

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-023840- -00005-0000

Fecha: 2012-09-24 14:28:06 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 194

Señor Director

División de Nuevas Creaciones

Superintendencia de Industria y Comercio

Ministerio de Comercio, Industria y Turismo

E. S. D.

Re.: Expediente No. 08 023840

Solicitud de Patente de invención para: “Derivado de anilida del ácido pirazolcarboxílico sustituido o sal del mismo, compuestos intermedios de los mismos, agentes agrohortícolas y métodos para utilización de los mismos” .

Solicitante: NIHON NOHYAKU CO., LTD

RESPUESTA AL EXAMEN DE FONDO

Yo, **Margarita Castellanos Abondano**, identificada como aparece al pie de mi firma, atentamente me permito presentar respuesta al oficio **No.11176** notificado por fijación en lista del 27 de junio de 2012, estando dentro del término legal, en los siguientes términos:

De la solicitud de patente

Su Despacho concluye que el pliego reivindicatorio de la presente solicitud de patente no cumple con las disposiciones del artículo 30 de la Decisión 486. En particular, el Examinador pone de presente lo siguiente:

- “La reivindicación 10 se refiere al método de utilización de un agente agrohortícola que contiene un ingrediente activo de formula I, que comprende una única etapa de tratar la planta objetivo o el suelo con una cantidad eficaz del mencionado agente”.

- “Las reivindicaciones 1-2, 11-12 no son claras ni concisas porque presentan una excesiva complejidad, lo cual dificulta determinar la extensión del objeto que se busca proteger”.
- “La descripción no divulga la invención de manera suficientemente completa para sustentar lo dispuesto en el capítulo reivindicatorio. Existen características estructurales de la formula I que se mencionan en las reivindicaciones, pero no se encuentran soportadas en los ejemplos o cuadros cómo se expuso previamente”.

Con el fin de atender las observaciones formuladas a este respecto, y de acuerdo con el artículo 34 de la Decisión 486, se presenta un nuevo capítulo reivindicatorio conformado por 6 reivindicaciones como sustituto del anteriormente presentado. De tal manera que, las objeciones formuladas a este respecto se deben tener por superadas de la siguiente manera:

- En este nuevo capítulo reivindicatorio, se ha revisado la redacción del mismo con el fin de hacer claridad sobre la materia que se solicita proteger y el alcance de la misma. Específicamente, la nueva reivindicación 1 ha sido limitada significativamente de conformidad con las definiciones para los radicales de la formula (I) propuestas por el Señor Examinador y adicionalmente, se han mantenido las definiciones que se muestran a continuación, las cuales se encuentran debidamente sustentadas en los ejemplos y las tablas del capítulo descriptivo de la presente solicitud:

Definiciones	Sustituyentes	No. Del compuesto en tablas y ejemplos
R ¹	halo C ₁ -C ₆ alquilo	1-157
	C ₁ -C ₆ alcoxi C ₁ -C ₆ alcoximetil	1-146
	fenil C ₁ -C ₆ alcoximetil	1-132
	fenilmetilsustituido	1-417, 1-419, 1-434
	heterociclicarbonil de 5-6 miembros sustituido	1-332, 1-544 to 546
	fenoxi C ₁ -C ₆ alquilocarbonil	
	fenilsulfonil sustituido	1-370
	C ₃ -C ₆ cicloalquilocarbonil	1-124
	C ₁ -C ₆ alquilo C ₃ -C ₆ cicloalquilocarbonil	1-6, 1-349
	fenil C ₃ -C ₆ cicloalquilocarbonil	1-435

	C ₁ -C ₆ alquilocarbonil C ₁ -C ₆ alquilocarbonil C ₁ -C ₆ alcoxycarbonil C ₁ -C ₆ alquilocarbonil	1-373 1-482 1-342
G	C ₃ -C ₈ cicloalquilo C ₁ -C ₆ alquilo	1-471
Y ²	C ₁ -C ₆ alquilotio	1-122

- Con respecto a la definición de “Bn”, se pone de presente a su Despacho que en la descripción de la presente solicitud se señala de manera explícita que “Bn es un grupo bencilo” y por lo tanto, dicho término es claro y se encuentra definido en el pliego descriptivo de la solicitud. De modo que, la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada”.
- Con respecto a la expresión “H2CF3”, se observa que dicho sustituyente se recita para la definición de Y1 del compuesto No. 1-508. Dicho error claramente corresponde a un error de traducción y por lo tanto, se presente un nuevo pliego descriptivo en el cual se ha reemplazado la expresión “H2CF3” por “CH2CF3” (ver texto de solicitud internacional).
- Las reivindicaciones 3-5 y 10-13 no han sido incluidas en el nuevo pliego reivindicatorio.
- La numeración 1a, 7b y similares, ha sido eliminada del nuevo pliego reivindicatorio.

Así entonces, teniendo en cuenta las modificaciones efectuadas al capítulo reivindicatorio, consideramos que las objeciones que por claridad hizo su Despacho quedan superadas ya que el nuevo capítulo reivindicatorio se encuentra redactado en los términos sugeridos por su Despacho y el mismo es ahora claro, conciso y se encuentra debidamente soportado en la descripción de la presente solicitud.

Novedad

Su Despacho concluye que los documentos EP 1006102 (A2) (D2) y US2003187233 (A1) (D3) afectan la novedad de la reivindicación 11 de la presente solicitud de patente.

Asimismo, señala que el documento US656988B1 (D4) afecta la novedad de la reivindicación 13.

En cuanto a las objeciones del examinador deseo poner de presente lo siguiente:

Debido a que las reivindicaciones 11 y 13 no han sido incluidas en el nuevo pliego reivindicatorio de la presente solicitud de patente, es claro que la objeción formulada a este respecto se debe tener por superada.

Nivel inventivo

Su Despacho concluye que el documento US 2004116744A1 (D1) afecta el nivel inventivo de las reivindicaciones 1-9 y 11-13 de la presente solicitud de patente. Su Despacho enuncia:

- “La diferencia entre la invención definida en las reivindicaciones 1 y 11 y los compuestos divulgados en D1 consiste en que no se divulga de manera específica la sustitución G en la posición 3 de la anilina”.
- “Las pruebas comparativas de acción acaricida proporcionadas no demuestran que la mejora técnica en la actividad sea consecuencia de la sustitución G”.
- “Una persona del oficio medianamente versada en la materia que se propusiera el objetivo de obtener derivados de anilida del ácido pirazolcarboxílico alternativos, podría inferir con gran expectativa de éxito, la posibilidad de cambiar el patrón de sustitución de grupo arilo de los derivados de anilida de ácido pirazolcarboxílico descritos en D1 (Página 11, Tabla 1) por ejemplo, incrementando la longitud de cadena alquílica empleada en la sustitución en la posición 3. Llegando así al objeto de la invención por lo que se considera obvia”.

En cuanto a las objeciones del examinador deseo poner de presente lo siguiente:

De acuerdo con el artículo 18 de la Decisión 486:

“Artículo 18.- *Se considerará que una invención tiene nivel inventivo, si para una persona del oficio normalmente versada en la materia técnica*

correspondiente, esa invención no hubiese resultado obvia ni se hubiese derivado de manera evidente del estado de la técnica".

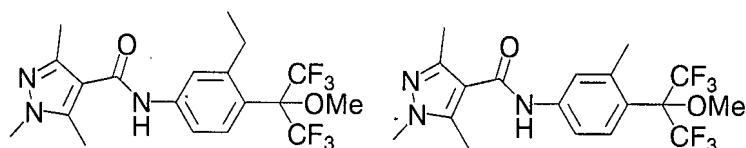
Así entonces, es claro que en la evaluación de nivel inventivo de la presente invención, el documento citado D1 debería revelar sugerencias y enseñanzas claras para el técnico en la materia que lo lleven a obtenerla. Para este fin, el Señor Examinador debe examinar si, de conformidad con dicho documento (el estado de la técnica más cercano), una persona versada en la materia habría o no propuesto las características técnicas que distinguen la invención reivindicada y que permiten alcanzar los resultados obtenidos por dicha invención.

De conformidad con el anterior artículo, se exponen a continuación las razones por las cuales la presente invención posee nivel inventivo frente a las enseñanzas del documento D1:

El problema planteado en la presente solicitud consiste en la necesidad de obtener nuevos compuestos con mayor actividad insecticida o acaricida. Para resolver este problema técnico la solicitud en estudio proporciona un tipo de derivado de anilida del ácido pirazolcarboxílico como se describe en la formula (I) y agentes agrohortícolas que lo contienen, los cuales presentan los efectos deseados.

Ahora bien, con el fin de demostrar que la presente solicitud efectivamente representa un salto tecnológico en comparación con el estado de la técnica, se presenta anexo al presente memorial un ensayo comparativo entre un compuesto de conformidad con el documento D1 y un compuesto de acuerdo con el ejemplo 1-3 de la presente solicitud.

A partir del ensayo comparativo se observa la actividad acaricida de dos compuestos y se demuestra el efecto mejorado debido a la presencia de la sustitución G en la posición 3 de la anilina en los compuestos acá reivindicados. El compuesto A se preparó de acuerdo con el método descrito en la descripción de la presente solicitud o D1. Mientras que el compuesto A se encuentra cubierto por el alcance de las reivindicaciones de D1, el mismo no se encuentra incluido dentro de las reivindicaciones de la presente solicitud.

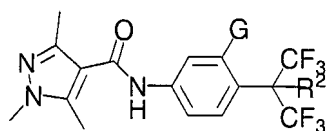


Ejemplo 1-3

Compuesto A

El compuesto A se diferencia del compuesto del ejemplo 1-3 debido a la presencia del grupo metilo en lugar del grupo etilo en la posición 3 de la anilina. Por lo tanto, el compuesto del ejemplo 1-3 de la presente solicitud se considera el compuesto más cercano en estructura a aquellos descritos en D1. El compuesto del ejemplo 1-3 presenta actividad A en todas las concentraciones de 5ppm, 50 ppm y 500 ppm. En contraste, el compuesto A presentó actividad A en una concentración de 500ppm y una actividad E a concentraciones de 5 ppm y 50 ppm. De tal manera que, el compuesto del ejemplo 1-3 mostró una actividad aproximadamente 100 veces mayor a la presentada por el compuesto A.

Asimismo, los compuestos tales como Nos. 1-45 (G=n-Pr: C3), 1-47 (G=n-Pr: C3), 1-89 (G=n-Bu: C4), 1-123 (G=i-Bu: C4), 1-155 (G=i-Bu: C4), 1-234 (G=(CH₂)₄Me: C5), 1-246 (G=CH₂CMe₃: C5), 1-260 (G=CH₂CH(Me)Et: C5), 1-270 (G=CH₂CHEt₂: C6), 1-294 (G=(CH₂)₇Me: C8) y similares presentan una actividad acaricida "A" (mortalidad corregida 100%) en una concentración de 5 ppm (ver página 80, línea 10 hasta página 81, línea 2 de la solicitud internacional).



No. 1-45	(R ² =H,	G=n-Pr: C3)
No. 1-47	(R ² =OMe,	G=n-Pr: C3)
No. 1-89	(R ² =H,	G=n-Bu: C4)
No. 1-123	(R ² =H,	G=i-Bu: C4)
No. 1-155	(R ² =OMe,	G=i-Bu: C4)
No. 1-234	(R ² =H,	G=(CH ₂) ₄ Me: C5)
No. 1-246	(R ² =H,	G=CH ₂ CMe ₃ : C5)
No. 1-260	(R ² =OMe,	G=CH ₂ CH(Me)Et: C5)
No. 1-270	(R ² =H,	G=CH ₂ CHEt ₂ : C6)
No. 1-294	(R ² =H,	G=(CH ₂) ₇ Me: C8)

De los resultados del ensayo comparativo y aquellos mencionados en la descripción de la presente solicitud, es claro el efecto mejorado en la actividad acaricida de los compuestos reclamados frente a compuestos similares del estado de la técnica.

De esta manera, es claro que la materia reivindicada en la presente solicitud de patente

se debe tener como inventiva, ya que tal y como lo señala el Manual Andino de Patentes un compuesto tiene nivel inventivo cuando:

“- presenta un efecto inesperado, (es el caso más frecuente sobre todo si el compuesto es similar a otros del estado de la técnica. El efecto inesperado puede ser completamente diferente de los descritos para los compuestos similarmente conocidos, o bien ser igual pero con una mejora en los resultados”.

