniloxycarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆) alquiltio; un grupo feniloxi(C₁₋₆)alquilo sin sustituir, un grupo feniloxi(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo

8

nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6}) alquiltio; un grupo fenil (C_{1-6}) alquenilo sin sustituir, un grupo fenil(C_{1-6}) alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-6}) alquinilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6}) alquinilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-6}) alquinil(C_{1-6}) alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6}) alquinil(C_{1-6}) alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo halo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-6}); un grupo 1,3-dioxolan-2-il(C_{1-6}) alquilo; o un grupo ftalimido(C_{1-6}) alquilo,

R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^2 es igual al definido precedentemente, y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), un grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-3}) o un grupo halo(C_{1-3})alquilcarbonilo),

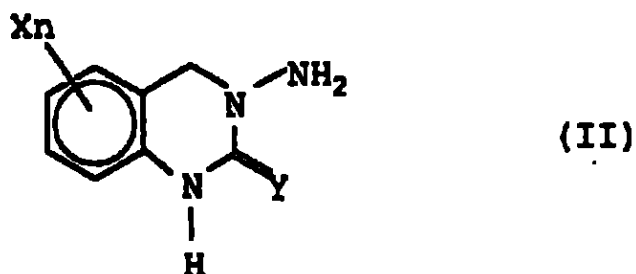
X puede ser igual o diferente, y es un átomo de bromo, un átomo de iodo; un grupo hidróxido; un grupo ciano; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquénilo (C_{2-6}); un grupo halo(C_{2-6})alquénilo; un grupo alquínilo (C_{2-6}); un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo

alquilsulfinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfonilo; un grupo halo(C_{1-6})alcoxihalo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alqueno (C_{2-6}) y grupo alquino (C_{2-6}); un grupo carboxi(C_{1-6}) alquilo; un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo aminocarbonil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alqueno (C_{2-6}) y grupo alquino (C_{2-6}); un grupo ácido sulfónico; un grupo aminosulfonilo sin sustituir; un grupo alcoxysulfonilo (C_{1-6}); un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alqueno (C_{2-6}) y grupo alquino (C_{2-6}); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio, grupo

alcoxisulfonilo (C_{1-6}) y un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de 0 a 4], controladores de plaga que contienen el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o sal del mismo como el ingrediente activo, y un

método para utilizar los controladores de plaga.

La presente invención también se refiere a compuestos intermedios para producir los derivados mencionados precedentemente, representados por la fórmula general (II):



[en donde, X puede ser igual o diferente y es un átomo de bromo, un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo ciano; un grupo alquilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilo; un grupo alquenilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquenilo; un grupo alquinilo (C₁₋₆); un grupo alcoxilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo alquiltio (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfinil ; un grupo alquilsulfonilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfonilo; un grupo halo(C₁₋₆)alcoxihalo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcóxicarbonilo (C₁₋₆); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo alquenilo (C₁₋₆) y grupo alquinilo (C₁₋₆); un grupo carboxi(C₁₋₆) alquilo; un grupo alcóxicarbonil(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₆); un grupo

aminocarbonil(C₁₋₆)alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo alquenoilo (C₁₋₆) y grupo alquinoilo (C₁₋₆); un grupo de ácido sulfónico; un (C1-6) grupo alcóxisulfonilo; un grupo sulfonamida que posee un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁₋₆), un grupo alquenoilo (C₁₋₆) o un grupo alquinoilo (C₁₋₆) en el átomo de nitrógeno; un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcóxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcóxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomo halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcóxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcóxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)

alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; n es un entero de 0 a 4; y Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre].

Los controladores de plaga de la presente invención contienen, como el ingrediente activo, el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o sales del mismo representadas por la fórmula general (I) que posee excelentes efectos insecticidas a una baja dosificación contra la mosca blanca del invernadero (*vaporariorum Trialeurodes*) y lo similar, respecto a los compuestos convencionales que tienen estructuras químicas similares y no demuestran efecto insecticida. Así, los derivados aminoquinazolinona sustituidos (tiona) de la presente invención son excelentes controladores de plaga en comparación con los controladores convencionales.

En las definiciones de cada sustituyente de los derivados (tiona) aminoquinazolinona sustituidos de la fórmula general (I) de la presente invención, el "átomo de halógeno" significa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de iodo o un átomo

de flúor. El término " (C_{1-12}) " significa 1 a 12 átomos de carbono. El término "grupo alquilo (C_{1-12})" significa un grupo alquilo lineal o ramificado de 1 a 12 átomos de carbono, por ejemplo un grupo alquilo tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo, n-dodecilo y lo similar. El término "grupo halo(C_{1-10})alquilo" significa un grupo alquilo sustituido y lineal o ramificado de 1 a 10 carbono átomos que posee, como sustituyente(s), uno o más átomos halógeno que pueden ser iguales o diferentes, por ejemplo grupo trifluorometilo, grupo pentafluoroetilo, grupo heptafluoropropilo y lo similar. El término "grupo alquenilo (C_{2-6})" significa un grupo alquenilo lineal o ramificado de 2 a 6 átomos de carbono que posee uno o más enlaces dobles. El término "grupo halo(C_{2-6})alquenilo" significa un grupo alquenilo sustituido lineal o ramificado de 2 a 6 átomos de carbono que posee, como sustituyente(s), uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. El término "grupo alquinilo (C_{2-6})" significa un grupo alquinilo lineal o ramificado de 2 a 6 átomos de carbono que posee uno o más enlaces triples. El término "grupo halo(C_{2-6})alquinilo" significa un grupo alquinilo sustituido lineal o ramificado de 2 a 6 carbono átomos que posee, como sustituyente(s), uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. El término "anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 o más heteroátomos

que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno" significa cualquier anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros por ejemplo, furano, tiofeno, pirrol, oxazol, tiazol, pirazol, imidazol, 1,2,3-tiadiazol, 1,2,4-tiadiazol, 1,2,5-tiadiazol, 1,3,4-tiadiazol, 1,2,4-triazol, piridina, piridazina, pirimidina, pirazina, pirrolidina, piperidina, morpholina, tiomorpholina, ditiolano, ditian, piperazina, dioxolan, imidazolidina, tetrahidrofurano y lo similar.

Los sustituyentes del derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido representados por la fórmula general (I) están preferentemente de acuerdo con lo siguiente: R es un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, un grupo alquilo (C₁₋₆), un grupo alquenilo (C₂₋₆), un grupo alquinilo (C₂₋₆), un grupo alquilcarbonilo (C₁₋₆), un grupo alcoxicarbonilo (C₁₋₆), un grupo alquiltio (C₁₋₆), un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio, un grupo fenilcarbonilo, un grupo fenilcarbonilo sustituido, un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sustituido, un grupo fenil(C₂₋₆)alquenilo sustituido o un grupo fenil(C₂₋₆)alquinilo sustituido; R¹ es un grupo piridilo, particularmente grupo 3-piridilo; Y es átomo de oxígeno o un átomo de azufre; Z es un grupo de la fórmula,



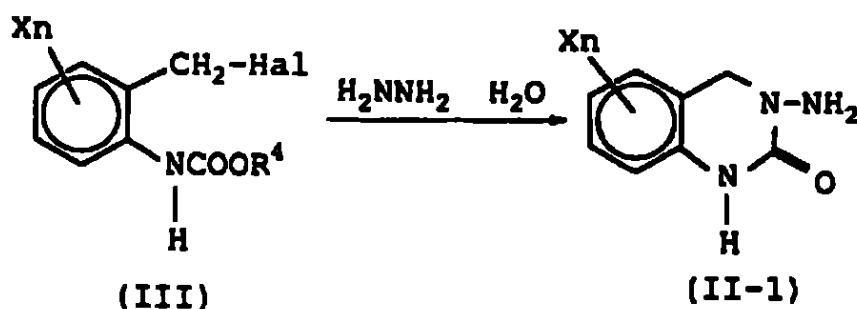
(en donde R² y R³ son cada uno un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C₁₋₆)); X es un átomo de bromo, un átomo de iodo, un grupo halo(C₁₋₆)alquilo, un grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, un grupo

halo(C₁₋₆)alquiltio, un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfinilo, un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfonilo o un grupo fenilo); y n puede ser preferentemente un entero de valor 0 a 2.

Como la sal del derivativo (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula (I), pueden ejemplificarse sales con ácidos minerales tales como ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, etc., y sales con átomos de metal alcalino como sodio, potasio, etc.

El compuesto de la fórmula (II), un compuesto intermedio utilizado para producir el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula (I) puede ser producido por cualquiera de los procedimientos siguientes.

Procedimiento de producción 1.



en donde X y n son iguales a los definidos precedentemente, R⁴ es un grupo alquilo (C₁₋₆), y Hal es un átomo de halógeno.

Un compuesto de la fórmula general (II-1) puede ser producido haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula general anterior (III) con hidrato de hidrazina en la presencia de un solvente inerte.

Como el solvente inerte utilizable en esta reacción, puede usarse cualquier solvente inerte en tanto no inhiba el progreso de la reacción notablemente. Pueden ejemplificarse alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol, etc.; los hidrocarburos halogenados tales como diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, etc.; los hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, monoclorobenceno etc.; nitrilos tales como acetonitrilo, benzonitrilo, etc.; cellosolve tal como cellosolve de metilo, etc.; los éteres tales como dietil éter, diglima, dioxano, tetrahidrofurano, etc.; las amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, 1-metil-2-pirrolidona, etc.; el dimetil sulfoxido; sulfolano; y agua. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o como una mezcla de los mismos.

La temperatura de la reacción puede escogerse propiamente en el rango de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente inerte usado, y preferentemente varía desde temperatura ambiente a 90°C.

Debido a que la reacción es una reacción equimolar, es suficiente que el compuesto de la fórmula general (III) y el hidrato de hidrazina se usen en cantidades equimolares, aunque cualquiera de estos reactivos puede usarse en exceso. Es preferible usar hidrato de hidrazina en exceso.

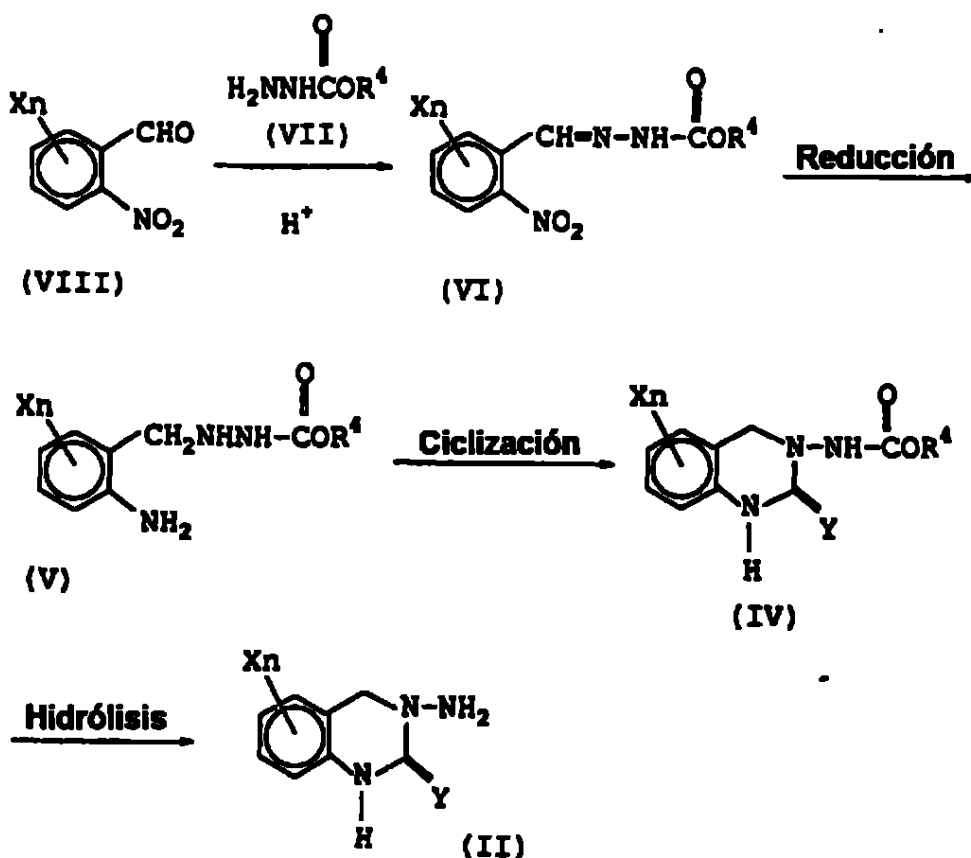
Aunque el tiempo de reacción depende de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., que varía desde

varios minutos a 48 horas.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado es aislado de la mezcla de reacción que contiene el compuesto deseado por medio de un método convencional, y si es necesario, es purificado por recristalización, cromatografía en columna seca, etc., por medio de lo cual el compuesto deseado puede producirse.

El compuesto de la fórmula general anterior (III) puede producirse según "Collect. Czech. Chem. Commn." (Vol. 55), 752 (1990).

Procedimiento de producción 2.



en donde R^1 , X, Y y n son iguales a los definidos precedentemente.

2-1. Fórmula general (VIII) $\rightarrow$ fórmula general (VI)

Un compuesto de la fórmula general (VI) puede ser producido haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula general (VIII) con un compuesto de la fórmula general (VII) en la presencia de un solvente inerte y un catalizador.

Como el solvente inerte utilizable en esta reacción, pueden usarse, por ejemplo, los solventes inertes ejemplificados en el procedimiento de producción 1. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o como una mezcla de los mismos. Como el catalizador, pueden usarse ácidos inorgánicos (por ej. ácido clorhídrico y ácido sulfúrico), ácido acético, ácido tolunesulfónico, etc. La cantidad del catalizador usada puede ser tal que el catalizador está presente en el sistema de reacción en una cantidad de 0,001 % en peso a 10 % en peso basado en el peso del compuesto de la fórmula general (VIII).

Debido a que la reacción es una reacción equimolar, es suficiente que el compuesto de la fórmula general (VIII) y el compuesto de la fórmula general (VII) se usen en cantidades equimolares, aunque cualquiera de estos reactivos puede usarse en exceso.

La temperatura de la reacción puede escogerse apropiadamente dentro del rango de temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente inerte usado, y preferentemente varía

desde la temperatura ambiente hasta 90°C.

Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., que va de varios minutos a 48 horas.

La mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado se trata de la misma manera como en el procedimiento de producción 1 después de la realización de la reacción, con lo cual puede producirse el compuesto deseado.

El compuesto de la fórmula general (VIII) puede ser uno que es comercialmente disponible o puede ser producido por nitración de un benzaldehído sustituido. Además, el compuesto de la fórmula (VIII) puede producirse según el método descrito en "Journal of Chemical Society", 1927, pág. 2375-2378.

2-2. Fórmula general (VI) → fórmula general (V)

Un compuesto de la fórmula general (V) puede ser producido reduciendo el compuesto de la fórmula general (VI) con un agente reductor o por reducción catalizadora en la presencia o ausencia de un solvente inerte.

Como el agente reductor, puede usarse, por ejemplo, hidruros de metal tales como, NaBH_4CN , LiBH_4CN , etc. y agentes reductores tales como BH_3 , etc. La cantidad del agente reductor usada puede elegirse apropiadamente dentro del rango desde 1 mol respecto a los moles en exceso (en los términos del número de moles de hidruro como agente reductor) por mol del compuesto de la fórmula general (VI).

Como el solvente inerte utilizable en la reacción, puede utilizarse cualquier solvente inerte en tanto no inhiba notablemente el progreso de la reacción. Pueden ejemplificarse los alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol, etc.; cellosolve tal como metil cellosolve, etc.; los éteres tales como dietil éter, diglima, dioxano, tetrahidrofurano, etc.; los ésteres tales como acetato de etilo, etc.; las amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, 1-metil-2-pirrolidona, etc.; dimetil sulfóxido; sulfolano; y agua. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o como una mezcla de los mismos.

La reacción se lleva a cabo bajo las condiciones ácidas o neutras en el pH que puede variar de 1 a 7, preferentemente 4 a 6. Es suficiente que el pH sea ajustado agregando cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno o lo similar al sistema de la reacción.

La temperatura de la reacción es elegida en el rango de 0°C al punto de ebullición del solvente, y preferentemente varía desde la temperatura ambiente hasta 70°C.

Aunque el tiempo de la reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., puede ser desde varios minutos a 48 horas.

La mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado se trata de la misma manera como en el Procedimiento de producción 1 después de la realización de la reacción, con lo

cual puede producirse el compuesto deseado.

Cuando la reducción catalítica se lleva a cabo como una reacción de reducción, se realiza según, por ejemplo, el método que se describe en "Shin Jikken Kagaku Koza", Vol. 15-11, "Maruzen Co., Ltd". Como el solvente inerte utilizable en este caso, pueden ejemplificarse alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol, etc.; cellosolve tal como metil cellosolve, etc.; los éteres tales como dietil éter, diglima, dioxano, tetrahidrofurano, etc.; los hidrocarburos tales como hexano, ciclohexano, etc.; ácidos grasos o ésteres de los mismos, tales como ácido acético, acetato de etilo, etc.; las amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, 1-metil-2-pirrolidona, etc.; y ureas tales como tetrametilurea, etc. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o como una mezcla de los mismos.

Como el catalizador usado en la reacción de reducción, pueden ejemplificarse catalizadores típicos para la reducción catalítica, tales como paladio-carbono, negro de paladio, dióxido de platino, níquel Raney, etc. La cantidad del catalizador usada puede elegirse adecuadamente en el rango desde 0,1% equivalente molar a 5% equivalente molar, preferentemente 0,5% equivalente molar a 1% equivalente molar, en relación al compuesto de la fórmula general (VI).

La presión de hidrógeno en la reacción varía desde la presión atmosférica hasta 300 atmósferas, preferentemente desde

presión atmosférica hasta 50 atmósferas.