Así entonces, teniendo en cuenta que las enseñanzas de la anterioridad D1 citada por su Despacho no llevan a un técnico versado en la materia a obtener los compuestos acá reivindicados toda vez que no enseña ni sugiere como un todo las características técnicas esenciales de los mismos (sustitución con un grupo metil en posición 3 de la anilina y el efecto inesperado que proporcionaría dicha sustitución), es claro que a partir de dicho documento no era posible para un técnico medio obtener de manera obvia y/o evidente la presente invención. Lo anterior, si se tiene en cuenta que para el estudio de nivel inventivo el Examinador no puede adoptar la posición de un inventor y que además no puede partir de la solución dada sino simplemente de lo que expresamente revelen el o los documentos más cercanos del estado del arte, que en el presente caso es D1.

Dado que la presente solicitud cumple con las disposiciones de los artículos 30 y 18 de la Decisión 486, respetuosamente solicito a ese Despacho que se proceda con la concesión de la presente solicitud.

Nueva solicitud divisional.

Adicionalmente, de conformidad con los lineamientos del artículo 36 de la Decisión 486, que permite al solicitante en cualquier momento del trámite dividir su solicitud, sin ampliar el objeto de la invención inicialmente solicitado, me permito presentar una (1) solicitud divisional cuyo objeto es proteger derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos específicos.

La divisional se beneficiará de la fecha de prioridad, de acuerdo con lo establecido en el artículo 36 de la Decisión 486.

El nuevo capítulo descriptivo de la solicitud divisional tendría el siguiente título: **“Derivado de anilida del ácido pirazolcarboxílico sustituido o sal del mismo y composiciones**

agrohortícolas”.

Puesto que se han atendido a cabalidad las observaciones hechas por su Despacho sobre la presente solicitud de patente, respetuosamente solicito se continúe con su tramitación.

Anexos

- Nuevo pliego reivindicatorio correspondiente a la solicitud inicial, conformado por seis (6) reivindicaciones.
- Nuevo pliego descriptivo de la solicitud inicial
- Capitulo descriptivo correspondiente a la solicitud divisional.
- Nuevo pliego reivindicatorio correspondiente a la solicitud divisional, conformado por ~~cuatro~~ (4) reivindicaciones.
- Formulario de división de la solicitud de patente.
- Comprobantes de pago por concepto de presentación de nueva solicitud.
- Copia del poder otorgado por **NIHON NOHYAKU CO., LTD** a la Doctora Margarita Castellanos.
- Ensayo comparativo.

Señor Director,


Margarita Castellanos Abondano

C.C. No. **39.779.654** de Usaquén

T.P.A. No. **70.819** de **C.S.J.**

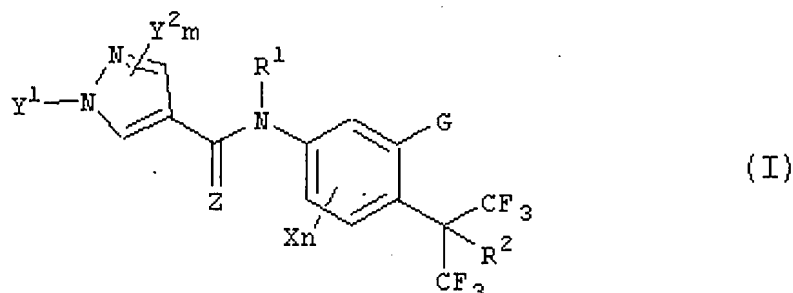
Calle 94 A No. 7 A-09 – Bogotá, D.C.

Tel.: 7560770

Bogotá D.C.

REIVINDICACIONES

1.- Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I):



en donde

R¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁-C₈, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, un grupo alquenilcarbonilo de C₂-C₆, un grupo alquenilo de C₂-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ metilo, un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ metilo, un grupo alqueniloxi de C₂-C₆ metilo, un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxi de C₁-C₆ metilo, un grupo fenilalcoxi de metilo, un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxicarbonilo de C₁-C₆, un grupo haloalcoxicarbonilo de C₁-C₆, un grupo alqueniloxicarbonilo de C₂-C₆, un grupo alquiltiocarbonilo de C₁-C₆, un grupo fenilmetilo, un grupo fenilmetilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de un átomo halógeno, un grupo nitro y un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo fenilcarbonilo, un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de un átomo halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, un grupo alcóxido de C₁-C₆, un grupo heterociclilcarbonilo sustituido de 5 o 6 miembros conteniendo 1 o 2 heteroátomos seleccionados de un átomo de hidrógeno o de azufre, que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo fenoxicarbonilo, un grupo fenoxialquilcarbonilo de C₁-C₆, un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de un átomo halógeno, un grupo dialquilaminotio de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, un grupo cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, un grupo alquil de C₁-C₆ cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, un grupo alquilcarboniloxi de metilo, un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o un grupo alcoxicarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆; R² es un átomo de hidrógeno, un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo alcóxido de C₁-C₆, un grupo haloalcóxido de C₁-C₆,

G es un grupo alquilo de C₂-C₁₀, un grupo alquenilo de C₃-C₁₀, un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆;

X puede ser igual o diferente y es un átomo de hidrógeno, un átomo halógeno o un grupo alquilo de C₁-C₆;

Y¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆ o un grupo alquenilo de C₂-C₆;

Y² puede ser igual o diferente y es un átomo halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆ o un grupo alquiltio de C₁-C₆;

m es 1 o 2; y n es un entero de valor 1-3, o una sal del mismo.

2.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado porque R¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo halo alquil C₁-C₆, un grupo alquilcarbonil C₁-C₆, un grupo halo alquilcarbonilo C₁-C₆, un grupo alquenilcarbonilo C₂-C₆, un grupo alquenilo C₂-C₆, un grupo alcoxi C₁-C₁₀ de metilo, un grupo halo alcoxi C₁-C₆ de metilo, un grupo alqueniloxi C₂-C₆ de metilo, un grupo alcoxi C₁-C₆ alcoxi C₁-C₆ metilo, un grupo fenil alcoxi C₁-C₆ metilo, un grupo alcoxycarbonil C₁-C₁₆, un grupo alcoxy C₁-C₆ alcoxycarbonil C₁-C₆, un grupo halo alcoxycarbonil, un grupo alqueniloxycarbonil C₂-C₆, un grupo alquiltiocarbonil C₁-C₆, un grupo fenil metil, un grupo fenil metal sustituido que presenta un anillo con uno o más sustituyentes iguales o distintos seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo nitro y un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo fenilcarbonilo, un grupo fenilcarbonilo sustituido con uno o más substituentes iguales o distintos en el anillo seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo nitro y un grupo alquilo C₁-C₆, un grupo haloalquilo C₁-C₆, y un grupo alcoxi C₁-C₆, un grupo heterociclilcarbonil de 5 o 6 miembros con 1 o 2 heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno y un átomo de azufre, presentando en el anillo uno o más sustituyentes iguales o distintos seleccionados de alquilo C₁-C₆, un grupo fenoxycarbonil, un grupo fenoxi alquilcarbonil C₁-C₆, un grupo fenilsulfonil sustituido presentando en el anillo uno o más sustituyentes iguales o distintos seleccionados de un átomo de halógeno, un grupo alquil C₁-C₆ aminotio en donde los grupos alquilo son iguales o distintos, un grupo cicloalquil C₃-C₆ carbonil, un grupo alquil C₁-C₆ cicloalquil C₃-C₆ carbonil, un grupo fenil cicloalquil C₃-C₆ carbonil, un grupo alcoxi C₁-C₆ alquil C₁-C₆ carbonil, un grupo alquilC₁-C₆ carbonil, o un grupo alcoxycarbonilC₁-C₆ alquilcarbonil C₁-C₆, o una sal del mismo.

3.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con

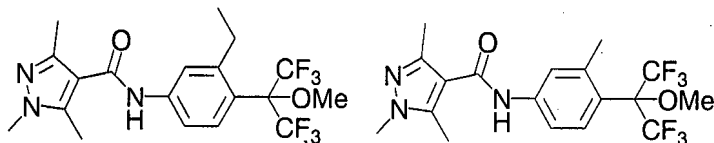
la reivindicación 1, caracterizado además porque Z es un átomo de oxígeno; Y¹ es un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o un grupo alquenilo de C₂-C₆; y Y² es un átomo halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o 31f) un grupo alquiltio de C₁-C₆, o una sal del mismo.

4.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque R¹ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ metilo, un grupo haloalcoxi de metilo, un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₁₆, un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆, o un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆; R² es un átomo de hidrógeno, o un grupo alcoxilo de C₁-C₆; G es un grupo alquilo de C₂-C₁₀; Z es un átomo de oxígeno; X es un átomo de hidrógeno; Y¹ es un grupo alquilo de C₁-C₆; e Y² puede ser igual o diferente y es un átomo halógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, o un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o una sal del mismo.

5.- Una composición agrohortícola que comprende un derivado pirazolcarboxanilida sustituido de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 o una sal del mismo.

6.- La composición agrohortícola de conformidad con la reivindicación 5, caracterizada porque es un insecticida o acaricida agrohortícola.

Compuestos ensayados



Ejemplo 1-3 Compuesto A

El compuesto A se preparó de acuerdo con el método descrito en la descripción de la presente solicitud o D1 (US 2004/0116744 A1).

Experimento 1

Acción acaricida del acaro araña de dos manchas (Tetranychusurticae)

El disco de lámina de poroto riñón con un diámetro de 2 cm fue colocado en el papel de filtro humedecido. Se inocularon diez hembras adultas de arañuela de dos manchas en cada disco de hoja, y fue rociado con 50 ml de solución de prueba, preparada diluyendo una formulación que contiene cada uno de los compuestos arriba mencionados como ingrediente activo ajustando cada una de las concentraciones dadas.. Dos días después del tratamiento, las arañuelas sobrevividas fueron contadas. La mortalidad corregida fue calculada por la ecuación siguiente y la actividad acaricida fue evaluada según el criterio ilustrado a continuación. El experimento fue realizado con dos copias bajo la condición de 25°C.

$$\text{Mortalidad corregida (\%)} = \frac{\text{Número de ácaros sobrevivientes en el grupo sin tratar} - \text{Número de ácaros sobrevivientes en el grupo tratado}}{\text{Número de ácaros sobrevivientes en el grupo sin tratar}} \times 100$$

Criterio:

A --- Mortalidad corregida 100%

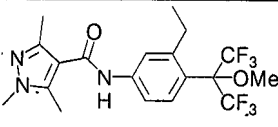
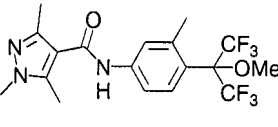
B --- Mortalidad corregida 99%-90%

C --- Mortalidad corregida 89%-80%

D --- Mortalidad corregida 79%-50%.

Resultados

Tabla 1

Compuesto de ensayo	Conc. (ppm)	Araña de dos manchas
 Ejemplo 1-3	500	A
	50	A
	5	A
 Compuesto A	500	A
	50	E
	5	E

5

CAMPO TECNICO

La presente invención se refiere a derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos o sales de los mismos, compuestos intermedios de los mismos, y agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas o acaricidas, conteniendo dichos compuestos como un ingrediente activo y método para utilización de los mismos.

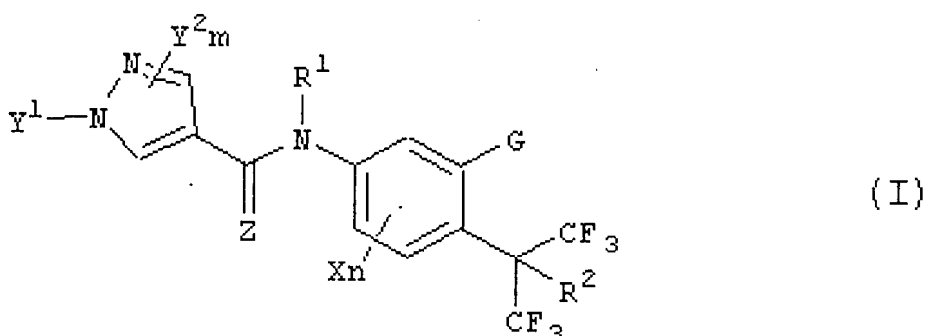
ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Convencionalmente, los derivados de pirazolcarboxamida sustituidos similares a la presente invención son conocidos por ser útiles como insecticidas agrohortícolas, fungicidas o acaricidas (por ejemplo, JP-A-2003-48878, JP-A-2004-189738 y JP-A-2004-269515). En JP-A-2003-48878, se describen los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos. Sin embargo, principalmente se limitan los sustituyentes en la fracción de anilina a sustituyentes de posición 2, el sustituyente de la posición 3 es exclusivamente del grupo metilo, y el compuesto descrito en la presente invención, en donde el grupo alquilo que tiene 2 o más átomos de carbono se introduce en la posición 3 no es incluido ni siquiera en su lista de compuestos. Además, la forma de metilo de posición 3 concretamente descrita en la misma no muestra una actividad acaricida. En la JP-A-2004-189738, se describen los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos. Sin embargo, se limitan los sustituyentes en la fracción de anilina al grupo alcoxilo, grupo alquiltio y grupo alquilamino, y el compuesto descrito en la presente invención, en donde el grupo alquilo que tiene 2 o más átomos de carbono que se introduce directamente en la posición 3 no es incluido ni siquiera en su lista de compuestos. En la JP-A-2004-269515, se describen los derivados de pirazolcarboxamida sustituidos. Sin embargo, sólo se describe un compuesto amida con la heterocicilil amina, y no se describen los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos de la presente invención.

En la elaboración de cultivos en los campos agrícolas y hortícolas, los daños causados por las plagas de insecto son serios aún, y se desea el desarrollo de nuevos agentes agrohortícolas, particularmente el desarrollo de insecticidas y acaricidas debido a la generación de plagas de insecto resistentes a los agentes conocidos, y similares. Debido a que se requieren diversos mecanismos de economía de labor de granja debido al número creciente de la población trabajadora de granja envejecida, también se exige la creación de agentes agrohortícolas con propiedades convenientes para tal economía de trabajo de labor de granja, particularmente respecto a insecticidas y acaricidas.

Los presentes inventores han realizado extensos estudios en el desarrollo de nuevos agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas y acaricidas y como resultado, han encontrado que entre la amplia escala de compuestos descritos en el documento anterior mencionado, un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) en el cual un anillo de pirazol es seleccionado como la fracción de ácido carboxílico heterocíclico y un sustituyente específico que es introducido en la fracción de anilina en la posición 3, demuestra un efecto de control excelente como acaricida, no predicho en absoluto del contenido descrito en las referencias de la técnica anterior mencionada. Además, los inventores han encontrado que un compuesto intermedio de dicho compuesto, es decir unos derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II), y ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico o sal de mismo son compuestos nuevos, desconocidos en las referencias anteriores, y son útiles como compuestos intermedios para fabricar diversos derivados que tienen actividades fisiológicas como compuestos farmacéuticos, plaguicidas y lo similar, y así completaron la presente invención.

Concordantemente, la presente invención se refiere a derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I):



En donde

R¹ es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C₁-C₈, 3a) un
 5 grupo haloalquilo de C₁-C₆, 4a) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo
 haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 6a) un grupo alquenilcarbonilo de C₂-C₆, 7a) un grupo
 haloalquenilcarbonilo de C₂-C₆, 8a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 9a)
 un grupo cicloalquilo de C₃-C₆, 10a) un grupo halocicloalquilo de C₃-C₆, 11a) un grupo
 cicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-C₆, 12a) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-
 10 C₆, 13a) un grupo alquenilo de C₂-C₆, 14a) un grupo haloalquenilo de C₂-C₆, 15a) un grupo
 alquinilo de C₂-C₆, 16a) un grupo haloalquinilo de C₂-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-C₁₀
 alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 19a) un grupo
 alqueniloxi de C₂-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxi de C₁-C₆ alquilo
 de C₁-C₆, 21a) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 22a) un grupo haloalquiltio de
 15 C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 23a) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 24a) un
 grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 25a) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆
 alquilo de C₁-C₆, 26a) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 27a) un grupo
 monoalquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 28a) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alquilo
 de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 29a) un grupo fenilalcoxi
 20 de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ sustituido
 que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a)
 un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e)
 un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de
 C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo
 25 alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo
 de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆,
 o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₁₆, 32a) un
 grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 33a) un grupo haloalcoxicarbonilo de C₁-
 30 C₆, 34a) un grupo alqueniloxicarbonilo de C₂-C₆, 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C₁-C₆,
 36a) un grupo monoalquilaminocarbonilo de C₁-C₆, 37a) un grupo dialquilaminocarbonilo
 de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 38a) un grupo

- alcoxicarbonilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 39a) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 40a) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 41a) un grupo cianoalquilo de C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b)
- 5 un grupo ciano, c) un grupo nitro d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo
- 10 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un
- 15 grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 46a) un grupo
- 20 heterociclilcarbonilo, 47a) un grupo heterociclilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k)
- 25 un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 48a) un grupo fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes
- 30 seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un haloalquiltio de C₁-C₆

grupo, j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 50a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 , 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 54a) un grupo dialquifosfono de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 55a) un grupo dialquifosfonotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 56a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcoxicarbonil de C_1-C_6 aminotio de C_1-C_6 , 57a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcoxicarbonil de C_1-C_6 alquilaminotio de C_1-C_6 , 58a) un grupo dialquilaminotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 60a) un grupo halocicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 61a) un grupo alquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 62a) un grupo haloalquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo

- alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo
- 5 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) grupo un alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 65a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 66a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f)
- 10 un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo
- 15 alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 67a) un grupo cicloalquil de C₃-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 69a) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 70a) un grupo fenoxialcoxycarbonilo de C₁-C₆, 71a) un grupo fenoxialcoxycarbonilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un
- 20 grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo
- 25 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 72a) un grupo alquilcarboniloxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 73a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o 74a) un grupo alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆;

- R² es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 3b) un grupo
- 30 alquilo de C₁-C₆, 4b) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 5b) un grupo ciano, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, 8b) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, 9b) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 10b) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃,

- 11b) un grupo alquiltio de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 12b) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 13b) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 14b) un grupo haloalquilsulfinil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 15b) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 17b) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 18b) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 19b) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , 20b) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , 21b) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , 22b) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , 23b) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 24b) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , 25b) un grupo amino, 26b) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , 27b) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 28b) un grupo fenoxilo, 29b) un grupo fenoxilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 32b) un grupo fenilsulfinilo, 33b) un grupo fenilsulfinilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 .

de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆,
 o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34b) un grupo fenilsulfonilo, 35b) un grupo
 fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o
 5 diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d)
 un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆,
 g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio
 de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, l) un
 grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo
 10 monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo
 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 36b) un grupo
 fenilalcoxilo de C₁-C₆, o 37b) un grupo fenilalcoxilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el
 anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo
 halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo
 15 haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h)
 un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfonilo de
 C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un
 grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo
 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo
 20 alcoxycarbonilo de C₁-C₆;

G es 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo de C₂-C₁₀, 3c)
 un grupo alquenilo de C₃-C₁₀, 4c) un grupo haloalquenilo de C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquinilo
 de C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquinilo de C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀, 8c) un
 grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes
 25 iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆,
 y c) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 9c) un cicloalquenilo de C₃-C₁₀, 10c) un grupo
 cicloalquenilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales
 o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆, y c) un
 grupo haloalquilo de C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆, o 12c) un
 30 grupo halocicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆;

Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X puede ser igual o diferente y es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, 3d) un grupo ciano, 4d) un grupo nitro, 5d) un grupo alquilo de C₁-C₆, o 6d) un grupo haloalquilo de C₁-C₆;

Y¹ es 1e) un átomo de hidrógeno, 2e) un grupo alquilo de C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 4e) un grupo alquenilo de C₂-C₆, 5e) un grupo haloalquenilo de C₂-C₆, 6e) un grupo alquinilo de C₂-C₆, 7e) un grupo haloalquinilo de C₂-C₆, 8e) un grupo alcoxi de C₁-C₆, 9e) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆, 10e) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, 11e) un grupo cicloalquilo de C₃-C₆, 12e) un grupo halocicloalquilo de C₃-C₆, 13e) un grupo cicloalquil de C₃-C₆, 14e) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆, 15e) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 16e) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 17e) un grupo alquiltio de C₁-C₆, 18e) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, 19e) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆, 20e) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆, 21e) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆, 22e) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆, 23e) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, 24e) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 25e) un grupo fenilo, 26e) un grupo fenilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxido de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxido de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes., y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆;

Y² puede ser el mismo o diferente y es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 3f) un grupo ciano, 4f) un grupo nitro, 5f) un grupo hidroxilo, 6f) un grupo mercapto, 7f) un grupo amino, 8f) un grupo carboxilo, 9f) un grupo alquilo de C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 11f) un grupo alquenilo de C₂-C₆, 12f) un grupo haloalquenilo de C₂-C₆, 13f) un grupo alquinilo de C₂-C₆, 14f) un grupo haloalquinilo de C₂-C₆, 15f) un grupo trialquilsilil de C₁-C₆, 16f) un grupo fenilalquinilo de C₂-C₆, 17f) un grupo alcoxi de C₁-C₆

- alcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 18f) un grupo hidroxialquilo de C_1-C_6 , 19f) un grupo alquilcarbonilo de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 20f) un grupo cicloalquilo de C_3-C_6 , 21f) un grupo halocicloalquilo de C_3-C_6 , 22f) un grupo cicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 23f) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 24f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , 25f) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , 26f) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_6 , 27f) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_6 , 28f) un grupo fenilalcoxilo de C_1-C_6 , 29f) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 30f) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 31f) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , 32f) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , 33f) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , 34f) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , 35f) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 36f) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , 37f) un grupo alquiltio de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 38f) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 39f) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 40f) un grupo haloalquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 41f) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 42f) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 43f) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , 44f) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 45f) un grupo fenilamino, 46f) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 47f) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 48f) un grupo fenilo, 49f) un grupo fenilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 50f) un grupo fenoxilo, 51f) un grupo fenoxilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 ,

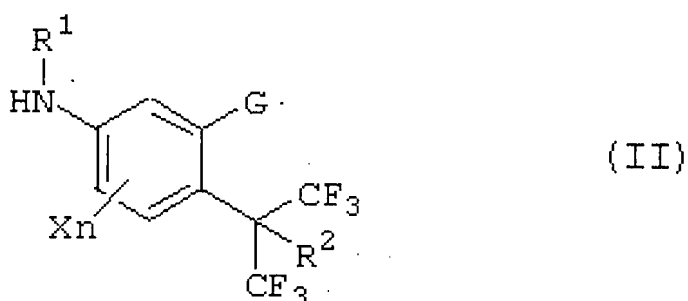
- o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 52f) un grupo heterocíclico, o 53f) un grupo heterocíclico sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d)
 5 un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 ,
 g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 ;

m es 1 ó 2; y

n es un entero de valor 1-3,

las sales del mismo y agentes agrohortícolas que contienen el compuesto como un ingrediente activo, y métodos de utilización del mismo.