La temperatura de acción puede elegirse adecuadamente en el rango desde la temperatura ambiente al punto de ebullición del solvente inerte usado, y preferentemente varía desde la temperatura ambiente a 70°C.

Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., que va de varios minutos a 48 horas.

Después de la realización de la reacción, la mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado se trata de la misma manera como en el caso de usar un agente reductor, con el cual puede producirse el compuesto deseado.

2-3. Fórmula general (V) $\rightarrow$ fórmula general (IV)

Un compuesto de la fórmula general (IV) puede ser producido haciendo reaccionar el compuesto de la fórmula general (V) con 1,1'-carbonilbis-1H-imidazol (CDI), un haluro del alcoxycarbonilo, fosgeno o tiofosgeno en la presencia de un solvente inerte y en la presencia o ausencia de una base.

Como el solvente inerte utilizable en la reacción, pueden ejemplificarse éteres tales como dietil éter, diglima, dioxano, tetrahidrofurano, etc., e hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, etc. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o como una mezcla de los mismos.

Como la base, puede usarse una base inorgánica o una base orgánica, y pueden ejemplificarse bases inorgánicas tales como

25

los hidróxidos y carbonatos de metales alcalinos y los metales alcalino térreos [por ej. el hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de magnesio, carbonato de sodio, hydrogencarbonato de sodio y carbonato de potasio], y bases orgánicas tales como trietilamina y piridina. Cuando el CDI se usa como un reactivo, la reacción puede llevarse a cabo sin una base.

La cantidad de la base usada es de 2 moles o más por el mol del compuesto de la fórmula general (V).

La temperatura de la reacción puede elegirse apropiadamente en el rango desde la temperatura ambiente hasta el punto del ebullición del solvente inerte usado, y varía preferentemente desde la temperatura ambiente hasta 100°C.

Aunque el tiempo de la reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., el tiempo varía desde varios minutos a 48 horas.

La mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado se trata de la misma manera como en el procedimiento de producción 1 después de la realización de la reacción, con lo cual puede producirse el compuesto deseado.

2-4. Fórmula general (IV) → fórmula general (II)

Un compuesto de la fórmula general (II) puede ser producido por hidrolización del compuesto de la fórmula general (IV) bajo la condición básica en la presencia de un solvente inerte.

Como el solvente inerte utilizable en esta reacción,

pueden ejemplificarse alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol, etc.; los hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, etc.; los éteres tales como dietil éter, diglima, dioxano, tetrahidrofurano, etc.; y agua. Estos solventes inertes pueden usarse individualmente o como una mezcla de los mismos.

Como la base, se pueden utilizar hidróxidos de metales alcalino o metales alcalino térreos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de magnesio, etc.

Dependiendo del grupo alquilo para R', la reacción también puede llevarse a cabo bajo condiciones ácidas usando un ácido orgánico o inorgánico tal como ácido trifluoroacético o ácido clorhídrico.

La temperatura de la reacción puede escogerse apropiadamente en el rango desde 0°C al punto de ebullición del solvente inerte usado.

Aunque el tiempo de la reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, la reacción, la temperatura, etc., el tiempo varía desde varios minutos a 48 horas.

Después de la realización de la reacción la mezcla de reacción que contiene el compuesto deseado se trata de la misma manera como en el Procedimiento de producción 1, con lo cual que puede producirse el compuesto deseado.

Los ejemplos típicos de los compuestos de la fórmula general (II) producido por el procedimiento de producción 1 y

2 se intican en Tabla 1 pero no se pretende de forma alguna que los mismos limiten el alcance de la presente invención. En las Tablas 1, 3 a 4, "Ph" significa grupo fenilo y "Pyr" significa grupo piridilo.

Fórmula general (II)

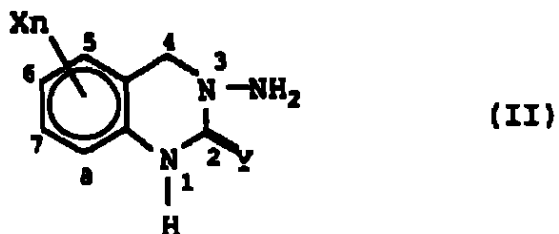


Tabla 1

No.	Xn	Y	Propiedad física
II-1	5-OH	O	Cristalino
II-2	6-OH	O	Cristalino
II-3	7-OH	O	Cristalino
II-4	8-OH	O	Cristalino
II-5	5-Br	O	Cristalino
II-6	6-Br	O	
II-7	7-Br	O	
II-8	8-Br	O	
II-9	5-I	O	p.f. 202,3-205,0 °C
II-10	6-I	O	
II-11	7-I	O	
II-12	8-I	O	
II-13	5-CF ₃	O	p.f. 155-157,7 °C
II-14	6-CF ₃	O	
II-15	7-CF ₃	O	
II-16	8-CF ₃	O	
II-17	5-C ₂ F ₅	O	p.f. 178,4-183,5 °C
II-18	6-C ₂ F ₅	O	
II-19	7-C ₂ F ₅	O	
II-20	8-C ₂ F ₅	O	
II-21	5-i-C ₃ F ₇	O	p.f. 147,6-149,5 °C
II-22	6-i-C ₃ F ₇	O	
II-23	7-i-C ₃ F ₇	O	
II-24	8-i-C ₃ F ₇	O	

Tabla 1 (Continuación)

No.	Xn	Y	Propiedad física
II-25	5-n-C ₆ F ₁₁	0	Cristalino
II-26	6-n-C ₆ F ₁₁	0	
II-27	7-n-C ₆ F ₁₁	0	
II-28	8-n-C ₆ F ₁₁	0	
II-29	5-OCF ₃	0	p.f. 181,5-184,0 °C
II-30	6-OCF ₃	0	
II-31	7-OCF ₃	0	
II-32	8-OCF ₃	0	
II-33	5-OCH ₃ -Ph	0	Cristalino
II-34	6-OCH ₃ -Ph	0	
II-35	7-OCH ₃ -Ph	0	
II-36	8-OCH ₃ -Ph	0	
II-37	5-OCHF ₃	0	Cristalino
II-38	6-OCHF ₃	0	
II-39	7-OCHF ₃	0	
II-40	8-OCHF ₃	0	
II-41	5-SCF ₃	0	
II-42	6-SCF ₃	0	
II-43	7-SCF ₃	0	
II-44	8-SCF ₃	0	
II-45	5-SC ₂ F ₅	0	
II-46	6-SC ₂ F ₅	0	
II-47	7-SC ₂ F ₅	0	
II-48	8-SC ₂ F ₅	0	

Tabla 1 (Continuación)

No.	Xn	Y	Propiedad física
II-49	5-S-i-C ₃ F ₇	O	p.f. 71,2-73,5 °C
II-50	6-S-i-C ₃ F ₇	O	
II-51	7-S-i-C ₃ F ₇	O	
II-52	8-S-i-C ₃ F ₇	O	
II-53	5-SOCF ₃	O	
II-54	6-SOCF ₃	O	
II-55	7-SOCF ₃	O	
II-56	8-SOCF ₃	O	
II-57	5-SO ₂ CF ₃	O	
II-58	6-SO ₂ CF ₃	O	
II-59	7-SO ₂ CF ₃	O	
II-60	8-SO ₂ CF ₃	O	
II-61	5-SOC ₂ F ₅	O	
II-62	6-SOC ₂ F ₅	O	
II-63	7-SOC ₂ F ₅	O	
II-64	8-SOC ₂ F ₅	O	
II-65	5-SO ₂ C ₂ F ₅	O	
II-66	6-SO ₂ C ₂ F ₅	O	
II-67	7-SO ₂ C ₂ F ₅	O	
II-68	8-SO ₂ C ₂ F ₅	O	
II-69	5-SO-i-C ₃ F ₇	O	
II-70	6-SO-i-C ₃ F ₇	O	
II-71	7-SO-i-C ₃ F ₇	O	
II-72	8-SO-i-C ₃ F ₇	O	

31

Tabla 1 (Continuación)

No.	Xn	Y	Propiedad física
II-73	5-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	O	
II-74	6-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	O	
II-75	7-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	O	
II-76	8-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	O	
II-77	5-COOC ₂ H ₅	O	
II-78	6-COOC ₂ H ₅	O	
II-79	7-COOC ₂ H ₅	O	
II-80	8-COOC ₂ H ₅	O	
II-81	5-COOH	O	
II-82	6-COOH	O	
II-83	7-COOH	O	
II-84	8-COOH	O	
II-85	5-Ph	O	
II-86	6-Ph	O	
II-87	7-Ph	O	
II-88	8-Ph	O	
II-89	5-(p-Cl-Ph)	O	
II-90	6-(p-Cl-Ph)	O	
II-91	7-(p-Cl-Ph)	O	
II-92	8-(p-Cl-Ph)	O	
II-93	5-O-Ph	O	
II-94	6-O-Ph	O	
II-95	7-O-Ph	O	
II-96	8-O-Ph	O	

Tabla 1 (Continuación)

No.	Xn	Y	Propiedad física
II-97	5-n-C ₄ H ₉	0	
II-98	6-n-C ₄ H ₉	0	
II-99	7-n-C ₄ H ₉	0	
II-100	8-n-C ₄ H ₉	0	
II-101	5-OCF ₃ CHF ₃	0	
II-102	6-OCF ₃ CHF ₃	0	p.f. 194,8 °C
II-103	7-OCF ₃ CHF ₃	0	
II-104	8-OCF ₃ CHF ₃	0	
II-105	6-OCF ₃ CHFOCF ₃	0	Cristalino
II-106	6-OCH(CF ₃) ₂	0	p.f. 238,8-241,0 °C
II-107	6-O-(m-CF ₃ -Ph)	0	p.f. 204,7-207,9 °C
II-108	6-O-(3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyr)	0	Cristalino

33

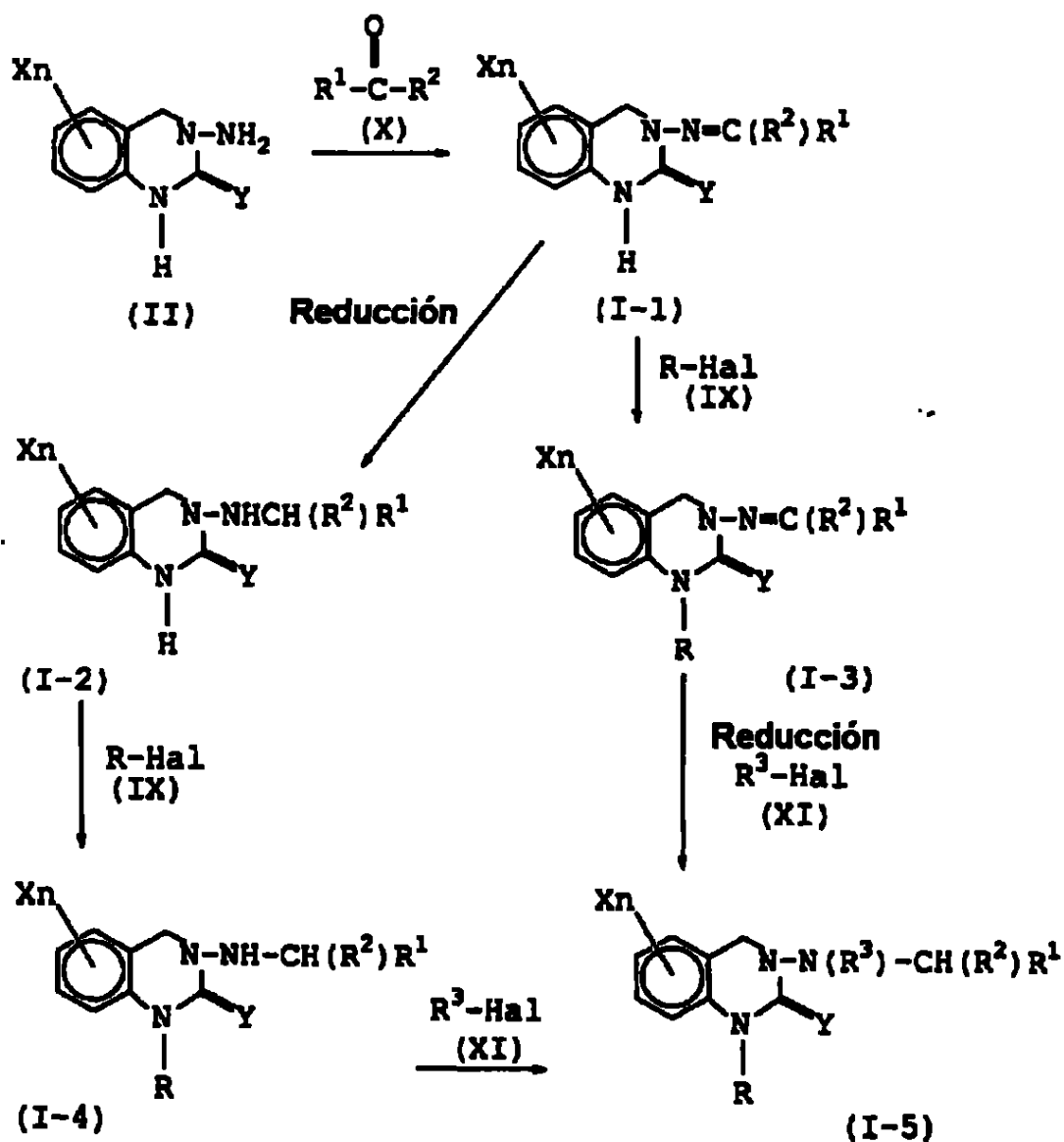
La Tabla 2 ilustra los datos de RMN de los compuestos siguientes enumerados en la Tabla 1.

Tabla 2

No.	¹ H-NMR [DMSO-d ₆ /TMS, δ (ppm)]
II-1	4.36(2H,s), 4.65(2H,br), 6.20(1H,d), 6.34(1H,d), 6.89(1H,t), 9.12(1H,br), 9.62(1H,s).
II-2	4.45(2H,s), 4.65(2H,s), 6.51-6.63(3H,m), 9.00(1H,s),
II-3	9.60(1H,brs).
II-4	4.48(2H,s), 4.65(2H,s), 6.23-6.35(2H,m), 6.85(1H,d), 9.05(1H,s), 9.63(1H,s)
II-6	4.46(2H,s), 4.65(2H,s), 6.57(1H,d), 6.64-6.74(2H,m), 7.95(1H,d), 9.60(1H,brs).
II-18	4.48(2H,s), 4.66(2H,s), 6.74(1H,m), 7.18(1H,m), 7.30(1H,m), 9.43(1H,s).
II-26	4.56(2H,s), 4.70(2H,s), 6.95(1H,d), 7.40-7.50(2H,m), 9.83(1H,s).
II-33	4.56(2H,s), 4.70(2H,s), 6.94(1H,d), 7.43-7.48(2H,m), 9.74(1H,s).
II-36	4.48(2H,s), 4.69(2H,s), 5.00(2H,s), 6.30(1H,d), 6.45(1H,d), 7.05(1H,t), 7.25-7.40(6H,m).
II-38	4.48(2H,s), 4.68(2H,s), 5.19(2H,s), 6.71(1H,d), 6.82(1H,t), 6.92(1H,d), 7.30-7.40(3H,m), 7.51(2H,d), 8.18(1H,s).
II-105	4.48(2H,s), 4.65(2H,s), 6.76-6.79(1H,d,J=8.7Hz), 6.95-7.00(2H,m), 6.80-7.30(1H,t,J=7.46), 9.37(1H,s).
II-108	4.88(2H,s), 4.64(2H,s), 6.79(1H,d,J=11.6Hz), 7.00(1H,s), 7.06(1H,m), 7.23(1H,t,J=4Hz), 9.43(1H,s).
	4.46(2H,s), 4.65(2H,s), 6.80(1H,d,J=11.2Hz), 7.01(2H,m), 8.48(1H,s), 8.52(1H,s), 9.38(1H,s).

Los ejemplos típicos de los procedimientos de producción de los derivados (tiona) aminoquinazolinona de la fórmula general (I) o una sal del mismo de la presente invención se ilustran esquemáticamente a continuación.

Procedimiento de producción 3



en donde R, R¹, R², R³, X, n, Y y Hal son iguales a los definidos

precedentemente con la excepción de cada uno de R y R' no sea un átomo de hidrógeno.

3-1. Fórmula general (II) $\rightarrow$ fórmula general (I-1)

Un derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-1) puede ser producido haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula general (II) con un compuesto de la fórmula general (X) en la presencia de un solvente inerte y un catalizador.

En el caso de utilizar esta reacción, puede producirse el compuesto deseado de una manera similar a la descrita en el procedimiento de producción 2-1.

3-2. Fórmula general (I-1) $\rightarrow$ fórmula general (I-3)

Un derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-3) puede ser producido haciendo reaccionar el derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-1) con un compuesto de la fórmula general (IX) en la presencia o ausencia de un solvente inerte y una base.

Como solvente inerte utilizable en esta reacción, pueden utilizarse, por ejemplo, los solventes inertes ejemplificados en el procedimiento de producción 1.

Como la base, puede usarse una base inorgánica o una base orgánica. Además de las bases inorgánicas u orgánicas ejemplificadas en el procedimiento de producción 2-3, también pueden usarse alcóxidos tales como CH_3ONa , $\text{C}_2\text{H}_5\text{ONa}$, $t\text{-C}_4\text{H}_9\text{ONa}$, CH_3OK , $\text{C}_2\text{H}_5\text{OK}$, $t\text{-C}_4\text{H}_9\text{OK}$, etc., e hidruros de metal alcalino tales

como NaH, etc. La cantidad de base usada puede elegirse apropiadamente en el rango de 1 mol hasta el exceso de moles por mol del derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-1).

La temperatura de la reacción puede elegirse en el rango desde 0°C hasta el punto de ebullición del solvente inerte usado, y preferentemente varía desde la temperatura ambiente hasta 70°C.