- 15 Adicionalmente, la presente invención se refiere también a derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II), los cuales son compuestos intermedios para el mismo:



En donde

- R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 3a) un
 25 grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 4a) un grupo alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 6a) un grupo alquenilcarbonilo de C_2-C_6 , 7a) un grupo haloalquenilcarbonilo de C_2-C_6 , 8a) un grupo alquilcarbonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 9a) un grupo cicloalquilo de C_3-C_6 , 10a) un grupo halocicloalquilo de C_3-C_6 , 11a) un grupo cicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 12a) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-
 30 C_6 , 13a) un grupo alquenilo de C_2-C_6 , 14a) un grupo halo alquenilo de C_2-C_6 , 15a) un grupo alquinilo de C_2-C_6 , 16a) un grupo haloalquinilo de C_2-C_6 , 17a) un grupo alcoxi de C_1-C_{10} alquilo de C_1-C_6 , 18a) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 19a) un grupo

- alqueniloxi de C₂-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 21a) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 22a) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 23a) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 24a) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 25a) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 26a) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 27a) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 28a) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 29a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₁₆, 32a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 33a) un grupo haloalcóxicarbonilo de C₁-C₆, 34a) un grupo alqueniloxicarbonilo de C₂-C₆, 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C₁-C₆, 36a) un grupo monoalquilaminocarbonilo de C₁-C₆, 37a) un grupo dialquilaminocarbonilo de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 38a) un grupo alcóxicarbonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 39a) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 40a) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆, 41a) un grupo cianoalquilo de C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes

seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 46a) un grupo heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 48a) un grupo fenoxycarbonilo, 49a) un grupo fenoxycarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 50a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 , 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y

- p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , 5 g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 54a) un grupo dialquifosfono de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 55a) un grupo dialquifosfonotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 56a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcóxicarbonilaminotio de C_1-C_6 , 57a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcóxicarbonil de C_1-C_6 alquilaminotio de C_1-C_6 , 58a) un grupo dialquilaminotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 60a) un grupo halocicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 61a) un grupo alquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 62a) un grupo haloalquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 65a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 66a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo

- haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 67a) un grupo cicloalquil de C₃-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 69a) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 70a) un grupo fenoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 71a) un grupo fenoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 72a) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 73a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o 74a) un grupo alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆;

- R² es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 3b) un grupo alquilo de C₁-C₆, 4b) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 5b) un grupo ciano, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, 8b) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, 9b) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 10b) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 11b) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 12b) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 13b) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 14b) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 15b) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 17b) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 18b) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 19b) un grupo alquiltio de C₁-C₆, 20b) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, 21b) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, 22b) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, 23b) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 24b) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 25b) un grupo amino, 26b) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, 27b) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 28b) un grupo fenoxilo, 29b) un grupo fenoxilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo

- halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 32b) un grupo fenilsulfinilo, 33b) un grupo fenilsulfinilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más, sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34b) un grupo fenilsulfonilo, 35b) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 36b) un grupo fenilalcoxilo de C₁-C₆, o 37b) un grupo fenilalcoxilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el

anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno., b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆;

G es 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo de C₂-C₁₀, 3c) un grupo alquenilo de C₃-C₁₀, 4c) un haloalquenilo de C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquinilo de C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquinilo de C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀, 8c) un grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆, y c) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 9c) un grupo cicloalquenilo de C₃-C₁₀, 10c) un grupo cicloalquenilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆, y c) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆, o 12c) un grupo halocicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆;

X puede ser igual o diferente y es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, 3d) un grupo ciano, 4d) un grupo nitro, 5d) un grupo alquilo de C₁-C₆, o 6d) un grupo haloalquilo de C₁-C₆;

n es un entero de valor 1-3,

las sales del mismo y ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico y una sal del mismo.

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

En las definiciones de un derivado pirazolcarboxanilida sustituido de la fórmula (I) y un derivado de la anilina sustituida de la fórmula (II) de la presente invención, "halo", "alquilo de C₁-C₆", "alcoxilo de C₁-C₆", "alquenilo de C₂-C₆", "alquinilo de C₂-C₆" o un "grupo heterocíclico", y lo similar en cada uno de sustituyentes tiene el significado siguiente.

El "halo" o el "átomo de halógeno" significa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de iodo o un átomo de flúor.

El "alquilo de C_1-C_6 " es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 2-etilbutilo y lo similar.

El "alquilo de C_1-C_8 " es lineal o alquilo de cadena ramificada que tiene 1 a 8 átomos de carbono, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo y lo similar.

El "alquilo de C_2-C_{10} " es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 10 átomos de carbono, tal como etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, 1-etilpropilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo, n-nonilo, n-decilo y lo similar.

El "cicloalquilo de C_3-C_6 " es alquilo cíclico que tiene 3 a 6 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y lo similar.

El "cicloalquilo de C_3-C_8 " es alquilo cíclico que tiene 3 a 8 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclooctilo y lo similar.

El "cicloalquilo de C_3-C_{10} " es alquilo cíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclooctilo, ciclodecilo y lo similar.

El "cicloalquenilo de C_3-C_{10} " es alquenilo cíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, tal como ciclopropenilo, ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclooctenilo, ciclodecenilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_3 " es alcoxilo cuya fracción alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 3 átomos de carbono, tal como metoxilo, etoxilo, propoxilo, isopropoxilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_6 " es alcoxilo cuya fracción de alquilo es "alquilo de C_1-C_6 " indicado precedentemente, tal como etoxilo, metoxilo, etoxilo, n-propoxilo, i-propoxilo, n-butoxilo, isobutoxilo, s-butoxilo, t-butoxilo, n-pentiloxilo, isopentiloxilo, neopentiloxilo, t-pentiloxilo, 2-metilbutoxilo, 1-etilpropoxilo, hexiloxilo, 2-etilbutoxilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_{10} " el donde su fracción alquilo de alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 10 átomos de carbono, tal como metoxilo, etoxilo, n-propxilo, i-propxilo, n-butoxilo, isobutoxilo, s-butoxilo, t-butoxilo, n-pentiloxilo, isopentiloxilo, neopentiloxilo, t-pentiloxilo, 2-metilbutoxilo, 1-etilpropxilo, hexilxilo, 2-etilbutoxilo, n-heptiloxilo, n-octiloxilo, 2-etilhexilxilo, n-nonilxilo, n-deciloxilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_{16} " es alcoxilo cuya fracción alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 16 átomos de carbono, tal como metoxilo, etoxilo, n-propxilo, i-propxilo, n-butoxilo, isobutoxilo, s-butoxilo, t-butoxilo, n-pentiloxilo, isopentiloxilo, neopentiloxilo, t-pentiloxilo, 2-metilbutoxilo, 1-etilpropoxilo, hexiloxilo, 2-etilbutoxilo, n-heptiloxilo, n-octiloxilo, 2-etilhexiloxilo, n-noniloxilo, n-deciloxilo, n-undeciloxilo, n-dodeciloxilo, n-trideciloxilo, n-tetradeciloxilo, n-pentadeciloxilo, n-hexadeciloxilo y lo similar.

El "alquenilo de C_2-C_6 " es alquenilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 6 átomos de carbono que tiene por lo menos un enlace doble tal como vinilo, 1-propenilo, alilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-pentenilo, 2-metil-1-propenilo, 2,4-pentadienilo, 3-hexenilo y lo similar.

El "alquenilo de C_3-C_{10} " es alquenilo de cadena lineal o ramificada que tiene 3 a 10 átomos de carbono que tienen por lo menos un enlace doble tal como 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-pentenilo, 2,4-pentadienilo, 3-hexenilo, 3-heptenilo, 3-octenilo, 3-nonenilo, 3-decenilo y lo similar.

El "alquinilo de C_2-C_6 " es alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 6 átomos de carbono que tiene por lo menos un enlace triple tal como etinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 2-pentinilo, 3-hexinilo y lo similar.

El "alquinilo de C_3-C_{10} " es alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene 3 a 10 átomos de carbono que tienen un enlace triple por lo menos como 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 2-pentinilo, 3-hexinilo, 3-heptinilo, 3-octinilo, 3-noninilo, 3-decinilo y lo similar.

Los números en " C_2-C_6 ", " C_3-C_{10} " y lo similar demuestra la escala de números de átomo de carbono tal como 2 a 6 átomos de carbono y 3 a 10 átomos de carbono.

Además, las definiciones antedichas se pueden aplicar a los grupos en donde los sustituyente indicados precedentemente están conectados. Por ejemplo,

"haloalquilo de C₁-C₆" significa grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono que se sustituyen por el mismo o diferente o los átomos más halógenos tal como clorometilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 3-cloropropilo, 2-cloro-1,1-dimetiletilo, 1-bromo-1-metiletilo, difluorometil, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 5 perfluorohexilo y lo similar.

Un "grupo heterocíclico y "Un heterociclilo" son grupos heterocíclicos de 5 o 6 miembros que poseen uno o más heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno que incluye, por ejemplo, grupo piridilo, grupo piridina-N-óxido, los grupo pirimidinilo, grupo furilo, grupo tetrahydrofurilo, grupo 10 tienilo, grupo tetrahydrotienilo, grupo tetrahydropiranilo, grupo tetrahydrotiopiranilo, grupo oxazolilo, grupo isoxazolilo, grupo oxadiazolilo, grupo tiazolilo, grupo isotiazolilo, grupo tiadiazolilo, grupo imidazolilo, grupo triazolilo y grupo pirazolilo.

Una sal de un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) de la presente invención incluye una sal de un metal alcalino (litio, sodio, 15 potasio, etc.); una sal de un metal alcalino térreo (calcio, magnesio, etc.); una sal de amonio; y una sal de una amina orgánica (metilamina, trietilamina, dietanolamina, piperidina, piridina, etc.), o una sal de adición ácida. Por ejemplo, la sal de adición ácida incluye un carboxilato como el acetato, el propionato, el oxalato, trifluoroacetato, benzoato y lo similar; un sulfonato tal como metansulfonato, trifluorometansulfonato, p- 20 toluensulfonato y lo similar; una sal ácida inorgánica tal como un clorhidrato, un sulfato, un nitrato, un carbonato y lo similar.

En los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I) de la presente invención, R¹ es preferentemente 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C₁-C₆, 3a) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 4a) un grupo 25 alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 6a) un grupo alquenilcarbonilo de C₂-C₆, 13a) un grupo alquenilo de C₂-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 19a) un grupo alqueniloxi de C₂-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 29a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi de 30 C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxido de C₁-

- C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₁₆, 32a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34a) un grupo alqueniloxycarbonilo de C₂-C₆, 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 46a) un grupo heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo

son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 48a) un grupo fenóxicarbonilo, 49a) un grupo fenóxicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 50a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 , 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 58a) un grupo dialquilaminotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 61a) un grupo alquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo

alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 65a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 66a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 73a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o 74a) un grupo alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1a) un átomo de hidrógeno, 4a) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₁₆, 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆ o 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆;

R² es preferentemente 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxilo de C₁-C₆ o 8b) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1b) un átomo de hidrógeno o 7b) un grupo alcoxilo de C₁-C₆;

G es preferentemente 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀, 3c) un grupo alquenilo de C₃-C₁₀, o 11c) un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀.

X es preferentemente 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, o 5d) un grupo alquilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1d) un átomo de hidrógeno.

Z es preferentemente átomo de un oxígeno.

Y¹ es preferentemente 2e) un grupo alquilo de C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o 4e) un grupo alqueno de C₂-C₆, y más preferentemente 2e) un grupo alquilo de C₁-C₆;

Y² es preferentemente 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 5 9f) un grupo alquilo de C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o 31f) un grupo alquilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 9f) un grupo alquilo de C₁-C₆, o 10f) un grupo haloalquilo de C₁-C₆.

m es preferentemente 2.

Adicionalmente, una sal de un derivado de anilina sustituido representada 10 por la fórmula (II) es preferentemente una sal de adición ácida, que incluye, por ejemplo, un carboxilato tal como acetato, propionato, oxalato, trifluoroacetato, benzoato y lo similar; un sulfonato tal como metansulfonato, trifluorometansulfonato, p-toluensulfonato y lo similar; una sal ácida inorgánica tal como un clorhidrato, un sulfato, un nitrato, un carbonato y lo similar.

15 Una sal de ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico de la presente invención incluye una sal de un metal alcalino (litio, sodio, potasio, etc.); una sal de un metal alcalino térreo (calcio, magnesio, etc.); una sal de amonio; y una sal de una amina orgánica (metilamina, trietilamina, dietanolamina, piperidina, piridina, etc.).

Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula 20 (I) o un compuesto intermedio del mismo, es decir un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula (II), de la presente invención pueden contener uno o una pluralidad de centros asimétricos en la fórmula estructural, y además dos o más isómeros y diastereómeros ópticos pueden estar presentes. Por lo tanto, la presente invención abarca completamente cada isómero óptico y las mezclas en cualquier proporción.