Aunque el tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción, la temperatura de la reacción, etc., el tiempo varía de varios minutos a 48 horas.

La mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado se trata de la misma manera como en procedimiento de producción 1 después de la realización de la reacción, con lo cual puede producirse el compuesto deseado.

3-3. Fórmula general (I-1) → Fórmula general (I-2)

En el caso de esta reacción, puede producirse el compuesto deseado de una manera similar a la descrita en el procedimiento de producción 2-2.

3-4. Fórmula general (I-2) → Fórmula general (I-4)

Un derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-4) puede ser producido haciendo reaccionar el derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-2) con el compuesto de la fórmula (IX) en presencia o ausencia de un solvente inerte y una base.

En el caso de esta reacción, puede producirse el compuesto deseado de una manera similar a eso descrito en procedimiento de producción 3-2.

3-5. Fórmula general (I-4) → Fórmula general (I-5)

Un derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-5) puede ser producido haciendo reaccionar el derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula general (I-4) con un compuesto de la fórmula general (XI) en la presencia o ausencia de un solvente inerte y una base.

En caso de esta reacción, puede producirse el compuesto deseado de una manera similar a la descrita en el procedimiento de producción 3-2.

3-6. Fórmula general (I-3) → Fórmula general (I-5)

En caso de esta reacción, puede producirse el compuesto deseado de una manera similar la descrita en el procedimiento de producción 2-2.

Los ejemplos típicos del derivado aminoquinazolinona (tiona) de la fórmula (I) o sal del mismo de la presente invención se indican en las Tablas 3 y 4 con las cuales no se pretende de forma alguna limitar el alcance de la presente invención.

Las abreviaturas en Tabla 3 y Tabla 4 se indican para los sustituyentes siguientes:

c : grupo hidrocarburo alicíclico

Ph : grupo fenilo,

- Q₁ : grupo 2-piridilo,
- Q₂ : grupo 3-piridilo,
- Q₃ : grupo 4-piridilo,
- Q₄ : grupo 2-piridil-N-óxido,
- Q₅ : grupo 3-piridil-N-óxido,
- Q₆ : grupo 4-piridil-N-óxido,
- Q₇ : grupo tiazol-5-ilo,
- Q₈ : grupo furan-2-ilo,
- Q₉ : grupo 1,3-dioxolan-2-ilo,
- Q₁₀ : grupo ftalimid-1-ilo,
- Q₁₁ : grupo tiofen-2-ilo,
- Q₁₂ : grupo 5-cloro-1,3-dimetilpirazol-4-ilo.

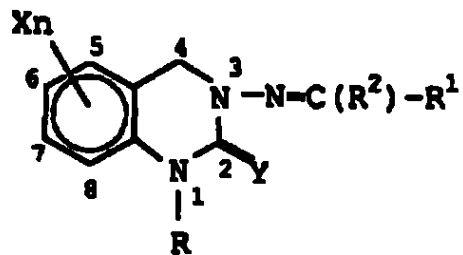


Tabla 3 ($R^1=Q_2$, $R^2=H$, $Y=O$, excepto para el grupo indicado especialmente)

No.	R	Xn	Propiedad física
1	H	5-OH	p.f. 293-295 °C
2	H	6-OH	
3	H	7-OH	
4	H	8-OH	
5	H	5-Br	p.f. >300°C
6	H	6-Br	
7	H	7-Br	
8	H	8-Br	
9	H	5-I	p.f. >300°C
10	H	6-I	
11	H	7-I	
12	H	8-I	
13	H	5-CF ₃	p.f. 227,6-286,7 °C
14	H	6-CF ₃	
15	H	7-CF ₃	
16	H	8-CF ₃	
17	H	5-C ₂ F ₅	p.f. 298-300 °C
18	H	6-C ₂ F ₅	
19	H	7-C ₂ F ₅	
20	H	8-C ₂ F ₅	
21	H	5-1-C ₃ F ₇	p.f. >300°C
22	H	6-1-C ₃ F ₇	
23	H	7-1-C ₃ F ₇	
24	H	8-1-C ₃ F ₇	

40

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
25	H	5-n-C ₆ F ₁₁	p.f. >300°C
26	H	6-n-C ₆ F ₁₁	
27	H	7-n-C ₆ F ₁₁	
28	H	8-n-C ₆ F ₁₁	
29	H	5-OCF ₃	p.f. 264,0-266,0 °C
30	H	6-OCF ₃	
31	H	7-OCF ₃	
32	H	8-OCF ₃	
33	H	5-CH ₂ -Ph	p.f. 260,1-264,5 °C
34	H	6-CH ₂ -Ph	
35	H	7-CH ₂ -Ph	
36	H	8-CH ₂ -Ph	
37	H	5-OCHF ₂	
38	H	6-OCHF ₂	
39	H	7-OCHF ₂	
40	H	8-OCHF ₂	
41	H	5-SCF ₃	
42	H	6-SCF ₃	
43	H	7-SCF ₃	
44	H	8-SCF ₃	
45	H	5-SC ₂ F ₅	
46	H	6-SC ₂ F ₅	
47	H	7-SC ₂ F ₅	
48	H	8-SC ₂ F ₅	

41

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
49	H	5-S-1-C ₂ F ₇	p.f. 252,4-255,0 °C
50	H	6-S-1-C ₂ F ₇	
51	H	7-S-1-C ₂ F ₇	
52	H	8-S-1-C ₂ F ₇	
53	H	5-SOCF ₃	
54	H	6-SOCF ₃	
55	H	7-SOCF ₃	
56	H	8-SOCF ₃	
57	H	5-SO ₂ CF ₃	
58	H	6-SO ₂ CF ₃	
59	H	7-SO ₂ CF ₃	
60	H	8-SO ₂ CF ₃	
61	H	5-SOC ₂ F ₆	
62	H	6-SOC ₂ F ₆	
63	H	7-SOC ₂ F ₆	
64	H	8-SOC ₂ F ₆	
65	H	5-SO ₂ C ₂ F ₆	
66	H	6-SO ₂ C ₂ F ₆	
67	H	7-SO ₂ C ₂ F ₆	
68	H	8-SO ₂ C ₂ F ₆	
69	H	5-SO-1-C ₂ F ₇	
70	H	6-SO-1-C ₂ F ₇	
71	H	7-SO-1-C ₂ F ₇	
72	H	8-SO-1-C ₂ F ₇	

42

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
73	H	5-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	p.f. 274-278 °C
74	H	6-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
75	H	7-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
76	H	8-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
77	H	5-COOC ₂ H ₅	
78	H	6-COOC ₂ H ₅	
79	H	7-COOC ₂ H ₅	
80	H	8-COOC ₂ H ₅	
81	H	5-COOH	
82	H	6-COOH	
83	H	7-COOH	
84	H	8-COOH	
85	H	5-Ph	p.f. 250,9-253,8 °C
86	H	6-Ph	
87	H	7-Ph	
88	H	8-Ph	
89	H	5-(4-Cl-Ph)	p.f. 276-278 °C
90	H	6-(4-Cl-Ph)	
91	H	7-(4-Cl-Ph)	
92	H	8-(4-Cl-Ph)	
93	H	5-O-Ph	
94	H	6-O-Ph	
95	H	7-O-Ph	
96	H	8-O-Ph	

43

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
97	H	5-n-C ₄ H ₉	p.f. 181,4-185,3 °C
98	H	6-n-C ₄ H ₉	
99	H	7-n-C ₄ H ₉	
100	H	8-n-C ₄ H ₉	
101	CH ₃	5-I	
102	CH ₃	6-I	
103	CH ₃	7-I	
104	CH ₃	8-I	
105	C ₂ H ₅	5-I	p.f. 191,5-194,5 °C
106	C ₂ H ₅	6-I	
107	C ₂ H ₅	7-I	
108	C ₂ H ₅	8-I	
109	n-C ₃ H ₇	5-I	nD 1,4126(28,5°C)
110	n-C ₃ H ₇	6-I	
111	n-C ₃ H ₇	7-I	
112	n-C ₃ H ₇	8-I	
113	CH ₂ C≡CH	5-I	p.f. 214-217 °C
114	CH ₂ C≡CH	6-I	
115	CH ₂ C≡CH	7-I	
116	CH ₂ C≡CH	8-I	
117	CH ₂ CH=CH ₂	5-I	p.f. 162-164 °C
118	CH ₂ CH=CH ₂	6-I	
119	CH ₂ CH=CH ₂	7-I	
120	CH ₂ CH=CH ₂	8-I	

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
121	$\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	5-I	p.f. 111,3-161,7 °C
122	$\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	6-I	
123	$\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	7-I	
124	$\text{CH}_2\text{OC}_2\text{H}_5$	8-I	
125	$\text{CH}_2(4\text{-Cl-Ph})$	5-I	p.f. 146-149 °C
126	$\text{CH}_2(4\text{-Cl-Ph})$	6-I	
127	$\text{CH}_2(4\text{-Cl-Ph})$	7-I	
128	$\text{CH}_2(4\text{-Cl-Ph})$	8-I	
129	COCH_3	5-I	p.f. 186-188 °C
130	COCH_3	6-I	
131	COCH_3	7-I	
132	COCH_3	8-I	
133	COC_2H_5	5-I	p.f. 135-139 °C
134	COC_2H_5	6-I	
135	COC_2H_5	7-I	
136	COC_2H_5	8-I	
137	SO_2CH_3	5-I	p.f. 174-181 °C
138	SO_2CH_3	6-I	
139	SO_2CH_3	7-I	
140	SO_2CH_3	8-I	
141	SO_2Ph	5-I	p.f. 199-205 °C
142	SO_2Ph	6-I	
143	SO_2Ph	7-I	
144	SO_2Ph	8-I	

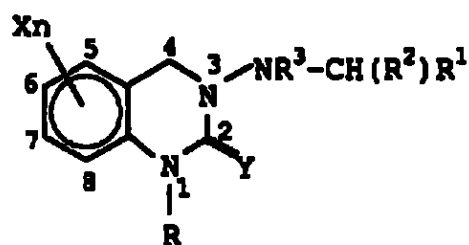
45

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
145	H	5-OCF ₂ CHF ₂	p.f. 251,6-263,3 °C
146	H	6-OCF ₂ CHF ₂	
147	H	7-OCF ₂ CHF ₂	
148	H	8-OCF ₂ CHF ₂	
149	CO-c-C ₂ H ₅	5-I	p.f. 172-175 °C
150	CO-c-C ₂ H ₅	6-I	
151	CO-c-C ₂ H ₅	7-I	
152	CO-c-C ₂ H ₅	8-I	
153	H	5-(4-CH ₃ O-Ph)	p.f. 242 °C
154	H	6-(4-CH ₃ O-Ph)	
155	H	7-(4-CH ₃ O-Ph)	
156	H	8-(4-CH ₃ O-Ph)	
157	H	5-(3-CH ₃ O-Ph)	p.f. 192-199 °C
158	H	6-(3-CH ₃ O-Ph)	
159	H	7-(3-CH ₃ O-Ph)	
160	H	8-(3-CH ₃ O-Ph)	
161	H	5-(3-NO ₂ -Ph)	p.f. >300°C
162	H	6-(3-NO ₂ -Ph)	
163	H	7-(3-NO ₂ -Ph)	
164	H	8-(3-NO ₂ -Ph)	
165	H	5-COOH	p.f. >300°C
166	H	6-COOH	
167	H	7-COOH	
168	H	8-COOH	

Tabla 3 (Continuación)

No.	R	Xn	Propiedad física
169	H	5-COOCH ₃	p.f. 270,5-279,6°C
170	H	6-COOCH ₃	
171	H	7-COOCH ₃	
172	H	8-COOCH ₃	
173	H	5-CON(C ₂ H ₅) ₂	p.f. 254,9-278,1°C
174	H	6-CON(C ₂ H ₅) ₂	
175	H	7-CON(C ₂ H ₅) ₂	
176	H	8-CON(C ₂ H ₅) ₂	
177	H	6-Cl-7-CF ₃ H	p.f. 295°C
178	H	6-C ₃ F ₇ -1	p.f. 227,1-227,3°C
(Q ₂ : sal ioduro de N-metilpiridinio)			
178.1	H	6-OCF ₂ CHFOCF ₃	p.f. 240,2-241,3°C
178.2	H	6-O-(3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyr)	p.f. 284,7-288,5°C
178.3	H	6-O-(3-CF ₃ -Ph)	p.f. 239,1-240,9°C
178.4	H	6-O-CH(CF ₃) ₂	p.f. >300°C
178.5	H	6-F	p.f. 232,2-236,3°C
			R ¹ =Q ₁₂
178.6	COOCH ₃	6-C ₃ F ₇ -1	p.f. 160-165°C



47

Tabla 4 ($R^2=H$, $Y=O$ y $R^3=H$, a excepción del grupo indicado especialmente)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
179	H	Q ₂	5-OH	p.f. 223-225 °C p.f. 258-259 °C p.f. 177-180 °C p.f. >300°C
180	H	Q ₂	6-OH	
181	H	Q ₂	7-OH	
182	H	Q ₂	8-OH	
183	H	Q ₂	5-Br	
184	H	Q ₂	6-Br	
185	H	Q ₂	7-Br	
186	H	Q ₂	8-Br	
187	H	Q ₂	5-I	
188	H	Q ₂	6-I	
189	H	Q ₂	7-I	p.f. 191,0-193,1 °C
190	H	Q ₂	8-I	
191	H	Q ₂	5-CF ₃	
192	H	Q ₂	6-CF ₃	
193	H	Q ₂	7-CF ₃	
194	H	Q ₂	8-CF ₃	
195	H	Q ₂	5-C ₂ F ₅	
196	H	Q ₂	6-C ₂ F ₅	
197	H	Q ₂	7-C ₂ F ₅	
198	H	Q ₂	8-C ₂ F ₅	
199	H	Q ₂	5-1-C ₃ F ₇	p.f. 159,4-161,0 °C
200	H	Q ₂	6-1-C ₃ F ₇	
201	H	Q ₂	7-1-C ₃ F ₇	
202	H	Q ₂	8-1-C ₃ F ₇	

48

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
203	H	Q ₂	5-n-C ₈ F ₁₂	p.f. 153,9-164,7 °C
204	H	Q ₂	6-n-C ₈ F ₁₂	
205	H	Q ₂	7-n-C ₈ F ₁₂	
206	H	Q ₂	8-n-C ₈ F ₁₂	
207	H	Q ₂	5-OCF ₃	nD 1,5233 (22,6°C)
208	H	Q ₂	6-OCF ₃	
209	H	Q ₂	7-OCF ₃	
210	H	Q ₂	8-OCF ₃	
211	H	Q ₂	5-CH ₂ -Ph	p.f. 129,7-130,2 °C
212	H	Q ₂	6-CH ₂ -Ph	
213	H	Q ₂	7-CH ₂ -Ph	
214	H	Q ₂	8-CH ₂ -Ph	
215	H	Q ₂	5-OCHF ₃	
216	H	Q ₂	6-OCHF ₃	
217	H	Q ₂	7-OCHF ₃	
218	H	Q ₂	8-OCHF ₃	
219	H	Q ₂	5-SCF ₃	
220	H	Q ₂	6-SCF ₃	
221	H	Q ₂	7-SCF ₃	
222	H	Q ₂	8-SCF ₃	
223	H	Q ₂	5-SC ₂ F ₅	
224	H	Q ₂	6-SC ₂ F ₅	
225	H	Q ₂	7-SC ₂ F ₅	
226	H	Q ₂	8-SC ₂ F ₅	

46

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
227	H	Q ₂	5-S-i-C ₂ F ₇	p.f. 50,3-53,1 °C
228	H	Q ₂	6-S-i-C ₂ F ₇	
229	H	Q ₂	7-S-i-C ₂ F ₇	
230	H	Q ₂	8-S-i-C ₂ F ₇	
231	H	Q ₂	5-SOCF ₃	
232	H	Q ₂	6-SOCF ₃	
233	H	Q ₂	7-SOCF ₃	
234	H	Q ₂	8-SOCF ₃	
235	H	Q ₂	5-SO ₂ CF ₃	
236	H	Q ₂	6-SO ₂ CF ₃	
237	H	Q ₂	7-SO ₂ CF ₃	
238	H	Q ₂	8-SO ₂ CF ₃	
239	H	Q ₂	5-SOC ₂ F ₆	
240	H	Q ₂	6-SOC ₂ F ₆	
241	H	Q ₂	7-SOC ₂ F ₆	
242	H	Q ₂	8-SOC ₂ F ₆	
243	H	Q ₂	5-SO ₂ C ₂ F ₆	
244	H	Q ₂	6-SO ₂ C ₂ F ₆	
245	H	Q ₂	7-SO ₂ C ₂ F ₆	
246	H	Q ₂	8-SO ₂ C ₂ F ₆	
247	H	Q ₂	5-SO-i-C ₂ F ₇	
248	H	Q ₂	6-SO-i-C ₂ F ₇	
249	H	Q ₂	7-SO-i-C ₂ F ₇	
250	H	Q ₂	8-SO-i-C ₂ F ₇	

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
251	H	Q ₂	5-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
252	H	Q ₂	6-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
253	H	Q ₂	7-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
254	H	Q ₂	8-SO ₂ -1-C ₂ F ₇	
255	H	Q ₂	5-COOC ₂ H ₅	
256	H	Q ₂	6-COOC ₂ H ₅	
257	H	Q ₂	7-COOC ₂ H ₅	
258	H	Q ₂	8-COOC ₂ H ₅	
259	H	Q ₂	5-COOH	
260	H	Q ₂	6-COOH	
261	H	Q ₂	7-COOH	
262	H	Q ₂	8-COOH	
263	H	Q ₂	5-Ph	
264	H	Q ₂	6-Ph	
265	H	Q ₂	7-Ph	
266	H	Q ₂	8-Ph	
267	H	Q ₂	5-(4-Cl-Ph)	
268	H	Q ₂	6-(4-Cl-Ph)	
269	H	Q ₂	7-(4-Cl-Ph)	
270	H	Q ₂	8-(4-Cl-Ph)	
271	H	Q ₂	5-O-Ph	
272	H	Q ₂	6-O-Ph	
273	H	Q ₂	7-O-Ph	
274	H	Q ₂	8-O-Ph	

51

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
275	H	Q ₂	5-n-C ₄ H ₉	p.f. 168,7-173,9 °C
276	H	Q ₂	6-n-C ₄ H ₉	
277	H	Q ₂	7-n-C ₄ H ₉	
278	H	Q ₂	8-n-C ₄ H ₉	
279	H	Q ₂	5-OCF ₃ CHF ₃	
280	H	Q ₂	6-OCF ₃ CHF ₃	
281	H	Q ₂	7-OCF ₃ CHF ₃	
282	H	Q ₂	8-OCF ₃ CHF ₃	
283	H	Q ₂	5-CF(CF ₃) ₂	p.f. 239,7-243,5°C
284	H	Q ₂	6-CF(CF ₃) ₂	
285	H	Q ₂	7-CF(CF ₃) ₂	
286	H	Q ₂	8-CF(CF ₃) ₂	
287	H	Q ₂	6-CF(CF ₃) ₂	p.f. 209,9-213,4°C (R ³ =COCF ₃)
288	CH ₃	Q ₂	5-OCF ₃	nD 1,5467(23,6°C)
289	CH ₃	Q ₂	6-OCF ₃	
290	CH ₃	Q ₂	7-OCF ₃	
291	CH ₃	Q ₂	8-OCF ₃	
292	C ₂ H ₅	Q ₂	5-OCF ₃	nD 1,5360(24,3°C)
293	C ₂ H ₅	Q ₂	6-OCF ₃	
294	C ₂ H ₅	Q ₂	7-OCF ₃	
295	C ₂ H ₅	Q ₂	8-OCF ₃	
296	COCH ₃	Q ₂	5-OCF ₃	nD 1,5478(24,1°C)
297	COCH ₃	Q ₂	6-OCF ₃	

12
52

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
298	COCH ₃	Q ₁	7-OCF ₃	nD 1,5174 (25,9°C)
299	COCH ₃	Q ₂	8-OCF ₃	
300	COC ₂ H ₅	Q ₃	5-OCF ₃	
301	COC ₂ H ₅	Q ₄	6-OCF ₃	
302	COC ₂ H ₅	Q ₅	7-OCF ₃	
303	COC ₂ H ₅	Q ₆	8-OCF ₃	
304	CH ₂ CH=CH ₂	Q ₁	5-OCF ₃	p.f. 92,5°C
305	CH ₂ CH=CH ₂	Q ₂	6-OCF ₃	
306	CH ₂ CH=CH ₂	Q ₃	7-OCF ₃	
307	CH ₂ CH=CH ₂	Q ₄	8-OCF ₃	
308	CH ₂ C≡CH	Q ₁	5-OCF ₃	nD 1,5325 (24,2°C)
309	CH ₂ C≡CH	Q ₂	6-OCF ₃	
310	CH ₂ C≡CH	Q ₃	7-OCF ₃	
311	CH ₂ C≡CH	Q ₄	8-OCF ₃	
312	CH(CH ₃) ₂	Q ₁	5-OCF ₃	nD 1,5370 (24,8°C)
313	CH(CH ₃) ₂	Q ₂	6-OCF ₃	
314	CH(CH ₃) ₂	Q ₃	7-OCF ₃	
315	CH(CH ₃) ₂	Q ₄	8-OCF ₃	
316	H	Q ₁	6-OCF ₃	nD 1,5380 (26,0°C) (R ³ =COC ₂ H ₅)
317	CH ₂ C≡CH	Q ₅	5-Br	nD 1,5760 (26,2°C)
318	CH ₂ C≡CH	Q ₆	6-Br	
319	CH ₂ C≡CH	Q ₇	7-Br	
320	CH ₂ C≡CH	Q ₈	8-Br	

53

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
321	CH ₂ SCH ₃	Q ₂	5-Br	nD 1,6030 (27,0°C)
322	CH ₂ SCH ₃	Q ₂	6-Br	
323	CH ₂ SCH ₃	Q ₂	7-Br	
324	CH ₂ SCH ₃	Q ₂	8-Br	
325	C ₂ H ₅	Q ₂	5-Br	nD 1,5974 (26,9°C)
326	C ₂ H ₅	Q ₂	6-Br	
327	C ₂ H ₅	Q ₂	7-Br	
328	C ₂ H ₅	Q ₂	8-Br	
329	1-C ₃ H ₇	Q ₂	5-Br	nD 1,4680 (28,0°C)
330	1-C ₃ H ₇	Q ₂	6-Br	
331	1-C ₃ H ₇	Q ₂	7-Br	
332	1-C ₃ H ₇	Q ₂	8-Br	
333	COCH ₃	Q ₂	5-Br	nD 1,5930 (27,2°C)
334	COCH ₃	Q ₂	6-Br	
335	COCH ₃	Q ₂	7-Br	
336	COCH ₃	Q ₂	8-Br	
337	COC ₂ H ₅	Q ₂	5-Br	nD 1,5861 (26,8°C)
338	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-Br	
339	COC ₂ H ₅	Q ₂	7-Br	
340	COC ₂ H ₅	Q ₂	8-Br	
341	CH ₂ -(4-Cl-Ph)	Q ₂	5-Br	nD 1,5885 (27,3°C)
342	CH ₂ -(4-Cl-Ph)	Q ₂	6-Br	
343	CH ₂ -(4-Cl-Ph)	Q ₂	7-Br	
344	CH ₂ -(4-Cl-Ph)	Q ₂	8-Br	

54

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
345	CO-Ph	Q ₂	5-Br	p.f. >300°C
346	CO-Ph	Q ₂	6-Br	
347	CO-Ph	Q ₂	7-Br	
348	CO-Ph	Q ₂	8-Br	
349	CH ₂	Q ₂	5-OCHF ₃	nD 1,5613 (27,9°C)
350	CH ₂	Q ₂	6-OCHF ₃	
351	CH ₂	Q ₂	7-OCHF ₃	
352	CH ₂	Q ₂	8-OCHF ₃	
353	C ₂ H ₅	Q ₂	5-OCHF ₃	nD 1,5354 (26,4°C)
354	C ₂ H ₅	Q ₂	6-OCHF ₃	
355	C ₂ H ₅	Q ₂	7-OCHF ₃	
356	C ₂ H ₅	Q ₂	8-OCHF ₃	
357	n-C ₃ H ₇	Q ₂	5-OCHF ₃	nD 1,5590 (25,8°C)
358	n-C ₃ H ₇	Q ₂	6-OCHF ₃	
359	n-C ₃ H ₇	Q ₂	7-OCHF ₃	
360	n-C ₃ H ₇	Q ₂	8-OCHF ₃	
361	CH ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	Q ₂	5-OCHF ₃	nD 1,5917 (27,9°C)
362	CH ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	Q ₂	6-OCHF ₃	
363	CH ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	Q ₂	7-OCHF ₃	
364	CH ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	Q ₂	8-OCHF ₃	
365	i-C ₄ H ₉	Q ₂	5-OCHF ₃	nD 1,5557 (26,4°C)
366	i-C ₄ H ₉	Q ₂	6-OCHF ₃	
367	i-C ₄ H ₉	Q ₂	7-OCHF ₃	
368	i-C ₄ H ₉	Q ₂	8-OCHF ₃	

55

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
369	CH ₂ -(4-CH ₂ O-Ph)	Q ₂	5-OCHF ₂	nD 1,5668 (26,5°C)
370	CH ₂ -(4-CH ₂ O-Ph)	Q ₂	6-OCHF ₂	
371	CH ₂ -(4-CH ₂ O-Ph)	Q ₂	7-OCHF ₂	
372	CH ₂ -(4-CH ₂ O-Ph)	Q ₂	8-OCHF ₂	
373	COCH ₃	Q ₂	5-OCHF ₂	nD 1,5503 (26,1°C)
374	COCH ₃	Q ₂	6-OCHF ₂	
375	COCH ₃	Q ₂	7-OCHF ₂	
376	COCH ₃	Q ₂	8-OCHF ₂	
377	COC ₂ H ₅	Q ₂	5-OCHF ₂	nD 1,5470 (26,2°C)
378	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-OCHF ₂	
379	COC ₂ H ₅	Q ₂	7-OCHF ₂	
380	COC ₂ H ₅	Q ₂	8-OCHF ₂	
381	CO-1-C ₂ H ₅	Q ₂	5-OCHF ₂	nD 1,5196 (28,3°C)
382	CO-1-C ₂ H ₅	Q ₂	6-OCHF ₂	
383	CO-1-C ₂ H ₅	Q ₂	7-OCHF ₂	
384	CO-1-C ₂ H ₅	Q ₂	8-OCHF ₂	
385	CO-Q ₁₁	Q ₂	5-OCHF ₂	: p.f. 148-155 °C
386	CO-Q ₁₁	Q ₂	6-OCHF ₂	
387	CO-Q ₁₁	Q ₂	7-OCHF ₂	
388	CO-Q ₁₁	Q ₂	8-OCHF ₂	
389	CH ₃	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5320 (26,2°C)
390	CH ₃	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
391	CH ₃	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
392	CH ₃	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R ¹	X _n	Propiedad física
393	C ₂ H ₅	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5239 (26,7°C)
394	C ₂ H ₅	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
395	C ₂ H ₅	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
396	C ₂ H ₅	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
397	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5309 (26,0°C)
398	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
399	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
400	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
401	CH ₂ OCH ₂ -Ph	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5486 (26,2°C)
402	CH ₂ OCH ₂ -Ph	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
403	CH ₂ OCH ₂ -Ph	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
404	CH ₂ OCH ₂ -Ph	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
405	COOC ₄ H ₉ -t	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5103 (26,2°C)
406	COOC ₄ H ₉ -t	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
407	COOC ₄ H ₉ -t	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
408	COOC ₄ H ₉ -t	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
409	COCH ₃	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5262 (25,8°C)
410	COCH ₃	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
411	COCH ₃	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
412	COCH ₃	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
413	COC ₂ H ₅	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5266 (25,9°C)
414	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
415	COC ₂ H ₅	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
416	COC ₂ H ₅	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	

57

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R ¹	Xn	Propiedad física
417	CH ₂ OCH ₃	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5311 (23,9°C)
418	CH ₂ OCH ₃	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
419	CH ₂ OCH ₃	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
420	CH ₂ OCH ₃	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
421	CH ₂ -Q ₂	Q ₂	5-OCF ₂ CHF ₂	nD 1,5560 (26,8°C)
422	CH ₂ -Q ₂	Q ₂	6-OCF ₂ CHF ₂	
423	CH ₂ -Q ₂	Q ₂	7-OCF ₂ CHF ₂	
424	CH ₂ -Q ₂	Q ₂	8-OCF ₂ CHF ₂	
425	SO ₂ CH ₃	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	: p.f. 154-156 °C
426	SO ₂ CH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
427	SO ₂ CH ₃	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
428	SO ₂ CH ₃	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
429	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	p.f. 45-50 °C
430	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
431	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
432	SO ₂ C ₂ H ₅	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
433	SO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	p.f. 65-75 °C
434	SO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
435	SO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
436	SO ₂ (4-CH ₃ -Ph)	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	p.f. 186-212 °C (hidrocloruro)
437	H	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
438	H	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	p.f. 168-208,8 °C (sulfato)

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R ¹	Xn	Propiedad física
439	CO-Ph	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	p.f. 161-165 °C
440	CO-Ph	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
441	CO-Ph	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
442	CO-Ph	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
443	COC ₂ H ₇ -1	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	nD 1,5051 (22,1 °C)
444	COC ₂ H ₇ -1	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
445	COC ₂ H ₇ -1	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
446	COC ₂ H ₇ -1	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
447	COCH ₃	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	p.f. 132-134 °C
448	COCH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
449	COCH ₃	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
450	COCH ₃	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
451	COC ₂ H ₆	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	p.f. 108 °C
452	COC ₂ H ₆	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
453	COC ₂ H ₆	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
454	COC ₂ H ₆	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
455	COC ₂ H ₇ -n	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	nD 1,510 (22,2 °C)
456	COC ₂ H ₇ -n	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
457	COC ₂ H ₇ -n	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
458	COC ₂ H ₇ -n	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	
459	CH ₃	Q ₂	5-C ₂ F ₇ -1	p.f. 67-75 °C
460	CH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -1	
461	CH ₃	Q ₂	7-C ₂ F ₇ -1	
462	CH ₃	Q ₂	8-C ₂ F ₇ -1	

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
463	C ₂ H ₅	Q ₂	5-C ₂ F ₅ -1	p.f. 98-102,4 °C
464	C ₂ H ₅	Q ₂	6-C ₂ F ₅ -1	
465	C ₂ H ₅	Q ₂	7-C ₂ F ₅ -1	
466	C ₂ H ₅	Q ₂	8-C ₂ F ₅ -1	
467	COC ₂ H ₅	Q ₂	5-F	nD 1,5660 (22,8 °C)
468	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-F	
469	COC ₂ H ₅	Q ₂	7-F	
470	COC ₂ H ₅	Q ₂	8-F	
471	H	Q ₂	5-COOC ₂ H ₅	p.f. 168,7-171,9 °C
472	H	Q ₂	6-COOC ₂ H ₅	
473	H	Q ₂	7-COOC ₂ H ₅	
474	H	Q ₂	8-COOC ₂ H ₅	
475	COC ₂ H ₅	Q ₂	5-CF ₃	nD 1,5400 (21,1 °C)
476	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-CF ₃	
477	COC ₂ H ₅	Q ₂	7-CF ₃	
478	COC ₂ H ₅	Q ₂	8-CF ₃	
479	H	Q ₂	5-C ₂ F ₅	p.f. 139-146 °C
480	H	Q ₂	6-C ₂ F ₅	
481	H	Q ₂	7-C ₂ F ₅	
482	H	Q ₂	8-C ₂ F ₅	
483	H	Q ₂	6-Cl-7-OCHF ₃	p.f. 198-201 °C
484	CH ₂ C≡CH	Q ₂	6-C ₂ F ₅ -1	p.f. 96,1-101,3 °C
485	CH ₂ OCH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₅ -1	nD 1,5163 (23,3 °C)
486	CH ₂ SCH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₅ -1	nD 1,5211 (23,3 °C)

Tabla 4 (Continuación)

No	R	R'	Xn	Propiedad física
487	CH ₂ CN	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	p.f. 109-113,1 °C
488	CH ₂ (3-Cl-Ph)	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	nD 1,5329 (20,6°C)
489	COCH ₂ Br	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	nD 1,4910 (23,5°C)
490	COCH ₂ OCH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	nD 1,5106 (21,6°C)
491	CO(3-Cl-Ph)	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	p.f. 54-58 °C
492	COOC ₂ H ₅	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	p.f. 140-148,3 °C
493	COOC ₂ H ₅ -t	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	nD 1,5598 (23,4°C)
494	COOCH ₃	Q ₂	6-C ₂ F ₇ -i	p.f. 130-135 °C
495	H	Q ₂	6-OCH(CF ₃) ₂	p.f. 137,5-139,9 °C
496	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-OCH(CF ₃) ₂	nD 1,4932 (23,4°C)
497	H	Q ₂	6-CF ₃ CHFOCF ₃	p.f. 119,8-119,9 °C
498	COCH ₃	Q ₂	6-CF ₃ CHFOCF ₃	nD 1,4977 (21,3°C)
499	COC ₂ H ₅	Q ₂	6-CF ₃ CHFOCF ₃	nD 1,5000 (24,4°C)
500	H	Q ₂	6-O-(3-CF ₃ -Ph)	p.f. 113,8-116,0 °C
501	H	Q ₂	6-O-(3-Cl-5-CF ₃ -2-Pyr)	p.f. 75-81 °C

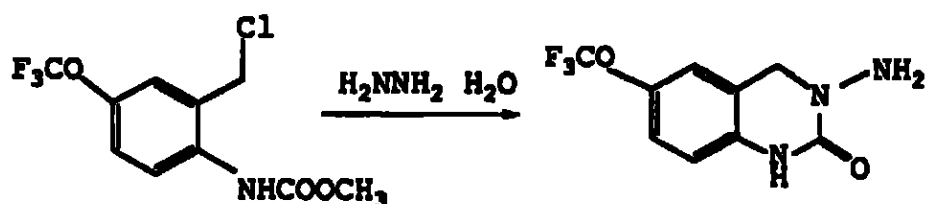
6/11/61

EJEMPLOS

Los ejemplos típicos de la presente invención se describen a continuación, sin embargo el alcance de la presente invención no está restringido por dichos ejemplos.

Ejemplo 1

Preparación de 3-amino-3,4-dihidro-6-trifluorometoxi-2-(1H)-quinazolinona (Compuesto No. II-30)



En 20 ml de metanol se disolvió 2,84 g (0,01 mol) de metil 2-clorometil-4-trifluorometoxifenilcarbamato, luego 5 g (0,1 mol) de hidrato de hidrazina se agregó a la solución, y la reacción fue realizada calentando bajo reflujo durante 3 horas.

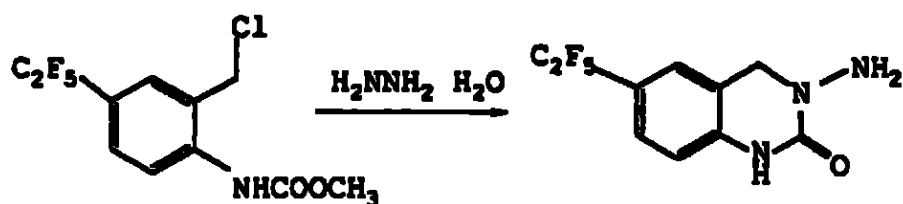
Después de la realización de la reacción, el resto de hidrato de hidrazina y el solvente fueron eliminados de la mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado por destilación bajo presión reducida para obtener un producto crudo. El producto crudo resultante era recristalizado de 95% de metanol para obtener 2,22 g del compuesto deseado.