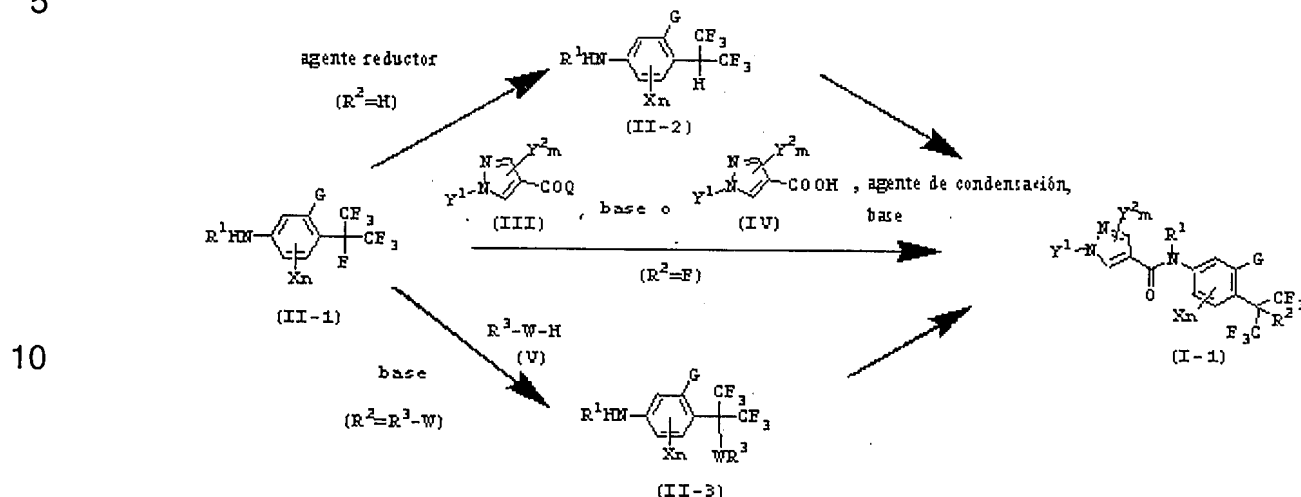
25 Adicionalmente, un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) de la presente invención puede tener dos tipos de isómero geométrico derivado de un enlace doble C-C en la fórmula estructural. La presente invención abarca todos los isómeros geométricos y las mezclas que los contienen en cualquier proporción. Además, la presente invención abarca hidratos de los mismos.

30 Los métodos de la producción representativos para un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) y un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula (II), como un compuesto intermedio del mismo se

ilustra a continuación, pero la presente invención no debe interpretarse como limitada al mismo.

Método de Producción 1

5



(en donde $\dot{G}$, R^1 , X , n , Y^1 , Y^2 y m son iguales a los definidos anteriormente:

y R³ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆,

15 un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo de C₁-C₄; W es -O-, -S- ó -N(R⁴)-, en donde R⁴ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo de C₁-C₄; y Q es un átomo halógeno o un grupo alcoxilo de C₁-C₆).

Entre un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la

20 fórmula (I), un derivado pirazolcarboxanilida sustituido (I-1) en donde Z es O, y R² es un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o WR³ en donde W y R³ son iguales a los definidos anteriormente se puede producir haciendo reaccionar un derivado de la anilina representado por las fórmulas (II-1) a (II-3) con un haluro pirazolcarboxílico o un éster pirazolcarboxilato representado por la fórmula (III) en presencia o ausencia de una base
25 en un solvente inerte, o haciendo reaccionar un derivado de anilina representado por las fórmulas (II-1) a (II-3) con un ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (IV) en presencia de un agente de condensación, en la presencia o ausencia de una base, en un solvente inerte, y cualquier método de producción usual para las amidas puede ser aplicable.

30 Un derivado de anilina representado por la fórmula (II-2) se puede producir reduciendo un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1) en presencia de un agente de reducción, en un solvente inerte.

Un derivado de anilina representado por la fórmula (II-3) se puede producir haciendo reaccionar un derivado de la anilina representado por la fórmula (II-1) con un derivado de alcohol, un derivado de tiol o un derivado de amina representado por la fórmula (V), en presencia o ausencia de una base en un solvente inerte.

5

La fórmula (II-1) → la fórmula (II-2)

Un ejemplo de un agente reductor a ser usado en la presente reacción incluye hidruros de metal tal como hidruro de litio aluminio, borohidruro de litio, borohidruro de sodio, hidruro de diisobutil aluminio, hidruro del bis(2-metoxietoxi)aluminio de sodio y lo similar, metal como litio y lo similar o sales de metal, y lo similar. La cantidad del agente reductor a ser usado puede seleccionarse, según sea apropiado, en la escala de una cantidad de exceso al equivalente con relación a un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1).

Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción puede ser cualquiera con tal de que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye carburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los hidrocarburos halogenados tales como cloruro del metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y lo similar; los carburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, diclorobenceno y lo similar; los éteres de cadena lineal o cíclica como el dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar, o dimetilsulfoxido y lo similar y estos solventes inertes pueden usarse exclusivamente o en una combinación de dos o más tipos.

La temperatura de la reacción puede estar en la escala de la temperatura ambiente a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y puede estar en la escala de varios minutos a 50 horas, dependiendo de la escala de la reacción y temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de la reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede producirse por una purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si es necesario. El compuesto deseado también puede ser sometido a la etapa de reacción subsiguiente sin aislamiento de mezcla de reacción.

Fórmula (II-1) → la fórmula (II-3).

Un ejemplo de una base ser usada en la presente reacción incluye hidruros de metal como el hidruro de litio, el hidruro de sodio, el hidruro de potasio y lo similar; alcoholatos de metal tales como el metóxido de sodio, el etóxido de sodio., terc-butóxido de potasio y lo similar; y metales de alquilo tales como el litio n-butilo, litio sec-butilo, litio terc-butilo y lo similar. La cantidad de base a ser usada puede ser seleccionada, si es apropiado, en la escala desde cantidad equivalente al exceso en relación a un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1).

Como un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción, el cual puede ser cualquiera con tal que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye los carburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los alcoholes tales como metanol, etanol y lo similar; los éteres de cadena lineal o cíclica tales como dietil éter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar, y similares y estos solventes inertes pueden ser usados exclusivamente o en combinación de dos o más tipos.

La temperatura de reacción puede estar en la escala de -70°C a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 50 horas, dependiendo de la escala de la reacción y la temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido mediante purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si fuera necesario. El compuesto deseado también puede ser sometido a una etapa de reacción subsiguiente sin aislamiento de la mezcla de reacción.

La fórmula (II-1), (II-2) ó (II-3) → la fórmula (I-1)

Un ejemplo de un agente de condensación a ser usado en la presente reacción incluye cianofosfato de dietilo (DEPC), carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), cloroformatos, yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio y lo similar.

Como base para ser usado en la presente reacción, se incluye una base inorgánica o una base orgánica y un ejemplo de una base inorgánica incluye los

hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y lo similar; el hidruros de metal alcalino tal como hidruro de sodio, hidruro de potasio y lo similar; sal de metal alcalino de alcohol tal como etóxido de sodio, terc-butóxido de potasio y lo similar; los carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, 5 carbonato hidrógeno de sodio y lo similar; y un ejemplo de las bases orgánicas incluyen trietilamina, piridina, DBU y lo similar. La cantidad de base a ser usada puede ser seleccionada en la escala de cantidad equivalente al exceso en relación a un derivado de ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (III) o (IV).

Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción 10 puede ser cualquiera con la condición que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye los carburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y lo similar; los hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, diclorobenceno y lo similar; éteres de cadena lineal o cíclica tales como 15 dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar; ésteres tales como acetato de etilo y lo similar; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida y lo similar; dimetilsulfóxido; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; acetona, etil metil cetona y lo similar. Estos solventes inertes pueden ser usados exclusivamente o en una combinación de dos o más tipos.

20 Como la presente reacción es una reacción equimolar, cada reactivo puede ser usado en igual cantidad molar, sin embargo, cualquiera de los reactivos también puede ser usado en exceso. La temperatura de reacción puede estar en la escala de la temperatura ambiente a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 48 horas, dependiendo 25 de la escala de la reacción y la temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por medio de un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc, si es necesario.

30 Un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1), como una materia prima de la presente reacción, puede producirse de acuerdo con un método de producción descrito en JP-A-11-302233, JP-A-2001-122836 o JP-A-2006-8675.

Un derivado de ácido pirazolcarboxílico representado por las fórmulas (III) o (IV) puede ser producido de acuerdo con varios métodos descritos en las literaturas conocidas (por ejemplo, "Aust. J. Chem.", 1983, 36, 135-147, "Síntesis", 1986, 753-755, JP-A-52-87168, JP-A-63-45264, JP-A-1-106866 y lo similar).

5

Método de Producción 2



10

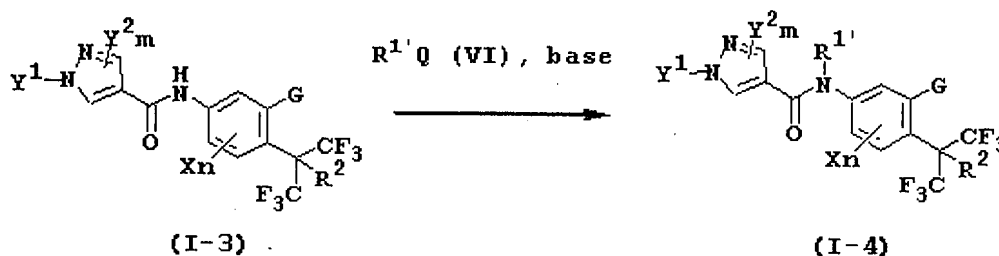
(en donde G, R¹, R², X, n, Y¹, Y² y m son iguales a los definidos anteriormente).

15

Entre los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I), un derivado pirazolcarboxanilida sustituido (I-2) en donde Z es S puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de anilida representado por (I-1) con el reactivo de Lawesson de acuerdo con un método conocido ("Tetrahedron Lett.", 21 (42), 4061 (1980)).

20

Método de Producción 3



25

(en donde G, R², X, n, Y¹, Y², m y Q son iguales a los definidos anteriormente y R^{1'} es igual al definido anteriormente excepto un átomo de hidrógeno).

Entre los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I), un derivado pirazolcarboxanilida sustituido (I-4) en donde R¹ es distinto de un átomo de hidrógeno puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de amida representado por la fórmula (I-3) con un derivado de haluro o un derivado de éster

30

representado por la fórmula (VI), en presencia o ausencia de una base, en un solvente inerte.

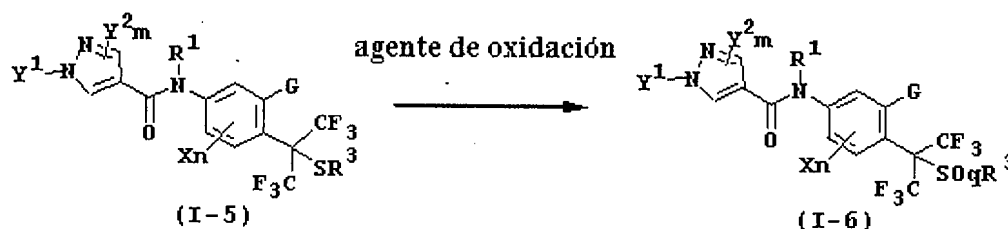
Como un ejemplo de una base a ser usada en la presente reacción se incluyen los hidróxidos de metal tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y lo similar; los carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato ácido de sodio y lo similar; hidruros de metal tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y lo similar; alcoholatos de metal tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, terc-butoxido de potasio y lo similar; alquil metales tales como n-butil litio, sec-butil litio, terc-butil litio y lo similar. La cantidad de base a ser usada se puede seleccionar, según lo apropiado, en la escala de cantidad equivalente a un exceso del derivado de amida representado por la fórmula (I-3).

Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción que puede ser cualquiera con tal que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye los hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los alcoholes tales como metanol, etanol y lo similar; éteres de cadena lineal o cíclica tales como dietil éter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida y lo similar; dimetilsulfóxido; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y lo similar. Estos solventes inertes pueden ser usados exclusivamente o en combinación de dos o más tipos.

La temperatura de reacción puede estar en la escala de -70°C a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 50 horas, dependiendo de la escala de la reacción y temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc, si fuera necesario.

Método de Producción 4



(en donde G , R^1 , R^3 , X , n , Y^1 , Y^2 y m son iguales a los definidos anteriormente, y q es 1 ó 2).

5 Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I-6) puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de sulfuro representado por la fórmula (I-5) el cual puede ser producido en el método de Producción 1 con un agente de oxidación en presencia de un solvente inerte.

10 Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción incluye los hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y lo similar; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y lo similar; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como fluorobenceno, clorobenceno, diclorobenceno y lo similar; ácidos tales como ácido acético y lo similar; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y lo similar.