Propiedad física: p.f. 181,5 - 184°C

Rendimiento 90%.

Ejemplo 2

Preparación de 3-amino-3,4-dihidro-6-pentafluoro-etil-2-(1H)-quinazolinona (compuesto No. II-18)



En 20 ml de metanol se disolvió 3,18 g (0,01 mol) de metilo 2-clorometil-4-pentafluoroetilfenilcarbamato, luego 5 g (0,1 mol) de hidrato de hidrazina se agregó a esta solución y la reacción fue realizada calentando bajo reflujo durante 3 horas.

Después de la realización de la reacción el resto de hidrato de hidrazina y el solvente fueron eliminados de la mezcla de la reacción que contiene el compuesto deseado por destilación bajo presión reducida para obtener un producto crudo. El producto crudo resultante fue recristalizado de 95% metanol para obtener 2,53 g del compuesto deseado.

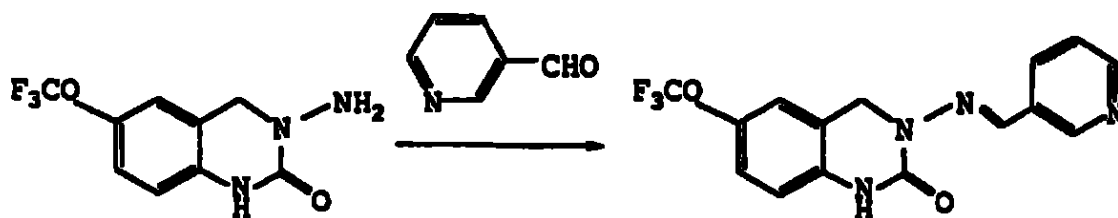
Propiedad física: p.f. 178,4 - 183,5° C.

Rendimiento: 90%.

Ejemplo 3

Preparación de 3-(3-piridilmetilidenamino)-3,4-dihidro-6-trifluorometoxi-2(1H)-quinazolinona (Compuesto No. 30)

61



A 10 ml de metanol se agregaron 0,62 g (2,5 mmoles) de 3-amino-3,4-dihidro-6-trufluorometoxi-2(1H)-quinazolinona, 0,27 g (2,5 mmol) de nicotinaldehído y 1 gota de ácido sulfúrico, la reacción fue realizada calentando bajo reflujo durante 3 horas.

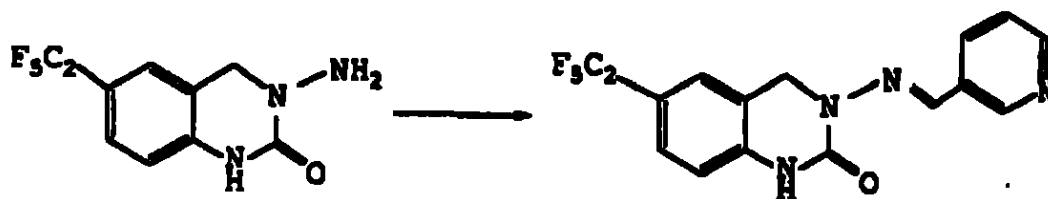
Después de la realización de la reacción, los cristales precipitados en el sistema de reacción fueron recolectados por filtración y se secaron para obtener 0,76 g del producto deseado.

Propiedad física: p.f. 264,5 - 266,0° C.

Rendimiento: 93%.

Ejemplo 4

Preparación de 3-[1-(3-piridilmetidenamino)-3,4-dihidro-6-pentafluoroetil-2(1H)-quinazolinona
(Compuesto No. 18)



A 10 ml de metanol se agregaron 0,74 g (2,5 mmol) de

3-amino-3,4-dihidro-6-pentafluoroetil-2(1H)-quinazolinona, 0,27 g (2,5 mmol) de nicotinaldehído y 1 gota de ácido sulfúrico, la reacción fue realizada calentando bajo reflujo durante 3 horas.

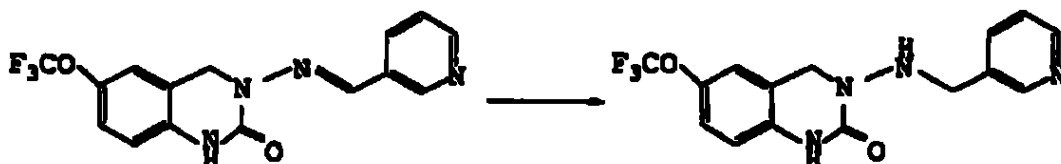
Después de la realización de la reacción los cristales precipitados en el sistema de reacción fueron recolectados por filtración y se secaron para obtener 0,78 g del producto deseado.

Propiedad física: p.f. 298,0 - 300,0° C.

Rendimiento : 84%.

Ejemplo 5

Preparación de 3-(3-piridilmetilamino)-3,4-dihidro-6-trifluorometoxi-2(1H)-quinazolinona
(Compuesto No. 208)



A 30 ml de ácido acético se agregaron 3,36 g (2,5 mmol) de 3-(3-piridilmetilidenamino)-3,4-dihidro-6-trifluorometoxi-2(1H)-quinazolinona y 0,2 g de 5% paladio-carbono, la hidrogenación se realizó a 3 a 4 kg/cm².

Después de la absorción de una cantidad teórica de hidrógeno, el catalizador fue eliminado de la mezcla de reacción por filtración, y el solvente fue eliminado por destilación bajo

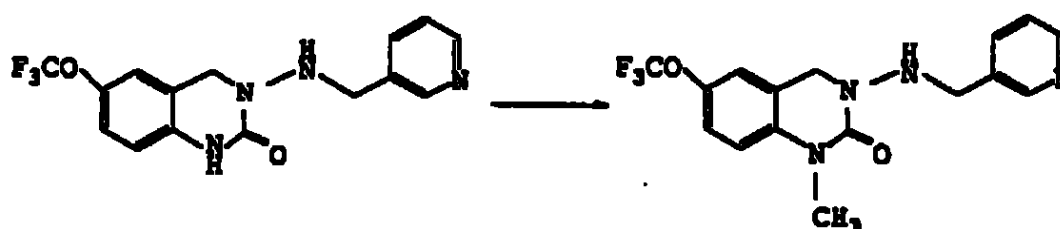
presión reducida. El residuo fue neutralizado agregado de una solución acuosa 20% de hidróxido de sodio y el compuesto deseado se extrajo con cloroformo (20 ml X 3). La solución extraída se lavó con el agua y una solución acuosa saturada con cloruro de sodio, fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro, el solvente fue eliminado por destilación bajo presión reducida. El producto crudo resultante fue purificado por una cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo-metanol=10:1) para obtener 2,5 g del compuesto deseado.

Propiedad física: n_D 1,5233 (22,6° C).

Rendimiento: 74%.

Ejemplo 6

Preparación de 1-metil-3-(3-piridilmetilamino)-3,4-dihidro-6-trifluorometoxi-2(1H)-quinazolinona
(Compuesto No. 289)



En 10 ml de dimetilformamida se disolvió 0,68 g (2,0 mmol) de 3-(3-piridilmetilamino)-3,4-dihidro-6-trifluorometoxi-2(1H)-quinazolinona. A la solución, se agregó 0,09 g de hidruro de sodio (62,4 %), y la reacción se realizó a temperatura

66
66

64

ambiente durante 30 minutos, luego 0,34 g ioduro de metilo se agregó a la misma y la reacción se realizó durante 4 horas.

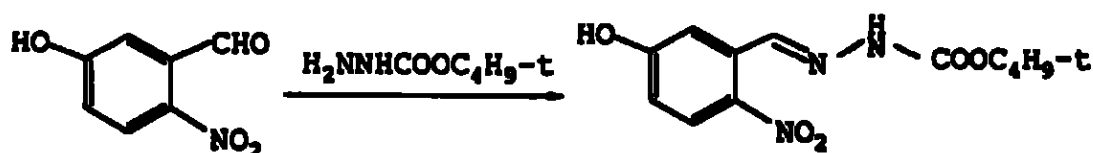
Después de la realización de la reacción, la mezcla de la reacción se vierte en una mezcla hielo-agua, el compuesto deseado se extrajo con acetato de etilo (20 ml X 3). La solución extraída se lavó con agua y sol. acuosa saturada de cloruro de sodio, fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro, y el solvente fue eliminado por destilación bajo presión reducida. El producto crudo resultante fue purificado por un cromatografía en columna de gel de sílice (acetato de etilo-metanol=10:1) para obtener 2,5 g del compuesto deseado.

Propiedad física: n_D 1,5467 (23° C).

Rendimiento: 50%.

Ejemplo 7

7-1. Preparación de t-butil 2-(5-hidroxi-2-nitrofenil-metiliden)carbazato



A 20 ml de metanol se agregaron 3,34 g (0,02 mol) de 5-hidroxi-2-nitrobenzaldehído, 2,64 g (0,02 mol) de carbazato de t-butilo y 1 gota de ácido sulfúrico, y la reacción fue realizada calentando bajo reflujo durante 3 horas.

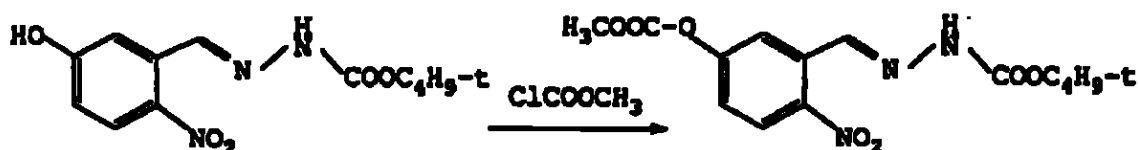
Después de la realización de la reacción, la mezcla de la reacción fue enfriada a temperatura ambiente, los cristales precipitados fueron recolectados por filtración para obtener 5,06 g del compuesto deseado.

^1H -RMN [CDCl_3/TMS , δ (ppm)]

1,57 (9H; s); 6,84 (1H; d.d); 7,66 (1H; d);
7,94 (1H; d); 8,42 (1H; br, s); 8,46 (1H; s);
10,5 (1H; br. s).

Rendimiento: 90%.

7-2. Preparación de t-butil 2-(5-metoxycarboniloxi-2-nitrofenilmetiliden)carbazato



En 15 ml de tetrahidrofurano se disolvieron 4,22 g (0,015 mol) de t-butil 2-(5-hidroxil-2-nitrofenil-metiliden)carbazato que se obtuvo en Ejemplo 7-1 y 1,67 g (0,0165 mol) de trietilamina, luego la solución se enfrió a 0° C. Luego de 15 minutos, a la solución se agregó por gotas 1,56 g (0,0165 mol) de clorofomato de metilo disuelto en 5 ml de tetrahidrofurano, luego la reacción fue continuada en temperatura ambiente durante 3 horas. Después de la realización de la reacción, la mezcla de la reacción se vierte en 20 ml de agua, y el compuesto deseado

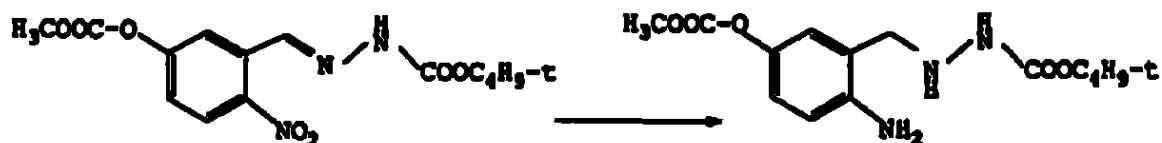
se extrajo con acetato de etilo (20 ml X 3). La solución extraída se lavó con agua y se solución acuosa saturada de cloruro de sodio, fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro, entonces el solvente fue eliminado por destilación bajo presión reducida. El producto crudo resultante fue recristalizado de hexano-éter para obtener 4,6 g del compuesto deseado.

$^1\text{H-RMN}$ [(CDCl₃/TMS, δ (ppm)]

1,54 (9H; s); 3,93 (3H; s); 7,33 (1H; d.d);
8,06 (1H; d); 8,14 (1H; d); 8,21 (1H; br.s);
8,45 (1H; s).

Rendimiento: 90 %.

7-3. Preparación de t-butil 2-(2-amino-5-metoxycarboniloxifenilmetil)carbazato



A 50 ml de metanol se agregaron 4,4 g (0,013 mol) de t-butil 2-(5-metoxycarboniloxi-2-nitrofenilmetiliden)carbazato que se obtuvo en el Ejemplo 7-2 y 0,4 g de 5% paladio-carbono, luego la reducción catalítica se realizó a 3 - 4 kg/cm².

Después de la absorción de una cantidad teórica de hidrógeno el catalizador fue eliminado de la mezcla de reacción por medio de filtración, y el solvente fue eliminado por

destilación bajo presión reducida, para obtener 4 g del compuesto deseado.

^1H -RMN [(CDCl₃/TMS, δ (ppm)]

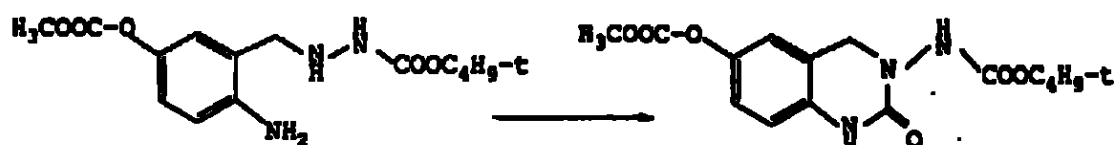
1,46 (9H; s); 3,87 (3H; s); 3,96 (2H; d);

4,6-5,0 (3H; br.s.); 6,05 (1H; br.s.);

6,6-6,7 (1H; m); 6,8-7,0 (2H; m).

Rendimiento: Cuantitativo.

7-4. Preparación de 3-t-butoxicarbonilamino-6-metoxi-carboniloxi-3,4-dihidro-2(1H)-quinazolinona



En 20 ml de tetrahidrofurano se disolvieron 3,1 g (0,01 mol) de t-butil 2-(2-amino-5-metoxycarboniloxifenilmetil)carbazato que se obtuvo en el Ejemplo 7-3 y 2,6 g (0,01 mol) de 1,1'-carbonilbis(1H-imidazol), la reacción se realizó en la temperatura ambiente durante 3 horas.

Después de la realización de la reacción, la mezcla de la reacción se vierte en 20 ml de agua, y el compuesto deseado se extrajo con acetato de etilo (20 ml X 3). La solución extraída se lavó con agua y solución acuosa saturada de cloruro de sodio, fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro, y el solvente fue eliminado por destilación bajo presión reducida. El producto

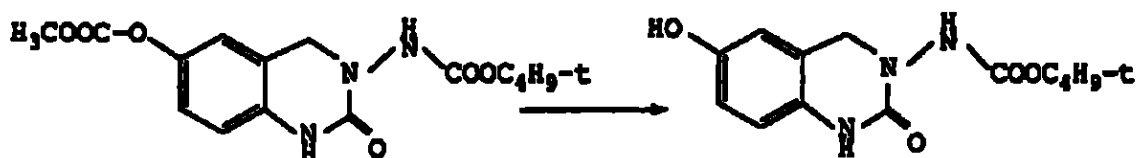
crudo así obtenido fue recristalizado del acetato del hexano-etilo, fue obtenido 2,1 g del compuesto deseado.

^1H -RMN [DMSO- d_6 /TMS, δ (ppm)]

1,42 (9H; s); 3,80 (3H; s); 4,81 (2H; s);
6,5-6,7 (3H; m); 9,01 (1H; s); 9,15 (1H;
br.s).

Rendimiento: 60%.

7-5. Preparación de 3-t-butoxicarbonilamino-6-hidroxi-
3,4-dihidro-2(1H)-quinazolinona



A 20 ml de 50% metanol se agregaron 2,1 g (0,0062 mol) de 3-t-butoxicarbonilamino-6-metoxycarboniloxi-3,4-dihidro-2(1H)-quinazolinona que se obtuvieron en el Ejemplo 7-4 y 0,64 g (0,0063 mol) de carbonato de sodio, luego la reacción fue realizada calentando bajo reflujo durante 3 horas.

Después de la realización de la reacción el metanol fue eliminado por destilación bajo presión reducida. Al residuo así obtenido se agregó 10 ml de agua y fue recolectado por filtración, entonces se realiza la recristalización de 95 % metanol para obtener 1,3 g del compuesto deseado.

^1H -RMN [DMSO- d_6 /TMS, δ (ppm)]

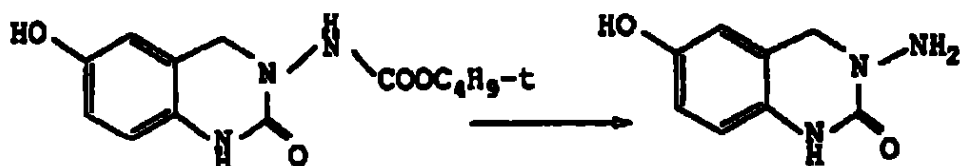
77
7A

69

1,42 (9H; s), 4,81 (2H; s), 6,5-6,7 (3H; s),
9,01 (1H; s), 9,10 (1H; s), 9,15 (1H; br.s).

Rendimiento: 75%.

7-6. Preparación de 3-amino-6-hidroxi-3,4-dihidro-
2(1H)-quinazolinona (Compound No. II-2)



A 20 ml de ácido trifluoroacético se agregaron 1,3 g (0,0046 mol) de 3-1-butoxicarbonilamino-6-hidroxi-3,4-dihidro-2(1H)-quinazolinona obtenidos en el Ejemplo 7-5, luego la reacción se realizó a temperatura ambiente durante 3 horas.

Después de la realización de la reacción, 10 ml de metanol se agregaron a la mezcla de la reacción, el solvente fue eliminado por destilación bajo presión reducida. El residuo resultante fue recristalizado del metanol para obtener 0,74 g del compuesto deseado.

¹H-RMN [DMSO-d₆/TMS, δ (ppm)]

4,95 (2H; s); 4,65 (2H; s); 6,51-6,63 (3H;
m); 9,00 (1H; s); 9,60 (1H; br.s),

Rendimiento: 90 %.

Los controladores de plaga conteniendo, como un ingrediente

activo, el derivado aminoquinazolinona sustituido (tione) de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención son adecuados para controlar diversas plagas de insecto tales como plagas de insecto agrícolas, plagas de insecto de bosque, plagas de insecto hortícolas, plagas de insecto de grano almacenado, plagas de insecto sanitarias, nemátodos, etc. Estos también tienen un efecto insecticida, por ejemplo, en HEMIPTEROS incluso la langosta verde del té (*Empoasca onukii*), langosta de arroz verde (*Nephotettix cincticeps*), langosta marrón de arroz (*Nilaparvata lugens*), (*Sogatella furcifera*), (*Diaphorina citri*), mosca blanca del cítrico (*Dialeurodes citri*), mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), mosca blanca del invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*), pulgón (*Brevicoryne brassicae*), pulgón de algodón (*Aphis gossypii*), pulgón de avena (*Rhopalosiphum padi*), pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae*), cochinilla de cera india (*Ceroplastes ceriferus*), (*Pulvinaria aurantii*), (*Pseudaonidia duplex*), cochinilla San José (*Comstockaspis perniciosa*), cochinilla punta de flecha (*Unaspis yanonensis*), bicho de la hoja de arroz (*Trigonotylus colestialium*), etc., TILÉNQUIDOS inclusive los nemátodos de lesión de raíz de café (*Pratylenchus coffeae*), nemátodo de quiste de papa (*Globodera rostochiensis*), anguillulosis de la raíz (*Meloidogyne* sp.), nemátodo de los citrus (*Tylenchulus semipenetrans*), *Aphelenchus* sp (*Aphelenchus avenae*), nematodo de foliar de crisantemo (*Aphelenchoides ritzemabosi*), etc., y

ORTOPTEROS que incluyen el gorgojo de arroz (*Stenchaetothrips biformis*), etc.

Los nombres zoológicos y lo similar están de acuerdo con la Sociedad de Zoología y Entomología Aplicada de Japón, "List of Agricultural and Forest Injurious Animals and Insects", publicado en 1987.

El controlador de plaga que contiene como ingrediente activo el derivatdo (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención posee un marcado efecto de control en las plagas de insecto, plagas sanitarias, y/o nematodos ejemplificados precedentemente que son dañinos para los campos de arroz, árboles frutales, verduras y otros cultivos, y flores y plantas ornamentales. Por consiguiente, el efecto deseado del insecticida de la presente invención puede ser obtenido aplicando el insecticida al agua del campo de arroz, la planta de arrozal, los árboles frutales, verduras, otros cultivos, semillas de flores y plantas ornamentales, raíces, tallos y hojas de plantas, suelo, etc., o al dentro de una casa o regaderas automáticas alrededor de una casa en la cual las plagas de insecto sanitarias dañinas para los hombres y bestias ejemplificadas precedentemente se presentan o se espera que se presenten. La aplicación se lleva a cabo en una estación en la cual se espera que las plagas del insecto, plagas sanitarias o nemátodos aparezcan, antes de su aparición o en el momento en el cual su presencia está

74

confirmada. La presente invención sin embargo no debe limitarse a éstas modalidades de realización.

Cuando el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención se usa como un controlador de plaga, el derivado o sal se prepara generalmente en las formas convenientemente utilizables según una modalidad convencional para la preparación de agroquímicos.

Es decir, el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención y, opcionalmente, un auxiliar es mezclado con un portador inerte conveniente en una proporción apropiada y se prepara en una modalidad de la preparación conveniente como una suspensión, concentrado emulsionable, concentrado soluble, polvo humectable, gránulos, polvo o tabletas a través de la disolución, dispersión, suspensión, mezcla, impregnación, adsorción o pegado.

El portador inerte usado en la presente invención puede ser sólido o líquido. Como el portador sólido, pueden ejemplificarse harina de soja, harina de cereal, aserrín de madera, polvo de corteza, polvo de aserrín, polvo de tall de tabaco, polvo de cáscara de nuez, salvado, polvo de celulosa, residuo de extracción de verduras, polvos o resinas de polímeros sintéticos, arcillas (caolín por ej., bentonita, y la arcilla ácida), talcos (talco por ej. y pirofilita), polvo de sílice o

escamas (tierra de diatomeas por ej., arena de sílice, mica y carbón blanco, es decir sintético, ácido silícico de alta dispersión, también llamado sílice hidratado finamente dividido o ácido silícico hidratado, algunos de los productos comercialmente disponibles, contienen silicato de calcio como el componente principal), carbón activado, polvo de azufre, piedra pómez en polvo, tierra de diatomeas calcinada, polvo de ladrillo, ceniza de mosca, arena, polvo de carbonato de calcio, polvo de fosfato de calcio y otros polvos inorgánicos o minerales, fertilizantes químicos (por ej. sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio), y abonos. Estos portadores pueden usarse solos o como una mezcla de los mismos.

El portador líquido es aquel que por sí mismo posee solubilidad o que no posee tal solubilidad pero que es capaz de dispersar un ingrediente activo con la ayuda de un auxiliar. Los siguientes son ejemplos típicos del portador líquido y puede usarse solo o como una mezcla de los mismos. El Agua; metanoles tales como alcoholes, etanol, isopropanol, butanol y etilén glicol; cetonas tales como acetona, etilo metil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona y ciclohexanona; éteres tales como etil éter, dioxano, cellosolve, dipropil éter y tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos como querosén y aceite mineral; los hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, nafta solvente y alquilnaftalenos; los

hidrocarburos halogenados tales como dicloroetano, clor formo y tetracloruro de carbono; ésteres tales como etil cetato, diisopropil ftalato, dibutil ftalato y dioctil ftalato; amidas tales como dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida; nitrilos tales como acetonitrilo; y dimetil sulfóxido.

Lo siguiente son ejemplos típicos del auxiliar, el cual se usa dependiendo en los propósitos y se usa solo o en combinación en algunos casos, o no necesita ser usado en absoluto.

Se utiliza para emulsionar, dispersar, disolver y/o humectar un ingrediente activo, un agente tensioactivo. Como el agente tensioactivo, pueden ejemplificarse alquil éteres de polioxietileno, alquilaril éteres de polioxietileno, polioxietilén ésteres de ácido graso superior, resinatos de polioxietileno, sorbitan monolaurato de polioxietileno, sorbitan monooleato de polioxietileno, alquilarilsulfonatos, los productos de la condensación de ácido naftalensulfónico, ligninsulfonatos y ésteres sulfato de alcohol superior.

Además, para estabilizar la dispersión de un ingrediente activo, su adhesión y/o unión, pueden usarse auxiliares tales como caseína, gelatina, almidón, metil celulosa, carboximetil celulosa, goma arábiga, polivinil alcoholes, trementina, aceite de salvado, bentonita y ligninsulfonatos.

Para mejorar la fluidez de un producto sólido, pueden usarse auxiliares tales como ceras, estearatos y fosfatos de alquilo.

Los auxilios tales como los productos de la condensación de ácido naftalensulfónico y policondensados de fosfatos pueden usarse como un peptizador para los productos dispersables.

Los auxiliares tales como aceites de silicona también pueden ser usados como un agente de despumación.

El contenido del ingrediente activo puede variar según sea requerido. En polvos o gránulos, el volumen conveniente es desde 0,01 a 50 % en peso. En concentrado emulsionable o polvos humectables diluibles, también es de 0,01 a 50% en peso.

El controlador de plaga que contiene como ingrediente activo el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención se usan para controlar una variedad de plagas de insecto de la manera siguiente. Es decir, se aplica a las plagas de insecto o un sitio en donde no se desea que se presenten o crezcan las plagas del insecto, tal como está o después de diluirse apropiadamente con o suspendido en agua o lo similar, en una cantidad eficaz para el control de las plagas de insecto.

La dosificación de aplicación del controlador de plaga que contiene como un ingrediente activo el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención varía dependiendo de diversos factores tales como propósito, plagas de insecto a ser controlado, estado de crecimiento de una planta, tendencia de aparición de plagas de insecto, clima, condiciones

medioambientales, forma de la preparación, método de aplicación, sitio de aplicación y tiempo de aplicación. Puede elegirse apropiadamente en el rango desde 0,1 g hasta 5 kg (en términos del ingrediente activo) por 0,1 hectárea dependiendo de los propósitos.

El controlador de plaga que contiene como ingrediente activo el derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención puede usarse en una mezcla con otros insecticidas o fungicidas para extender tanto el espectro de especie de plaga de insecto controlable como el periodo de tiempo cuando las aplicaciones eficaces son posibles o para reducir la dosificación.

Los ejemplos de formulación y ejemplos de prueba típicos de la presente invención se describen a continuación pero los mismos no deben interpretarse como limitadores del alcance de la invención.

En los ejemplos de formulación, las partes son todas en peso.

Ejemplo de Formulación 1

Cada compuesto enumerado en Tablas 3 y 4	50 partes
Xileno	40 partes
Mezcla de polioxietilen	10 partes

nonilfenil éter y calcio
alquilbencensulfonato

Un concentrado emulsionable fue preparado mezclando los ingredientes anteriores uniformemente para efectuar la disolución.

Ejemplo de formulación 2

Cada compuesto enumerado en Tablas 3 partes
3 y 4

Polvo de la arcilla 82 partes

Polvo de tierra de diatomeas 15 partes

Un polvo fue preparado mezclando uniformemente y moliendo los ingredientes anteriores.

Ejemplo de formulación 3

Cada compuesto enumerado en Tablas 5 partes
3 y 4

Polvo mezclado de bentonita y arcilla 90 partes

Lignin sulfonato de calcio 5 partes

Los gránulos fueron preparados mezclando los ingredientes anteriores uniformemente, y amasando la mezcla resultante junto con una cantidad conveniente de agua, seguido por granulación y secado.

Ejemplo de formulación 4

Cada compuesto enumerado en Tablas 20 partes
3 y 4

Mezcla de caolín y ácido silícico 75 partes

de alta dispersión sintético,

Mezcla de polioxietilen

5 partes

nonilfenil éter y

alquilbenzenesulfonato de calcio

Un polvo humectable fue preparado mezclando uniformemente y moliendo los ingredientes anteriores.

Ejemplo de prueba 1

Eficacia del control contra el pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae*)

Una planta de repollo de la china se plantó en cada una de las macetas de plástico con un diámetro de 8 cm y una altura de 8 cm y los pulgones verdes del duraznero se propagaron en la planta después de lo cual se contaron los parásitos en cada maceta.

Cada uno de los derivados aminoquinazolinona (tiona) sustituidos de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención que se enumera en las Tablas 3 y 4 se dispersó y se diluyó en agua para obtener un líquido químico de 500 ppm. Los tallos y hojas de las plantas de repollo de la se China se rociaron con el líquido químico y se secaron por aire, y luego las macetas se almacenaron en un invernáculo. Seis días después del rociado, los pulgones verdes del duraznero parasitario en cada planta de repollo de la China se contaron y el grado de eficacia de control fue calculado por medio de la ecuación siguiente, con la cual el efecto del insecticidal se

8/11

evaluó según el criterio indicado a continuación.

Eficacia de control = $100 - \{(T \times Ca) / (Ta \times C)\} \times 100$

Ta: número de parásitos antes de rociar en grupo tratado,

T: número de parásitos después de rociar en grupo tratado,

Ca: número de parásitos antes de rociar el grupo no tratado,

C: número de parásitos después de rociar el grupo no tratado.

Criterio:

Eficacia	Porcentaje de control (%)
A	100
B	99 - 90
C	89 - 80
D	79 - 50

Ejemplo de prueba 2

Efecto insecticida en el langosta marrón de arroz
(Nilaparvata Lugens)

Cada uno de los derivados (tiona) aminoquinazolinona sustituidos de la fórmula general (I) o sal del mismo de la presente invención enumerados en Tablas 3 y 4 se dispersó y se diluyó con agua para obtener un líquido químico con 500 ppm. Las plantas de arroz (cultivo: Nihonbare) se sumergieron en el líquido químico durante 30 segundos y se secó por aire después de lo cual cada planta se coloca en un tubo de ensayo de vidrio

y se inoculó con 10 ninfas de tercer etapa de langosta marrón de arroz, y el tubo de ensayo se tapa con un tapón de algodón. Ocho días después de la inoculación, se contaron los especímenes muertos y vivos. La tasa de mortalidad fue calculada por la ecuación siguiente y el efecto de control se evaluó según el criterio descrito a continuación.

Mortalidad de larvas corregida (%) = $\{(Ca/c-Ta/T)/Ca/c\} \times 100$

Ta: número de ninfas vivas en grupos tratados

T: número de ninfas inoculadas en grupos tratados

Ca: número de ninfas vivas en el grupo no tratado

c: número de ninfas inoculadas en grupos no tratados

Criterio: igual que el de Ejemplo de prueba 1.

Ejemplo de prueba 3

Prueba insecticida en mosca blanca del invernadero
(*Trialeurodes vaporariorum*)

Cada uno de los compuestos de la presente invención enumerados en Tabla 3 y Tabla 4 se dispersaron y se diluyeron con agua para preparar un líquido de prueba que contiene 100 ppm del compuesto de la prueba. Mediante utilización de una pistola rociadora, el líquido de prueba se roció en la superficie de una hoja de planta de tomate colocada en una ampolla de 20 ml que contiene agua en una mesa giratoria. Después de secado por aire, la hoja tratada con el líquido de prueba se coloca en un cilindro de vidrio, y se inoculó con 20 adultos de mosca blanca

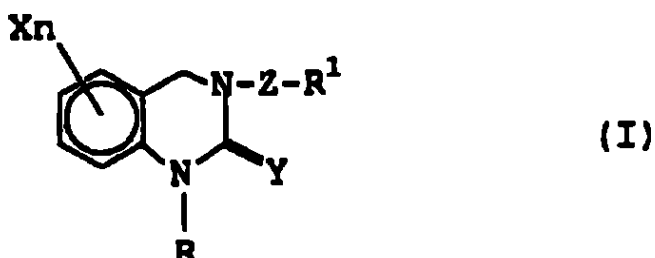
de invernadero. Después de la inoculación, la hoja se puso en un invernadero, y el número de adultos de mosca blanca del invernadero fue contado. La tasa mortalidad de los adultos se calculó de manera similar a la realizada en el Ejemplo de prueba 2, y el efecto insecticidal de cada uno de los compuestos de prueba fue evaluado por un método idéntico al Ejemplo de prueba 1.

De los resultados obtenidos en Ejemplo de prueba 1, 2 y 3 se desprende: en el Ejemplo de prueba 1, los Compuestos No. 6, 18, 22, 26, 30, 184, 200, 204 y 208 demostraron un efecto insecticida excelente calificado con A contra el pulgón verde del duraznero (*Myzus persicae*); en el Ejemplo de prueba 2, los Compuestos No. 6, 18, 22, 26, 30, 184, 200, 204 y 208 demostraron un efecto insecticida excelente calificado con A contra la langosta (*Nilaparvata lugens*); y en el Ejemplo de prueba 3, los Compuestos No. 6, 10, 14, 18, 22, 26, 30, 38, 78, 86, 90, 184, 200, 204 y 208 demostraron un efecto insecticida excelente calificado con D o superior contra la mosca blanca del invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*); particularmente, los Compuestos No. 6, 18, 22, 26, 30, 184, 200, 204 y 208 demostraron un efecto insecticida excelente calificado con A.