15 Un ejemplo de un agente de oxidación incluye ácido m-peroxiclorobenzóico, ácido peracético, metaperiodato de potasio, persulfato ácido de potasio (Oxone), agua oxigenada y lo similar. La cantidad del agente de oxidación a ser usado puede ser seleccionada, si fuera apropiado, en la escala de 0.5 a 3 equivalentes en relación a un derivado de sulfuro representado por la fórmula (I-5).

20 La temperatura de reacción puede estar en la escala de -50°C a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 24 horas, dependiendo de la escala de la reacción y la temperatura de reacción.

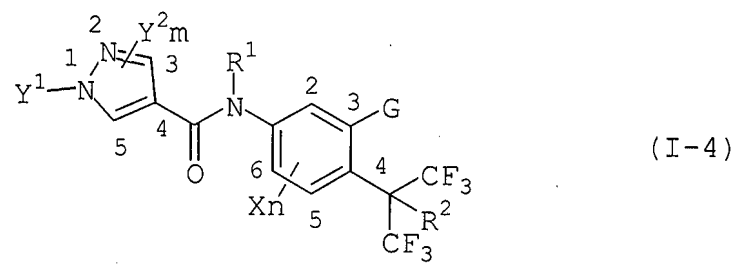
25 Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si fuera necesario.

30 Los compuestos típicos de derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I) son ejemplificados en el Cuadro 1 y Cuadro 2, y los compuestos típicos de derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II) se ejemplifican en el Cuadro 3, y un derivado de ácido pirazolcarboxílico sustituido

representado por la fórmula (IV) se ejemplifica en el Cuadro 4, sin embargo, la presente invención no debe ser interpretada como limitada a éstos.

En la columna de "propiedad" del cuadro 1 y cuadro 2, se ilustra el punto de fusión (°C) o índice de refracción (n_D(°C)) y para los compuestos descritos como amorfo o pasta, se ilustran datos ¹H-RMN de los mismos en el Cuadro 5. En los Cuadros, "n-" es normal, e "i-" es iso, "t-" es terciario, "c-" es ciclo, "Me" es un grupo metilo, "Et" es un grupo etilo, "Pr" es un grupo propilo, "Bu" es un grupo butilo, "Pen" es un grupo pentilo, "Hex" es un grupo hexilo, "Ph" es un grupo fenilo, "Bn" es un grupo bencilo, "Ac" es un grupo acetilo y "Pyr" es un grupo pirazinilo.

Fórmula (I-4)



CUADRO I

(Xn=H)

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-1	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	H	72-75
1-2	Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-3	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	129-131
1-4	Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.5028(25.4)
1-5	Et	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	
1-6	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	118.8-121.6
1-7	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	
1-8	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1.4889(24.2)
1-9	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OMe	
1-10	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OMe	77.2-79.2
1-11	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	
1-12	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1.4895(25.4)
1-13	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	110-113
1-14	Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-15	Et	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OEt	90-91
1-16	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OEt	119-120
1-17	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-18	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-19	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-20	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-21	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	
1-22	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
1-23	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	1.4768(21.8)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-24	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	132-134
1-25	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	57-60
1-26	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4736(24.6)
1-27	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	134-135
1-28	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4830(26.2)
1-29	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	
1-30	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	
1-31	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	128-130
1-32	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1.4697(25.9)
1-33	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OMe	
1-34	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4681(26.2)
1-35	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	142-145
1-36	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	1.4720(24.5)
1-37	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OEt	1.4710(26.9)
1-38	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OEt	
1-39	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OEt	
1-40	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OEt	
1-41	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OEt	
1-42	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OEt	
1-43	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OEt	
1-44	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OEt	
1-45	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	H	167-168
1-46	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-47	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	184-185
1-48	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4953(25.0)
1-49	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4982(34.2)
1-50	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	
1-51	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	1.4979(22.1)
1-52	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1.4942(22.7)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-53	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OMe	1.4980(22.7)
1-54	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OMe	1.4952(23.0)
1-55	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	
1-56	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1.4933(23.2)
1-57	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	178-179
1-58	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-59	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OEt	1.4980(22.7)
1-60	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OEt	
1-61	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-62	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-63	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-64	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-65	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	
1-66	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
1-67	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	131-133
1-68	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-69	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	124
1-70	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4711(25.6)
1-71	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	1.4700(26.8)
1-72	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4795(25.5)
1-73	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	
1-74	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	1.4658(26.9)
1-75	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	126-128
1-76	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1.4671(26.9)
1-77	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OMe	
1-78	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4645(26.9)
1-79	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-80	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-81	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OEt	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-82	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OEt	
1-83	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OEt	
1-84	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OEt	
1-85	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OEt	
1-86	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OEt	
1-87	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OEt	
1-88	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OEt	150-151.5
1-89	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-90	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-91	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	196-197
1-92	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-93	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-94	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	83-85
1-95	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-96	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-97	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-98	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-99	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-100	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	141-144
1-101	i-Bu	Me	3-Me	H	H	
1-102	i-Bu	Me	3-Me	Et	OMe	
1-103	i-Bu	Me	3-Me	Ac	OMe	1.4916(23.7)
1-104	i-Bu	Me	3-Me	COEt	OMe	1.4961(26.4)
1-105	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4973(26.2)
1-106	i-Bu	Me	3-Me	CO(4-Me-Ph)	OMe	1.5014(25.5)
1-107	i-Bu	Me	3-Me	CO(4-NO ₂ -Ph)	OMe	Amorfo
1-108	i-Bu	Me	3-Me	COOMe	OMe	Amorfo
1-109	i-Bu	Me	3-Me	COOEt	OMe	95.5-97.8
1-110	i-Bu	Me	3-Me	COO-n-Pr	OMe	84.6-86.2
						86.7-88.4

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-111	i-Bu	Me	3-Me	COO-i-Bu	OMe	91.8-94.0
1-112	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ OMe	OMe	1.4919(24.0)
1-113	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ OEt	OMe	1.4920(24.4)
1-114	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	H	172-174
1-115	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	H	
1-116	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	OMe	amorfo
1-117	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	OMe	
1-118	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	OEt	
1-119	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	OEt	
1-120	i-Bu	Et	3-CF ₃	H	H	175-176
1-121	i-Bu	Me	5-CF ₃	H	H	155-156
1-122	i-Bu	Me	5-SMe	H	H	107-110
1-123	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	H	148-151
1-124	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	SO ₂ (4-F-Ph)	H	amorfo
1-125	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	1.5021(22.5)
1-126	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt		143.1-148.8
1-127	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh		51.3-65.3
1-128	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃		1.4859(22.0)
1-129	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt		1.4882(23.8)
1-130	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me		1.4854(22.0)
1-131	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe		1.4889(21.9)
1-132	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OBn		1.5212(21.9)
1-133	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl		121.1-124.8
1-134	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃		143.1-145.6
1-135	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ CH ₂ Cl		117.1-121.4
1-136	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu		122.2-138.0
1-137	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-t-Bu		39.2
1-138	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe		1.4750(23.5)
1-139	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₁₅ Me		90.5-92.1

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-140	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.5016(23.3)
1-141	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4981(23.5)
1-142	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	82.5-83
1-143	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh	OMe	1.5219(23.7)
1-144	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	1.4944(23.1)
1-145	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1.4892(22.2)
1-146	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4885(25.1)
1-147	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OMe	1.4926(23.2)
1-148	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OMe	1.4894(23.2)
1-149	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	OMe	1.4941(21.5)
1-150	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	1.4928(22.2)
1-151	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Pr	OMe	1.4884(23.0)
1-152	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1.4829(22.3)
1-153	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CMe ₃	OMe	1.4864(23.0)
1-154	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4959(23.0)
1-155	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	189-190
1-156	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Et	OMe	amorfo
1-157	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CCl ₃	OMe	1.4939(22.2)
1-158	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	1.4940(26.4)
1-159	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OEt	1.4921(26.5)
1-160	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	Pasta
1-161	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh	OEt	
1-162	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-163	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-164	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	OEt	
1-165	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-166	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-167	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	OEt	
1-168	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-169	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Pr	OEt	165-166
1-170	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
1-171	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CMe ₃	OEt	
1-172	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	OEt	
1-173	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-174	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Et	OEt	
1-175	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CCl ₃	OEt	
1-176	i-Bu	Et	3, 5-Me ₂	H	H	127-128
1-177	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	F	136.5-137.5
1-178	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Et	H	1.4904(25.7)
1-179	i-Bu	Me	3-Me-5-F	H	H	169.5-171
1-180	i-Bu	Me	3-Me-5-F	H	OMe	135-137
1-181	i-Bu	Me	3-Me-5-F	Et	OMe	1.4825(26.0)
1-182	i-Bu	Me	3-Me-5-F	Ac	OMe	86.4
1-183	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COPh	OMe	124.1-130.8
1-184	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COOMe	OMe	64.5-80.5
1-185	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COO-i-Bu	OMe	1.4789(23.7)
1-186	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4857(22.3)
1-187	i-Bu	Me	3-Me-5-F	CH ₂ OEt	OMe	1.4804(23.8)
1-188	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	H	160-161
1-189	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	144-146
1-190	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Me	OMe	1.4919(25.6)
1-191	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Et	OMe	1.4938(26.0)
1-192	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OMe	OMe	1.4961(26.0)
1-193	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1.4932(25.6)
1-194	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COOMe	OMe	1.4883(25.6)
1-195	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COOEt	OMe	1.4915(26.0)
1-196	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COO-i-Bu	OMe	1.4850(25.6)
1-197	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4946(26.0)

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-198	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Ac	OMe	102.6-102.8
1-199	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COEt	OMe	101.8-104.2
1-200	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COPh	OMe	1.5210(26.0)
1-201	i-Bu	Et	3-Me-5-Cl	H	H	104.5-106
1-202	i-Bu	Me	3-Me-5-I	H	H	152-153
1-203	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	H	OMe	88-89
1-204	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	OMe	1.4710(25.7)
1-205	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	COOMe	OMe	1.4672(25.7)
1-206	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CH ₂ OEt	OMe	1.4652(25.7)
1-207	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	1.4869(23.4)
1-208	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	152-152.5
1-209	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	H	148.5-150
1-210	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	H	1.4623(22.8)
1-211	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	138-139
1-212	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	1.4729(20.7)
1-213	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1.4695(20.7)
1-214	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1.4742(24.5)
1-215	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₂ Me	OMe	1.4685(20.7)
1-216	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₃ Me	OMe	1.4689(24.5)
1-217	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4669(22.6)
1-218	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOPh	OMe	50-55
1-219	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4691(22.3)
1-220	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COSMe	OMe	1.4870(24.9)
1-221	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COSEt	OMe	1.4862(24.9)
1-222	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	1.4669(22.4)
1-223	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	108-110
1-224	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4720(20.6)
1-225	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4735(24.8)
1-226	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-227	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	136-137
1-228	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	H	
1-229	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	H	
1-230	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OMe	130-132
1-231	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OMe	
1-232	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OEt	
1-233	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OEt	128-130
1-234	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-235	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-236	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-237	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-238	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-239	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-240	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-241	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-242	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-243	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	174-176
1-244	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-245	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-246	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-247	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-248	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-249	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-250	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-251	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-252	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-253	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-254	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-255	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-256	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	67-70
1-257	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-258	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-259	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-260	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-261	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	158-160
1-262	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-263	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-264	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-265	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-266	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	143-144
1-267	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-268	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-269	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-270	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-271	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	67-70
1-272	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-273	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-274	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-275	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-276	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-277	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-278	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-279	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-280	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-281	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	152-153
1-282	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-283	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-284	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	166-167