REIVINDICACIONES

REIVINDICACIONES

1. Un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido caracterizado por que está representado por la fórmula general (I), o una sal del mismo:



en donde R es un átomo de hidrógeno; un grupo hidroxilo; un grupo formilo; grupo alquilo (C₁₋₁₂); un grupo halo(C₁₋₆)alquilo; un grupo hidroxil(C₁₋₆)alquilo; un grupo alquenoilo (C₂₋₆); un (C₂₋₆) grupo alquinoilo; un grupo alcoxilo (C₁₋₆); un grupo halo (C₁₋₆) alcoxilo; un grupo alcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₃); un grupo alcoxi (C₁₋₆)alcoxi(C₁₋₃)alquilo(C₁₋₃); un grupo alquiltio(C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C₁₋₆); un grupo alquilsulfonilo (C₁₋₆); un grupo alquiltio (C₁₋₆) alquilo (C₁₋₃); un grupo dialcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₃) en el cual los grupos alcoxilos (C₁₋₆) pueden ser iguales o diferentes; un grupo alquil (C₁₋₆)amino sin sustituir; un grupo alquil(C₁₋₆)amino sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alquenoilo (C₂₋₆) y grupo alquinoilo (C₂₋₆); un grupo ciano(C₁₋₆)alquilo; un grupo

alquilcarbonilo ($C_{1..}$); un grupo alcoxycarbonilo ($C_{1..}$); un grupo hidroxycarbonil($C_{1..}$)alquilo; un grupo alcoxycarbonil ($C_{1..}$)alquilo($C_{1..}$); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo alqueno ($C_{2..}$) y grupo alquino ($C_{3..}$); un grupo cicloalquil ($C_{3..}$)alquilo($C_{1..}$); un grupo fenil($C_{1..}$)alquilo sin sustituir; un grupo fenil($C_{1..}$)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alquilo, grupo alcóxido ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alcóxido, ($C_{1..}$) grupo alquiltio y grupo halo($C_{1..}$)alquiltio; un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alquilo, grupo alcóxido ($C_{1..}$), grupo halo ($C_{1..}$)alcóxido, grupo ($C_{1..}$) alquiltio y grupo hal ($C_{1..}$) alquiltio; un grupo feniltio sin sustituir; un grupo feniltio sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alquilo, grupo alcóxido ($C_{1..}$), grupo hal

(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆) alquiltio; un grupo fenilsulfonilo sin sustituir; un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆) alquilsulfonilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆) alquilsulfonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; grupo feniloxycarbonilo sin sustituir; un grupo feniloxycarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆) alquiltio; un grupo feniloxi(C₁₋₆)alquilo sin sustituir, un grupo feniloxi(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo

88

nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil (C_{2-6})alquenilo sin sustituir, un grupo fenil(C_{2-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-3}); un grupo fenil(C_{2-6}) alquinilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{2-6})alquinilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo (C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-3}); un grupo fenil(C_{2-6})alquinil(C_{1-3}) alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{2-6})alquinil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo halo (C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-3}); un grupo 1,3-dioxolan-2-il(C_{1-3}) alquilo; o un grupo ftalimido(C_{1-6})alquilo,

34

R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^2 es igual al definido precedentemente, y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), un grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-3}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilcarbonilo),

X puede ser igual o diferente, y es un átomo de bromo, un átomo de iodo; un grupo hidróxido; un grupo ciano; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquénido (C_{2-6}); un grupo halo(C_{2-6})alquénido; un grupo alquínido (C_{2-6}); un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo

4

alquilsulfinilo ($C_{1..6}$); un grupo halo($C_{1..6}$)alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo ($C_{1..6}$); un grupo halo($C_{1..6}$)alquilsulfonilo; un grupo halo($C_{1..6}$)alcoxihalo($C_{1..6}$)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo ($C_{1..6}$); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..6}$), grupo alquenilo ($C_{2..6}$) y grupo alquinilo ($C_{3..6}$); un grupo carboxi($C_{1..6}$) alquilo; un grupo alcoxycarbonil($C_{1..6}$)alquilo($C_{1..6}$); un grupo aminocarbonil($C_{1..6}$)alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil($C_{1..6}$)alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..6}$), grupo alquenilo ($C_{2..6}$) y grupo alquinilo ($C_{3..6}$); un grupo ácido sulfónico; un grupo aminosulfonilo sin sustituir; un grupo alcoxysulfonilo ($C_{1..6}$); un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..6}$), grupo alquenilo ($C_{2..6}$) y grupo alquinilo ($C_{3..6}$); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo ($C_{1..6}$), grupo halo($C_{1..6}$)alquilo, grupo alcoxilo ($C_{1..6}$), grupo halo($C_{1..6}$) alcoxilo, grupo alquiltio ($C_{1..6}$), grupo halo($C_{1..6}$)alquiltio, grupo

2A
91

alcoxisulfonilo (C_{1-6}) y un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de 0 a 4.

2. Un derivado (tióna) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1,

12

caracterizado por que R es un átomo de hidrógeno; un grupo formilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenoilo (C_{2-6}); un grupo alquinoilo (C_{2-6}); un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo (C_{1-6})alcoxi(C_{1-3})alquilo; un grupo alcoxi(C_{1-6})alcoxi(C_{1-3})alquilo(C_{1-3}); un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquil(C_{1-6})amino sin sustituir; un grupo alquil(C_{1-6})amino sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alquenoilo (C_{2-6}) y grupo alquinoilo (C_{2-6}); un grupo ciano(C_{1-6})alquilo; un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo hidroxycarbonil(C_{1-3})alquilo; un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo cicloalquil(C_{3-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio ; un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo,

13

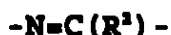
grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniltio sin sustituir; un grupo feniltio sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxilo (C_{1-2}); un grupo fenil(C_{1-6})alquinilo sin sustituir; o un grupo fenilalquinil(C_{1-6})alquilo (C_{1-6}) sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupos alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxilo (C_{1-2}),

R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo

de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos ciano, grupos alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^1 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^1 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6}), y R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilcarbonilo),

X pueden ser iguales o diferentes, y es un átomo de bromo; un átomo de yodo; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo alquénilo (C_{1-6}); un grupo alquínilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo, un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo

(C₁₋₆)alquilsulfonilo; un grupo halo(C₁₋₆)alcoxihal (C₁₋₆)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxicarbnilo (C₁₋₆); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupos alquilo (C₁₋₆), grupo alquenilo (C₂₋₆) y grupo alquinilo (C₂₋₆); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenil sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden sea iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; o un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; y n es un entero de

#6
96

valor 0 a 4.

3. Un derivado (tione) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 2, caracterizado por que R es un átomo de hidrógeno; un grupo formilo; un grupo alquilo (C_{1-11}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenilo (C_{2-6}); un grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxido (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxido, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxido (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxido, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupos halo (C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxido (C_{1-3}); un grupo fenil(C_{1-6})alquinil sin sustituir; o un grupo fenil(C_{1-6})alquinil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de

97

átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-6}), R^1 es un grupo piridilo,

Y es el átomo de oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o

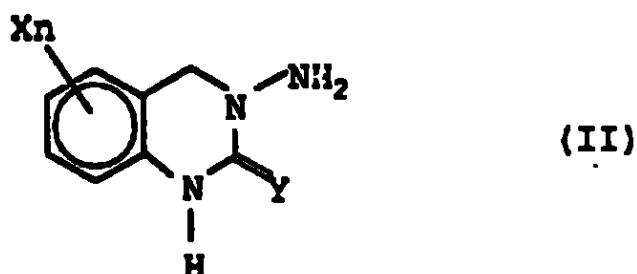


(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6}), y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6})),

X pueden ser iguales o diferentes, y es un átomo de bromo; un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo alquenilo (C_{1-6}); un grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo, un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfonilo; un grupo halo(C_{1-6})alcoxihalo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo fenil sin

sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupos alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; o un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de valor 0 a 4.

4. Un compuesto caracterizado por que está representado por la fórmula general



en donde, X puede ser igual o diferente y es un átomo de bromo, un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo ciano; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquenilo; un grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfonilo; un grupo halo(C_{1-6})alcoxihalo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo carboxi(C_{1-6})alquilo; un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-6}); un grupo aminocarbonil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo

100

alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo de ácido sulfónico; un (C1-6) grupo alcoxisulfonilo; un grupo sulfonamida que posee un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), un grupo alquenilo (C_{1-6}) o un grupo alquinilo (C_{1-6}) en el átomo de nitrógeno; un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomo halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden iguales o

101

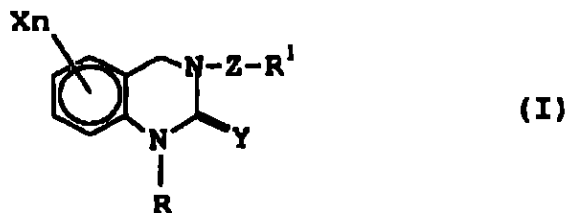
diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-4}), grupo halo(C_{1-4})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-4}), grupo halo(C_{1-4}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-4}) y grupo halo(C_{1-4})alquiltio; n es un entero de 0 a 4; y Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre.

5. Un controlador de plaga caracterizado por que comprende como ingrediente activo un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3.

6. Un método para controlar plagas caracterizado por que comprende aplicar un controlador de plaga que comprende como ingrediente activo un derivado (tiona) aminoquinaz linona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, a los cultivos objetivo o el suelo.

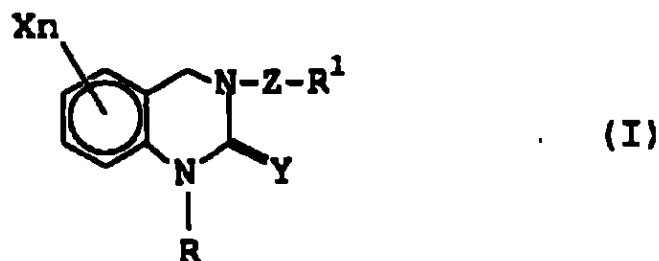
RESUMEN

Un controlador de plaga que contiene, como ingrediente activo, un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o sal del mismo representado por la fórmula general (I):



[en donde R es ~~H, OH,~~ grupo formilo, grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo hidroxil(C₁₋₆)alquilo, grupo alquenilo (C₂₋₆), grupo alquil(C₁₋₆)amino (sustituido), grupo aminocarbonilo (sustituido), grupo fenil(C₁₋₃)alquilo (sustituido), grupo fenilalquinil(C₁₋₃)alquilo (sustituido), grupo 1,3-dioxolan-2-ilalquilo (C₁₋₃), grupo ftalimido(C₁₋₆)alquilo y lo similar; R¹ es grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros que posee 1 a 3 heteroátomos seleccionados del grupo que consiste de Q, S y N; Y es Q o S; Z es grupo de la fórmula -N=C(R²)- o -N(R²)-CH(R²) (en donde cada uno de R² y R² es átomo de hidrógeno, grupo alquilo (C₁₋₆) o lo similar); X es Br, I, OH, CN, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo alquenilo (C₂₋₆), grupo aminocarbonilo (sustituido), grupo feniloxilo (sustituido) o lo similar; n es un entero de 0 a 4], y dicho derivado aminoquinazolinona sustituido o sal del mismo posee excelente efecto insecticida a bajas dosis contra la mosca blanca del invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*) etc., respecto a compuestos convencionales con estructura química análoga que no presentan el efecto insecticida deseado.

1. Un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido caracterizado por que está representado por la fórmula general (I), o una sal del mismo:



en donde R es un átomo de hidrógeno; un grupo hidroxilo; un grupo formilo; grupo alquilo (C₁₋₁₂); un grupo halo(C₁₋₆)alquilo; un grupo hidroxil(C₁₋₆)alquilo; un grupo alquenoilo (C₂₋₆); un (C₂₋₆) grupo alquinoilo; un grupo alcoxilo (C₁₋₆); un grupo halo (C₁₋₆) alcoxilo; un grupo alcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₃); un grupo alcoxi (C₁₋₆)alcoxi(C₁₋₃)alquilo(C₁₋₃); un grupo alquiltio(C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C₁₋₆); un grupo alquilsulfonilo (C₁₋₆); un grupo alquiltio (C₁₋₆) alquilo (C₁₋₃); un grupo dialcoxi(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₃) en el cual los grupos alcoxilos (C₁₋₆) pueden ser iguales o diferentes; un grupo alquil (C₁₋₆)amino sin sustituir; un grupo alquil(C₁₋₆)amino sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alquenoilo (C₂₋₆) y grupo alquinoilo (C₂₋₆); un grupo ciano(C₁₋₆)alquilo; un grupo

alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo hidroxycarbonil(C_{1-3})alquilo; un grupo alcoxycarbonil (C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo cicloalquil (C_{3-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcóxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxilo, (C_{1-6}) grupo alquiltio y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxilo (C_{1-6}), grupo halo (C_{1-6})alcóxilo, grupo (C_{1-6}) alquiltio y grupo halo(C_{1-6}) alquiltio; un grupo feniltio sin sustituir; un grupo feniltio sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxilo (C_{1-6}), grupo halo

(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆) alquiltio; un grupo fenilsulfonilo sin sustituir; un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆) alquilsulfonilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆) alquilsulfonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆) alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; grupo feniloxicarbonilo sin sustituir; un grupo feniloxicarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se selecciona del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo (C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆) alquiltio; un grupo feniloxi(C₁₋₆)alquilo sin sustituir, un grupo feniloxi(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo

nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6}) alquiltio; un grupo fenil (C_{2-6}) alquenilo sin sustituir, un grupo fenil(C_{2-6}) alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-2}); un grupo fenil(C_{2-6}) alquinilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{2-6}) alquinilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-2}); un grupo fenil(C_{2-6}) alquinil(C_{1-3}) alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{2-6}) alquinil(C_{1-3}) alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo halo (C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-2}); un grupo 1,3-dioxolan-2-il(C_{1-2}) alquilo; o un grupo ftalimido(C_{1-6}) alquilo,

107
107

R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^2 es igual al definido precedentemente, y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), un grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-3}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilcarbonilo),

X puede ser igual o diferente, y es un átomo de bromo, un átomo de yodo; un grupo hidróxido; un grupo ciano; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquénido (C_{2-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquénido; un grupo alquínido (C_{2-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquínido; un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo

alquilsulfinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfonilo; un grupo halo(C_{1-6})alcoxihalo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxicarbonilo (C_{1-6}); un grupo aminocarbonil sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo carboxi(C_{1-6}) alquilo; un grupo alcoxicarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-6}); un grupo aminocarbonil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo ácido sulfónico; un grupo aminosulfonilo sin sustituir; un grupo alcoxisulfonilo (C_{1-6}); un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilti, grupo

alcoxisulfonilo (C_{1-6}) y un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de 0 a 4.

2. Un derivado (tione) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1,

caracterizado por que R es un átomo de hidrógeno; un grupo formilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquil ; un grupo alqueno (C_{2-6}); un grupo alquino (C_{2-6}); un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo (C_{1-6})alcoxi(C_{1-3})alquilo; un grupo alcoxi(C_{1-6})alcoxi(C_{1-3})alquilo(C_{1-3}); un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquil(C_{1-6})amino sin sustituir; un grupo alquil(C_{1-6})amino sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alqueno (C_{2-6}) y grupo alquino (C_{2-6}); un grupo ciano(C_{1-6})alquilo; un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcóxicarbonilo (C_{1-6}); un grupo hidroxycarbonil(C_{1-3})alquilo; un grupo alcóxicarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo cicloalquil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio ; un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo,

AMB
III

grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniltio sin sustituir; un grupo feniltio sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxilo (C_{1-2}); un grupo fenil(C_{1-6})alquinilo sin sustituir; o un grupo fenilalquinil(C_{1-6})alquilo (C_{1-6}) sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupos alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxilo (C_{1-2}),

R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo

~~114~~
112

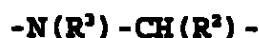
de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos ciano, grupos alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6}), y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-3}) o un grupo halo(C_{1-3})alquilcarbonilo),

X pueden ser iguales o diferentes, y es un átomo de bromo; un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo alqueno (C_{2-6}); un grupo alquino (C_{2-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo, un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo

113

(C₁₋₆)alquilsulfonilo; un grupo halo(C₁₋₆)alcoxi halo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C₁₋₆); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupos alquilo (C₁₋₆), grupo alquenoilo (C₁₋₆) y grupo alquinoilo (C₁₋₆); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenil sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden sea iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; o un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; y n es un entero de

114

valor 0 a 4.

3. Un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 2, caracterizado por que R es un átomo de hidrógeno; un grupo formilo; un grupo alquilo (C_{1-12}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenilo (C_{2-6}); un grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxido (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxido, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{2-6})alquenilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{2-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxido (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxido, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupos halo (C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxido (C_{1-3}); un grupo fenil(C_{2-6})alquinilo sin sustituir; o un grupo fenil(C_{2-6})alquinil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de

~~AA~~
115

átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquil (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo (C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquiltio y grupo alquilendioxilo (C₁₋₂), R¹ es un grupo piridilo,

Y es el átomo de oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R² es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁₋₆) o un grupo halo(C₁₋₆)alquilo), o



(en donde R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C₁₋₆), y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C₁₋₆)),

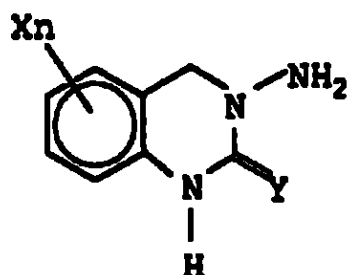
X pueden ser iguales o diferentes, y es un átomo de bromo; un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo (C₁₋₆); un grupo alquenilo (C₂₋₆); un grupo alquinilo (C₂₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilo, un grupo alcoxilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfinilo; un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfonilo; un grupo halo(C₁₋₆)alcoxihalo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C₁₋₆); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo alquenilo (C₂₋₆) y grupo alquinilo (C₂₋₆); un grupo fenilo sin

116

sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupos alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; o un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de valor 0 a 4.

4. Un compuesto caracterizado por que está representado por la fórmula general

~~117~~
117



(II)

en donde, X puede ser igual o diferente y es un átomo de bromo, un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo ciano; un grupo alquilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilo; un grupo alquenilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₂₋₆)alquenilo; un grupo alquinilo (C₂₋₆); un grupo alcoxilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo alquiltio (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C₁₋₆); un grupo halo(C₁₋₆)alquilsulfonilo; un grupo halo(C₁₋₆)alcoxihalo(C₁₋₆)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxicarbonilo (C₁₋₆); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo alquenilo (C₂₋₆) y grupo alquinilo (C₂₋₆); un grupo carboxi(C₁₋₆)alquilo; un grupo alcoxicarbonil(C₁₋₆)alquilo(C₁₋₆); un grupo aminocarbonil(C₁₋₆)alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C₁₋₆), grupo

alquenilo (C₁₋₆) y grupo alquinilo (C₁₋₆); un grupo de ácido sulfónico; un (C1-6) grupo alcoxisulfonilo; un grupo sulfonamida que posee un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C₁₋₆), un grupo alquenilo (C₁₋₆) o un grupo alquinilo (C₁₋₆) en el átomo de nitrógeno; un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₃)alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₃)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomo halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupo alquiltio (C₁₋₆) y grupo halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden ser iguales o

diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-n}), grupo halo(C_{1-n})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-n}), grupo halo(C_{1-n}) alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-n}) y grupo halo(C_{1-n})alquiltio; n es un entero de 0 a 4; y Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre.

5. Un controlador de plaga caracterizado por que comprende como ingrediente activo un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3.

6. Un método para controlar plagas caracterizado por que comprende aplicar un controlador de plaga que comprende como ingrediente activo un derivado (tiona) aminoquinaz linona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, a los cultivos objetivo o el suelo.

Retirados folios 122-123 → extracto. 2002-08-08
124-125-126. extracto

~~120~~
120

R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógen , grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^2 es igual al definido precedentemente, y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), un grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilcarbonilo),

X puede ser igual o diferente, y es un átomo de bromo un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo ciano; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquénilo (C_{2-6}); un grupo halo(C_{2-6})alquénilo; un grupo alquínilo (C_{2-6}); un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo

~~121~~
121

alquilsulfinilo ($C_{1..}$); un grupo halo($C_{1..}$)alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo ($C_{1..}$); un grupo halo($C_{1..}$)alquilsulfonilo; un grupo halo($C_{1..}$)alcoxihalo($C_{1..}$)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo ($C_{1..}$); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo alquenilo ($C_{1..}$) y grupo alquinilo ($C_{1..}$); un grupo carboxi($C_{1..}$)alquilo; un grupo alcoxycarbonil($C_{1..}$)alquilo($C_{1..}$); un grupo aminocarbonil($C_{1..}$)alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil($C_{1..}$)alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo alquenilo ($C_{1..}$) y grupo alquinilo ($C_{1..}$); un grupo ácido sulfónico; un grupo aminosulfonilo sin sustituir; un grupo alcoxysulfonilo ($C_{1..}$); un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo alquenilo ($C_{1..}$) y grupo alquinilo ($C_{1..}$); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alquilo, grupo alcoxilo ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alcoxilo, grupo alquiltio ($C_{1..}$), grupo halo($C_{1..}$)alquiltio, grupo

alcoxisulfonilo (C_{1-6}) y un grupo aminosulfonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquínilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo c' 20, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de 0 a 4.

2. Un derivado (tíona) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 1,

caracterizado por que R es un átomo de hidrógeno; un grupo formilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenilo (C_{2-6}); un grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo (C_{1-6})alcoxi(C_{1-3})alquilo; un grupo alcoxi(C_{1-6})alcoxi(C_{1-3})alquilo(C_{1-3}); un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquil(C_{1-6})amino sin sustituir; un grupo alquil(C_{1-6})amino sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo ciano(C_{1-6})alquilo; un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo hidroxycarbonil(C_{1-3})alquilo; un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo cicloalquil(C_{3-6})alquilo(C_{1-3}); un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-3})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo,

grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenilti sin sustituir; un grupo feniltio sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxilo (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{1-6})alquinil sin sustituir; o un grupo fenilalquinil(C_{1-6})alquilo (C_{1-3}) sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupos alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxilo (C_{1-6}),

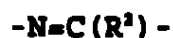
R^1 es un anillo heterocíclico de 5- o 6- miembros que posee 1 a 3 heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste del átomo de oxígeno, átomo

132/25

de azufre y átomo de nitrógeno, dicho anillo heterocíclico puede tener 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos ciano, grupos alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo y grupo alcóxido (C_{1-6}), y el átomo de nitrógeno en el anillo heterocíclico puede formar un grupo N-óxido,

Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6}), y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), grupo formilo, un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilcarbonilo),

X pueden ser iguales o diferentes, y es un átomo de bromo; un átomo de yodo; un grupo hidróxido; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo alquénido (C_{1-6}); un grupo alquínido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo, un grupo alcóxido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcóxido; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilsulfínido (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfínido; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo

(C₁₋₆)alquilsulfonilo; un grupo halo(C₁₋₆)alcoxihalo (C₁₋₆)alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxicarbonilo (C₁₋₆); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupos alquilo (C₁₋₆), grupo alquenoilo (C₁₋₆) y grupo alquinilo (C₁₋₆); un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenil sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo (C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C₁₋₆)alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden sea iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste en átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo (C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; o un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alquilo, grupo alcoxilo (C₁₋₆), grupo halo(C₁₋₆)alcoxilo, grupos alquiltio (C₁₋₆) y grupos halo(C₁₋₆)alquiltio; y n es un entero de

127

134

valor 0 a 4.

3. Un derivado (tione) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con la reivindicación 2, caracterizado por que R es un átomo de hidrógeno; un grupo formilo; un grupo alquilo (C_{1-11}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenilo (C_{2-6}); un grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilcarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-6}); un grupo fenilcarbonilo sin sustituir; un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo hal (C_{1-6}) alquilo, grupo alcóxido (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcóxido, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo fenil(C_{2-6})alquenilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{2-6})alquenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcóxido (C_{1-6}), grupo halo (C_{1-6})alcóxido, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupos halo (C_{1-6})alquiltio y grupos alquilendioxido (C_{1-6}); un grupo fenil(C_{2-6})alquinilo sin sustituir; o un grupo fenil(C_{2-6})alquinil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de

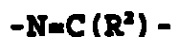
128
~~175~~

21

átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquiltio y grupo alquilendioxilo (C_{1-3}), R^1 es un grupo piridilo,

Y es el átomo de oxígeno o un átomo de azufre,

Z es



(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}) o un grupo halo(C_{1-6})alquilo), o

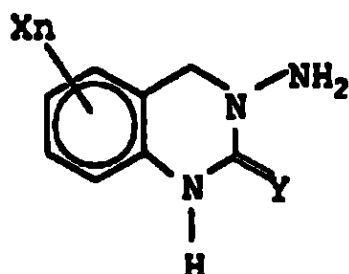


(en donde R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6}), y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo (C_{1-6})),

X pueden ser iguales o diferentes, y es un átomo de bromo; un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo alquenilo (C_{2-6}); un grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo, un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfonilo; un grupo halo(C_{1-6})alcoxihalo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo fenil sin

sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupos alquiltio (C_{1-6}) y grupos halo(C_{1-6})alquilti ; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; o un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupos nitro, grupos ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; y n es un entero de valor 0 a 4.

4. Un compuesto caracterizado por que está representado por la fórmula general



(II)

en donde, X puede ser igual o diferente y es un átomo de bromo, un átomo de iodo; un grupo hidroxilo; un grupo ciano; un grupo alquilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilo; un grupo alquenilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquenilo; un grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo alcoxilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo alquiltio (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo alquilsulfinilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfinilo; un grupo alquilsulfonilo (C_{1-6}); un grupo halo(C_{1-6})alquilsulfonilo; un grupo halo(C_{1-6})alcoxihalo(C_{1-6})alcoxilo; un grupo carboxilo; un grupo alcoxycarbonilo (C_{1-6}); un grupo aminocarbonilo sin sustituir; un grupo aminocarbonilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo alquenilo (C_{1-6}) y grupo alquinilo (C_{1-6}); un grupo carboxi(C_{1-6})alquilo; un grupo alcoxycarbonil(C_{1-6})alquilo(C_{1-6}); un grupo aminocarbonil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo aminocarbonil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee uno o dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de grupo alquilo (C_{1-6}), grupo

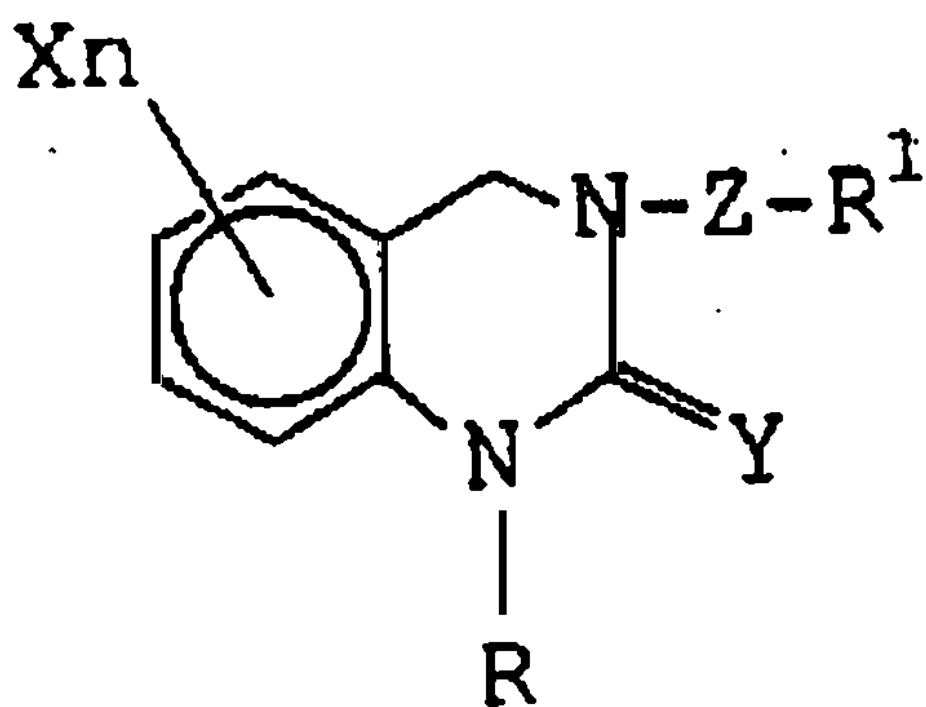
alquenilo (C_{2-6}) y grupo alquinilo (C_{2-6}); un grupo de ácido sulfónico; un (C1-6) grupo alcoxisulfonilo; un grupo sulfonamida que posee un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo (C_{1-6}), un grupo alquenilo (C_{2-6}) o un grupo alquinilo (C_{2-6}) en el átomo de nitrógeno; un grupo fenilo sin sustituir; un grupo fenilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo hal (C_{1-6}) alquiltio; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sin sustituir; un grupo fenil(C_{1-6})alquilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomo halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo hal (C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo feniloxilo sin sustituir; un grupo feniloxilo sustituido que posee en el anillo 1 a 5 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6}) alquilo, grupo alcoxilo (C_{1-6}), grupo halo(C_{1-6})alcoxilo, grupo alquiltio (C_{1-6}) y grupo halo(C_{1-6})alquiltio; un grupo piridiloxilo sin sustituir; o un grupo piridiloxilo sustituido que posee uno o mas sustituyentes que pueden iguales o

diferentes y se seleccionan del grupo que consiste de átomos de halógeno, grupo nitro, grupo ciano, grupo alquilo ($C_{1..6}$), grupo halo($C_{1..6}$)alquilo, grupo alcoxilo ($C_{1..6}$), grupo halo($C_{1..6}$) alcoxilo, grupo alquiltio ($C_{1..6}$) y grupo halo($C_{1..6}$)alquiltio; n es un entero de 0 a 4; y Y es el átomo de un oxígeno o un átomo de azufre.

5. Un controlador de plaga caracterizado por que comprende como ingrediente activo un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3.

6. Un método para controlar plagas caracterizado por que comprende aplicar un controlador de plaga que comprende como ingrediente activo un derivado (tiona) aminoquinazolinona sustituido o una sal del mismo de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3, a los cultivos objetivo o el suelo.

132
~~140~~



413134

SUPERINTENDENCIA Y OFICIO
Radicación : 00000000 00000000 Folios: 143
Fecha (UTC): 2000-11-01 12:37:18
Trámite : 002 PATENTES D 1 REGISTRAR 411 PRESENTAR
Dependencia: 0000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 68,175
FECHA : NOVIEMBRE 1 DE 2000

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	SUCURSAL	CUENTA	No. PAGO	Vr. PAGO
GERMAN CUBILLOS M.	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	BOGOTA	050-00110-6	3053672	608,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	30005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	608,000.00
		TOTAL :	608,000.00

SON: SEISCIENTOS OCHO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____



RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE N° _____

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE

PATENTE DE INVENCION []

MODELO DE UTILIDAD []

- Nombre e identificación del Solicitante []
- Nombre e identificación del Inventor []
- Título o nombre de la Invención []
- Descripción []
- Reivindicaciones []
- Resumen []
- Comprobante de Pago []
- Poder, cuando proceda []
- Copia de la primera solicitud de patente, si reivindica prioridad, señalándola expresamente []
- Firma del solicitante o apoderado []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- Nombre e identificación del peticionario []
- Nombre e identificación del inventor o diseñador []
- Indicación del género de productos para los cuales debe utilizarse []
- Representación gráfica []
- Comprobante de pago []
- Poder, cuando proceda []
- Firma del solicitante o apoderado []

COMPLETA []

INCOMPLETA []


Firma Responsable

Fecha: _____

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5 y 10
Conmutador: 334 12 21-2-3-4
Fax: 281 31 25 e-mail: info@sic.gov.co
Santa Fe de Bogotá D.C. - Colombia

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
PRIMER EXAMEN DE FORMA

EXPEDIENTE 00-83069

Practicado el examen jurídico de acuerdo con lo establecido en el art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- ☐ SI [] NO [X] NO APLICABLE [] Presentó los poderes necesarios en forma correcta (Decisión 344, art. 14-a).
- ☐ SI [] NO [X] NO APLICABLE [] Acreditó, en forma correcta, la existencia y representación de la persona jurídica solicitante (art. 14-c de la Decisión 344; literal g) del art. 4 del Decreto 117/94).
- ☒ SI [x] NO [] NO APLICABLE [] Presentó, en forma correcta, el comprobante de pago por la tasa de presentación establecida (art. 13-f de la Decisión 344 y la Resolución 02 del 4 de Enero del 2000)
- ☒ SI [x] NO [] EXTEMPORANEAMENTE [] Reivindicó prioridad, dentro del plazo y de acuerdo con lo previsto en el Artículo 4 del Convenio de París.
- ☐ SI [] NO [X] NO APLICABLE [] Presentó copia, certificada su conformidad por la Administración que recibió la solicitud de la cual reivindica prioridad, al momento de radicar la solicitud nacional.
- ☐ SI [] NO [X] NO APLICABLE [] Presentó la traducción del capítulo reivindicatorio de la solicitud de la cual se reivindica prioridad (Art. 4, D-3 Convenio de París; Concepto: 5 de enero de 1999 S.I.C.).
- ☒ SI [] NO [x] CUMPLE LOS REQUISITOS JURIDICOS

OBSERVACIONES JURÍDICAS CONVENIO DE PARIS: Deberá presentar copia certificada su conformidad por la Administración que recibió las solicitudes de las cuales reivindica prioridad, en cualquier momento dentro del plazo de tres (3) meses, contados a partir de la fecha de depósito de la solicitud posterior. La omisión de esta formalidad implicará la pérdida del derecho de prioridad.

Debe allegar comprobante de pago por exceso de 150 palabras del extracto de publicación.

En consecuencia, se conceptúa que esta solicitud:

☐ SI [] NO [X] Se ajusta a los aspectos FORMALES indicados en la Decisión 344 y por tanto,

☐ SI [] NO [X] Se recomienda PUBLICAR el extracto correspondiente.

Bogotá, D.C., 7 de Noviembre del 2000

EXAMINADOR JURIDICO.
202022

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia

137

00146

EXAMEN DE FORMA

93100

Radicación No 00-83069

Concepto Técnico No 1761

Clasificación Internacional de Patentes A01N 43/54

Practicado el examen de acuerdo a lo establecido en el Art. 21 de la Decisión 344 se determinó que esta solicitud de Patente de Invención:

- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del inventor (Art.8, Art.13-a).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la identificación correcta del solicitante (Artículo 13-a).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el resumen con el objeto y finalidad de la invención en forma correcta (Art.13-e).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el título o nombre de la invención en forma correcta (Art. 13-b).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la descripción clara y completa de la invención (Art.13-c).
- SI ☐ NO ☐ Contiene los dibujos correctos (Art. 14-c junto con el literal d) del Art. 4 del Dto. 117 del 94).
- SI ☐ NO ☒ Contiene las unidades de medida en el sistema exigido (Art. 14-c junto con el Decreto 3464 del 26 de diciembre de 1980).
- SI ☒ NO ☐ Contiene una o más reivindicaciones, en forma correcta, que precisen la materia para la cual se solicita la protección mediante la patente (Art.13-d).
- SI ☒ NO ☐ Contiene el extracto de acuerdo con el literal c) del artículo 4 del Dto. 117 /94.
- SI ☒ NO ☐ Contiene el arte final del dibujo característico de acuerdo con el literal c) del artículo 4 y el artículo 27 del Dto. 117 /94.
- SI ☒ NO ☐ Contiene la tarjeta del Archivo Temático [formato P-104] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
- SI ☒ NO ☐ Contiene la tarjeta del Archivo de Propietarios [formato P-105] en forma correcta (Art.14-c junto con el literal b) del artículo 4 del Dto. 117 /94).
- SI ☒ NO ☐ CUMPLE LOS REQUISITOS TÉCNICOS

OBSERVACIONES Y OTROS: SI ☒ NO ☐ ver hoja(s) anexa(s)

En el capítulo descriptivo, las unidades de presión, deben estar en el Sistema Internacional de Unidades y expresado con los símbolos correspondientes.

Bogotá, D.C. Noviembre 17 del 2000

EXAMINADOR TÉCNICO
Código 202026

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

00147

EXPEDIENTE 00-83069

AUTO 3942

DISPONE

ARTICULO PRIMERO: Conforme lo establece el artículo 22 de la Decisión 344 de la Comisión del Acuerdo de Cartagena, requiérese al solicitante, para que dentro del plazo de treinta (30) días hábiles siguientes a la fecha de notificación del auto, presente respuesta a las observaciones o complementé los antecedentes señalados en el examen de forma.

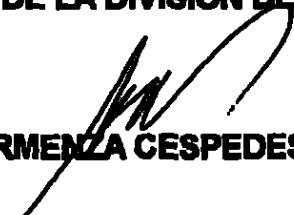
ARTICULO SEGUNDO: Notificar por estado el presente auto, advirtiéndolo que contra el no procede recurso alguno en la vía gubernativa.

NOTIFIQUESE Y CUMPLASE

Dado en Bogotá D.C., a los

28 NOV. 2000

EL JEFE DE LA DIVISION DE NUEVAS CREACIONES,


ALIX CARMONA CESPEDES DE VERGEL

NOTIFICADO POR ESTADO

30 NOV 2000

Bogotá D.C.,

notificado por anotación en estado de esta misma fecha.

VENCIMIENTO NOTIFICACION ESTADO

SOLICITO PRORROGA TERMINO SI _____ NO _____

VENCIMIENTO TERMINO PRORROGA

202022

Carrera 13 No. 27-00 Pisos 5 y 10
Conmutador: 334 12 21
Fax: 281 31 25
Santa Fe de Bogotá, D.C., Colombia