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-285	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4925(21.8)
1-286	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-287	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-288	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-289	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-290	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	138-140
1-291	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-292	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-293	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-294	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	H	1.5052(23.3)
1-295	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-296	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-297	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-298	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-299	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-300	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-301	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-302	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-303	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-304	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-305	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-306	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	H	H	141-143
1-307	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	H	OMe	152-153
1-308	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	OMe	1.4688(25.6)
1-309	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	H	112-113
1-310	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	H	1.4690(25.9)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-311	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COOCH ₂ CH ₂ Cl	OMe	1.4966(24.7)
1-312	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CH ₂ Cl	OMe	1.5039(24.8)
1-313	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃	OMe	1.4914(24.8)
1-314	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	1.5061(24.9)
1-315	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	171-173
1-316	i-Bu	Cl CH ₂ CH ₂	3, 5-Me ₂	H	OMe	170-171
1-317	i-Bu	Cl CH ₂ CH ₂	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4955(24.8)
1-318	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OMe	1.4943(24.8)
1-319	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	113-115
1-320	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-MeO-Ph)	OMe	1.5198(25.3)
1-321	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-Me-Ph)	OMe	1.5139(25.0)
1-322	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-Cl-Ph)	OMe	51-64
1-323	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	COEt	OMe	1.4705(26.8)
1-324	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-Cl-Ph)	OMe	1.5266(25.4)
1-325	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-Me-Ph)	OMe	1.5182(25.5)
1-326	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-MeO-Ph)	OMe	1.5165(26.5)
1-327	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2-Me-Ph)	OMe	88-128
1-328	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2-Cl-Ph)	OMe	121-122
1-329	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2-MeO-Ph)	OMe	57-83
1-330	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CH ₂	OMe	1.5088(24.5)
1-331	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCHClMe	OMe	amorfo
1-332	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-Me-2-Pyr)	OMe	52-64
1-333	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	SNEt ₂	OMe	
1-334	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	H	161-163
1-335	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4680(26.4)
1-336	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Pen	OMe	95-96

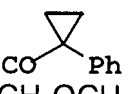
Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-337	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1.4939(26.5)
1-338	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	54
1-339	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ Ph	OMe	
1-340	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CMe ₂	OMe	1.5091(26.5)
1-341	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CHMe	OMe	1.5082(26.5)
1-342	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CH ₂ CO OEt	OMe	100-101
1-343	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=C H ₂	OMe	1.4728(27.0)
1-344	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-t-Bu	OMe	1.4715(26.9)
1-345	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-n-Pr	OMe	1.4660(26.8)
1-346	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH ₂ O Me	OMe	1.4695(26.2)
1-347	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-t-Bu	OMe	1.4730(26.2)
1-348	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ CH ₂ Cl	OMe	1.5062(26.7)
1-349	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.5019(26.8)
1-350	i-Bu	CH=CH 2	3, 5-Me ₂	H	OMe	124-130
1-351	i-Bu	CH=CH 2	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.5044(25.8)
1-352	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2;4-Cl ₂ -Ph)	OMe	1.5220(26.1)
1-353	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3;4-Cl ₂ -Ph)	OMe	53
1-354	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.5075(25.1)
1-355	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4741(25.8)
1-356	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=C H ₂	OMe	1.4781(25.9)
1-357	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	1.4888(26.0)
1-358	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-Cl-Ph)	OMe	41
1-359	Et	Me	3, 5-Me ₂	n-Pen	OMe	1.4897(25.0)
1-360	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (4-F-Ph)	OMe	107.9
1-361	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	1.4939(32.1)
1-362	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	100.3-103.4
1-363	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	1.5031(22.9)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-364	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	108
1-365	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ Et	OMe	1.4983(20.5)
1-366	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1.4958(21.6)
1-367	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	1.4991(21.8)
1-368	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.4977(30.5)
1-369	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1.4934(25.2)
1-370	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OPh	OMe	amorfo
1-371	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ -t-Bu	OMe	1.4962(32.1)
1-372	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	1.5023(32.2)
1-373	Et	Me	3, 5-Me ₂		OMe	1.4211(32.0)
1-374	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	OMe	1.4892(31.0)
1-375	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4855(30.2)
1-376	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4849(33.2)
1-377	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4982(23.1)
1-378	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4940(23.2)
1-379	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃	OMe	145.2-145.8
1-380	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pen	OMe	1.4960(20.2)
1-381	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	127-128
1-382	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Bu	OMe	1.4818(19.1)
1-383	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4701(24.4)
1-384	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COCHEt ₂	OMe	1.4724(24.3)
1-385	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4670(23.7)
1-386	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4659(21.8)
1-387	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4672(21.8)
1-388	Et	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	127.3-128.5
1-389	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	134.1-135.4

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-390	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Bu	OMe	136.1-137.2
1-391	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-t-Bu	OMe	108.6-110.4
1-392	Et	Me	3-Me-5-Cl	COO-i-Bu	OMe	1.4931(32.1)
1-393	Et	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4884(30.5)
1-394	Et	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4875(29.1)
1-395	Et	Me	3-Me	H	OMe	183.8-185.4
1-396	Et	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	114.4-114.9
1-397	Et	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4975(31.0)
1-398	Et	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4902(23.4)
1-399	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1.4932(23.0)
1-400	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	80-81
1-401	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1.4841(23.7)
1-402	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CHEt-n-Bu	OMe	1.4894(23.8)
1-403	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	pasta
1-404	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Me	OMe	1.4983(22.0)
1-405	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Et	OMe	1.4970(20.0)
1-406	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	1.5019(23.2)
1-407	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	(CH ₂) ₇ Me	OMe	1.4880(23.5)
1-408	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	H	140-145
1-409	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	H	129-130
1-410	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	140-145
1-411	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	H	135-137
1-412	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4673(21.8)
1-413	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-t-Bu	OMe	1.4669(21.7)
1-414	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Me	OMe	pasta
1-415	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	n-Pr	OMe	pasta

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-416	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	70-71
1-417	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	OMe	Pasta
1-418	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ Ph	OMe	90-97
1-419	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (4-Me-Ph)	OMe	Pasta
1-420	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	59-65
1-421	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Bu	OMe	Pasta
1-422	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	Pasta
1-423	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Bu	OMe	80-82
1-424	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-t-Bu	OMe	Pasta
1-425	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-s-Bu	OMe	Pasta
1-426	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	OMe	Pasta
1-427	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	OMe	Pasta
1-428	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me	OMe	Pasta
1-429	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	Pasta
1-430	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	106.1-107.8
1-431	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	97.2-101.8
1-432	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ Br	OMe	93-106
1-433	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1.5035(24.7)
1-434	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (2; 4; 6-Cl ₃ -Ph)	OMe	64.2-66.7
1-435	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		OMe	1.4991(20.5)
1-436	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCHMeOMe	OMe	1.4977(20.6)
1-437	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ OMe	OMe	1.4906(23.6)
1-438	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOPh	OMe	135.3-136.1
1-439	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	COO-i-Bu	OMe	1.4733(21.2)
1-440	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-t-Bu	OMe	1.4745(21.2)
1-441	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	1.4722(32.1)

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-442	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-c-Pr	OMe	1.4780(32.0)
1-443	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	1.4727(24.1)
1-444	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4720(24.2)
1-445	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4658(22.7)
1-446	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4670(22.5)
1-447	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4625(21.9)
1-448	i-Bu	Me	3-Me-5-F	CO-t-Bu	OMe	amorfo
1-449	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	124-124.4
1-450	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-t-Bu	OMe	1.4860(31.4)
1-451	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Bu	OMe	114-115.3
1-452	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COCH ₂ OMe	OMe	Amorfo
1-453	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pen	OMe	136.2-137
1-454	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4887(31.6)
1-455	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-i-Bu	OMe	60.7-64.7
1-456	i-Bu	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	67.3-68.2
1-457	i-Bu	Me	3-Me	CO-t-Bu	OMe	124.1-125.5
1-458	i-Bu	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4914(32.0)
1-459	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Bu	OMe	83-88.6
1-460	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4990(31.7)
1-461	i-Bu	Me	3-Me	COCHEt ₂	OMe	1.4905(28.5)
1-462	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4817(31.7)
1-463	i-Bu	H	3, 5-Me ₂	H	OMe	82.8-90.5
1-464	i-Bu	Et	3, 5-Me ₂	H	OMe	162-163
1-465	i-Bu	CH ₂ C F ₃	3, 5-Me ₂	H	OMe	176-177
1-466	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	F	1.4860(22.7)
1-467	H ₂ CH MeEt	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4929(20.1)
1-468	CH ₂ C HMeEt	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4910(20.0)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-469	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4895(20.6)
1-470	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4835(18.9)
1-471	CH ₂ CH-c-Pen	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	200-201
1-472	CH ₂ CH ₂ C HMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4960(20.5)
1-473	CH ₂ CH ₂ C HMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4950(21.6)
1-474	Et	i-Pr	3, 5-Me ₂	H	OEt	173-174
1-475	Et	i-Pr	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	88-89
1-476	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	O-n-Pr	104-105
1-477	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	O-n-Pr	1.4833(33.0)
1-478	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	O-n-Pr	1.4919(33.0)
1-479	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	O-n-Pr	1.4848(32.0)
1-480	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	O-n-Pr	1.4729(23.5)
1-481	Et	Me	3-I-5-Me	H	H	134-135
1-482	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCHMeCO Et	OEt	
1-483	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OMe	1.4959(31.2)
1-484	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	1.4960(32.3)
1-485	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.4880(29.0)
1-486	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4869(28.0)
1-487	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4819(29.3)
1-488	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	135.4-139.0
1-489	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	128.1-128.2
1-490	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-s-Bu	OMe	99.2-99.7
1-491	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pr	OMe	123.0-123.9
1-492	n-Pr	Me	3-Me 5-Cl	CO-c-Pen	OMe	141.7-142.1
1-493	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1.4954(20.7)
1-494	n-Pr	Me	3-I-5-Me	H	H	183-185
1-495	n-Pr	Me	3-Me	H	OMe	146.8-147.0

5

10

15

20

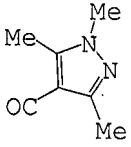
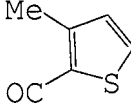
Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-496	n-Pr	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	61.6-62.9
1-497	n-Pr	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4960(22.2)
1-498	n-Pr	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4991(22.1)
1-499	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4864(22.8)
1-500	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4863(22.4)
1-501	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1.4892(22.7)
1-502	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	1.4910(22.8)
1-503	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	O-n-Pr	158-159.5
1-504	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COEt	O-n-Pr	1.4975(20.5)
1-505	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	O-n-Pr	1.4940(20.5)
1-506	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	O-n-Pr	1.4960(20.6)
1-507	i-Bu	CH ₂ C F ₃	3, 5-Me ₂	OEt	OMe	137-138
1-508	i-Bu	CH ₂ C F ₃	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	
1-509	i-Bu	i-Pr	3, 5-Me ₂	H	OMe	166-167
1-510	i-Bu	i-Pr	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	107-108
1-511	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	F	143.2-144.7
1-512	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	F	1.4888(23.0)
1-513	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	H	OMe	153-161
1-514	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CO-i-Pr	OMe	Pasta
1-515	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	Pasta
1-516	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	COOMe	OMe	Amorfo
1-517	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	H	OMe	172-174
1-518	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CO-i-Pr	OMe	Pasta
1-519	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	Pasta
1-520	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	H	178-183
1-521	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	COOMe	OMe	Pasta
1-522	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	Amorfo

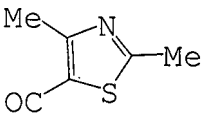
5

10

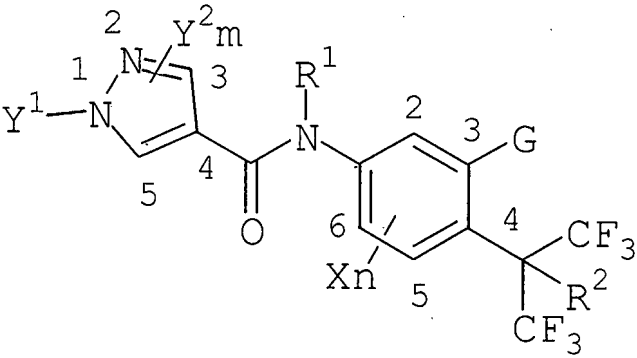
15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-523	i-Bu	Me	3-I-5-Me	COOMe	OMe	pasta
1-524	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-525	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ OEt	OMe	100-103
1-526	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	100-102
1-527	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CMe ₂	OMe	81-83
1-528	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-529	i-Bu	Me	5-CF ₃	H	OMe	170
1-530	i-Bu	Me	5-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	1.4680(22.8)
1-531	i-Bu	Et	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4913(23.0)
1-532	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	
1-533	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1.4870(22.5)
1-534	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	O-n-Pr	138-139
1-535	i-Bu	Me	3-I	H	OMe	210-218
1-536	i-Bu	Me	3-Br	H	OMe	203
1-537	i-Bu	Me	3-Cl	H	OMe	174-182
1-538	i-Bu	Me	3, 5-Cl ₂	H	OMe	132
1-539	i-Bu	Me	3-I	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-540	i-Bu	Me	3-Br	CO-i-Pr	OMe	Pasta
1-541	i-Bu	Me	3-Cl	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-542	i-Bu	Me	3-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-543	i-Bu	Me	3, 5-Cl ₂	CO-i-Pr	OMe	113-114
1-544	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		F	amorfo
1-545	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		F	amorfo

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-546	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		OMe	150.4-151.2
1-547	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OAc	OMe	94-95
1-548	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OC(=O)Et	OMe	99
1-549	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OC(=O)-i-Pr	OMe	112
1-550	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COSMe	OMe	
1-551	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COSEt	OMe	

Fórmula (I-4)



(I-4)

CUADRO 2

(Y¹=Me)

Nro.	G	Xn	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
2-1	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	H	H	
2-2	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
2-3	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
2-4	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
2-5	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
2-6	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
2-7	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
2-8	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
2-9	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
2-10	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
2-11	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
2-12	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
2-13	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	H	128-131
2-14	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	132-134
2-15	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
2-16	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4905(25.9)
2-17	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	154-155
2-18	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
2-19	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
2-20	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
2-21	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	104-106

5

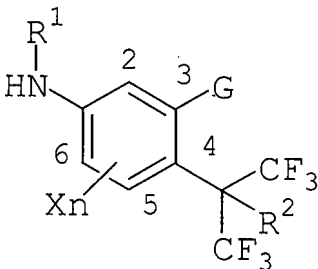
10

15

20

Nro.	G	Xn	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
2-22	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4751(26.7)
2-23	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	152-153
2-24	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
2-25	n-Pr	6-Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	127-128.5
2-26	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	151-152
2-27	i-Bu	6-Cl	3, 5-Me ₂	H	OMe	106-109
2-28	i-Bu	6-Cl	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	amorfo
2-29	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	138-140
2-30	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	132-134
2-31	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-n-Pr	OMe	1.4960(26.6)
2-32	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	165-166
2-33	i-Bu	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	126-127
2-34	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4955(33.5)
2-35	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	128.5-130.2
2-36	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	COCHE t ₂	OMe	1.4918(32.6)
2-37	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	COO-i- Bu	OMe	1.4870(30.1)
2-38	i-Bu	6-Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	Amorfo
2-39	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4952(32.0)
2-40	n-Pr	6-Me	3-Me	H	OMe	amorfo
2-41	n-Pr	6-Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	pasta
2-42	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	111-112
2-43	i-Bu	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	38-42
2-44	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	155
2-45	i-Bu	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	68-70
2-46	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OH	192-195

Fórmula (II)



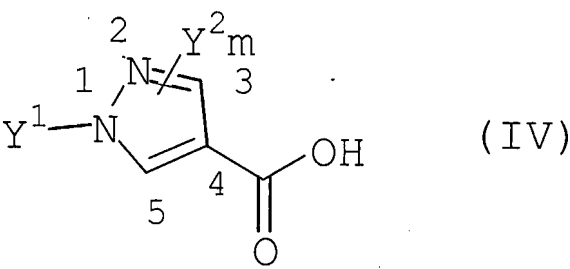
(II)

CUADRO 3

(R¹=H)

Nro	G	Xn	R ²	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
3-1	n-Pr	6-Me	F	7.09(s; 1H); 6.54(s; 1H); 3.76(bs; 2H); 2.63(m; 2H); 2.13(s; 3H); 1.58(m; 2H); 0.96(t; 3H)
3-2	n-Pr	6-Me	H	7.18(s; 1H); 6.54(s; 1H); 4.45-4.20(br; 2H); 4.27(m; 1H); 2.50(dd; 2H); 2.14(s; 3H); 1.57(m; 2H); 0.98(t; 3H)
3-3	n-Pr	6-Me	OMe	7.10(s; 1H); 6.66(s; 1H); 3.72(bs; 2H); 3.42(s; 3H); 2.84(m; 2H); 2.14(s; 3H); 1.61(m; 2H); 1.00(t; 3H)
3-4	Et	6-Me	F	7.09(s; 1H); 6.56(s; 1H); 3.78(bs; 2H); 2.71(m; 2H); 2.14(s; 3H); 1.19(td; 3H)
3-5	Et	6-Me	OMe	7.10(s; 1H); 6.68(s; 1H); 3.75(bs; 2H); 3.41(s; 3H); 2.91(dd; 2H); 2.15(s; 3H); 1.22(t; 3H)
3-6	Et	H	O-n-Pr	7.22(d; 1H); 6.67(d; 1H); 6.52(dd; 1H); 3.80(br; 2H); 3.46(t; 2H); 2.92(dd; 2H); 1.69(dd; 2H); 1.21(t; 3H); 0.94(t; 3H)
3-7	n-Pr	H	O-n-Pr	7.22(d; 1H); 6.66(d; 1H); 6.51(dd; 1H); 3.78(br; 2H); 3.47(t; 2H); 2.85(m; 2H); 1.70(dd; 2H); 1.60(m; 2H); 1.00(t; 3H); 0.94(t; 3H)
3-8	i-Bu	H	O-n-Pr	7.24(d; 1H); 6.70(d; 1H); 6.53(dd; 1H); 3.79(bs; 2H); 3.47(t; 2H); 2.81(d; 2H); 2.10(m; 1H); 1.70(m; 2H); 0.95(t; 3H); 0.91(d; 6H)

Fórmula (IV)



CUADRO 4

10

Nro	Y¹	Y²ᵐ	punto de fusión (°C)
4-1	Me	3-Me-5-CF₃	124-125.5

15

20

CUADRO 5

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
1-106	7.61(d; 2H); 7.52(d; 1H); 7.17(m; 4H); 7.11(m; 1H); 3.69(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.86(d; 2H); 2.39(s; 3H); 2.37(s; 3H); 1.96(m; 1H); 0.73(d; 6H)
1-107	8.27(d; 2H); 7.83(d; 2H); 7.59(d; 1H); 7.22(d; 1H); 7.17(m; 1H); 6.97(s; 1H); 3.66(s; 3H); 3.51(s; 3H); 2.91(d; 2H); 2.36(s; 3H); 1.97(m; 1H); 0.77(d; 6H)
1-116	8.04(s; 1H); 7.73(br; 1H); 7.72(d; 1H); 7.50(d; 1H); 7.43(dd; 1H); 4.01(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.93(d; 2H); 2.21(m; 1H); 0.94(d; 6H)
1-124	7.80(dd; 2H); 7.49(d; 1H); 7.13(dd; 2H); 7.02(dd; 1H); 6.89(d; 1H); 4.40-4.31(m; 1H); 3.57(s; 3H); 2.42(d; 2H); 2.28(s; 3H); 2.22(s; 3H); 1.70-1.59(m; 1H); 0.78(d; 6H)
1-156	7.41(d; 1H); 7.01(dd; 1H); 6.96(d; 1H); 3.98(dd; 2H); 3.56(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.79(d; 2H); 2.06(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.86(m; 1H); 1.25(dd; 3H); 0.74(d; 6H)
1-160	7.47(d; 1H); 7.16-7.05(m; 2H); 3.67(s; 3H); 3.60(dd; 2H); 3.04(m; 1H); 2.88(d; 2H); 2.37(s; 3H); 2.25(s; 3H); 1.97(m; 1H); 1.31(t; 3H); 1.26(d; 6H); 0.77(d; 6H)
1-331	7.48(d; 1H); 7.10(d; 1H); 7.08(s; 1H); 5.11(q; 1H); 3.64(s; 3H); 3.45(s; 3H); 2.96(dd; 1H); 2.74(dd; 1H); 2.31(s; 3H); 2.24(s; 3H); 1.92(m; 1H); 1.77(d; 3H); 0.84(d; 3H); 0.65(d; 3H)
1-370	7.41(d; 1H); 7.28(m; 2H); 7.08(d; 1H); 6.98(m; 2H); 6.84(m; 2H); 4.98(s; 2H); 3.63(s; 3H); 3.40(s; 3H); 2.96(q; 2H); 2.18(s; 3H); 2.14(s; 3H); 1.26(t; 3H)
1-403	7.43(d; 1H); 7.14(d; 1H); 7.18(m; 1H); 4.32(s; 2H); 3.66(s; 3H); 3.43(s; 3H); 3.39(s; 3H); 2.92(m; 2H); 2.31(s; 3H); 2.23(s; 3H); 1.51(m; 2H); 0.94(t; 3H)
1-414	7.41(d; 1H); 7.01(m; 2H); 3.58(s; 3H); 3.48(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.79(d; 2H); 2.06(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.85(m; 1H); 0.76(d; 6H)
1-415	7.39(d; 1H); 7.00(dd; 1H); 6.97(d; 1H); 3.88(m; 2H); 3.56(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.78(d; 2H); 2.05(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.84(m; 1H); 1.66(m; 2H); 0.95(t; 3H); 0.75(d; 6H)
1-417	8.18(d; 2H); 7.50(d; 2H); 7.38(d; 1H); 6.95(dd; 1H); 6.88(d; 1H); 5.22(s; 2H); 3.58(s; 3H); 3.41(s; 3H); 2.73(d; 2H); 2.08(s; 3H); 1.99(s; 3H); 1.73(m; 1H); 0.70(d; 6H)
1-419	7.33(d; 1H); 7.23(d; 2H); 6.93(dd; 1H); 6.89(d; 1H); 6.83(d; 2H); 5.06(s; 2H); 3.79(s; 3H); 3.56(s; 3H); 3.40(s; 3H); 2.73(d; 2H); 2.05(s; 3H); 2.01(s; 3H); 1.74(m; 1H); 0.70(d; 6H)

5

10

15

20

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
1-421	7.40(d; 1H); 7.16(m; 2H); 5.30(s; 2H); 3.61(t; 2H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.09(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 1.59(m; 2H); 1.37(m; 2H); 0.91(t; 3H); 0.76(d; 6H)
1-422	7.39(d; 1H); 7.18(m; 2H); 5.31(s; 2H); 3.91(m; 1H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.08(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 1.22(d; 6H); 0.77(d; 6H)
1-424	7.39(d; 1H); 7.23(m; 2H); 5.23(s; 2H); 3.58(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.07(s; 6H); 1.89(m; 1H); 1.26(s; 9H); 0.78(d; 6H)
1-425	7.39(d; 1H); 7.17(m; 2H); 5.43(d; 1H); 5.22(d; 1H); 3.68(m; 1H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.08(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 1.46-1.63(m; 2H); 1.20(d; 3H); 0.89(t; 3H); 0.77(dd; 6H)
1-426	7.42(d; 1H); 7.10(m; 2H); 5.43(s; H); 4.14(q; 2H); 3.58(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.05(s; 3H); 2.01(s; 3H); 1.85(m; 1H); 0.76(d; 6H)
1-427	7.40(d; 1H); 7.17(dd; 1H); 7.13(d; 1H); 5.87-5.98(m; 1H); 5.32(s; 2H); 5.29(dd; 1H); 5.20(dd; 1H); 4.16(d; 2H); 3.59(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.09(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 0.76(d; 6H)
1-428	7.39(d; 1H); 7.15(m; 2H); 5.30(s; 2H); 3.60(t; 2H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.09(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.88(m; 1H); 1.60(m; 2H); 1.27(m; 10H); 0.88(t; 3H); 0.77(d; 6H)
1-429	7.49(d; 1H); 7.12(d; 1H); 7.08(dd; 1H); 3.68(s; 3H); 3.46(m; 1H); 3.46(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.40(m; 2H); 2.35(s; 3H); 2.25(s; 3H); 1.84-2.11(m; 5H); 0.80(d; 6H)
1-448	7.49(d; 1H); 7.06(d; 1H); 6.98(m; 1H); 3.64(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.86(d; 2H); 2.39(s; 3H); 1.95(m; 1H); 1.38(s; 9H); 0.76(d; 6H)
1-452	7.49(d; 1H); 7.18(d; 1H); 7.13(m; 1H); 4.31(s; 2H); 3.71(s; 3H); 3.46(s; 3H); 3.42(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.32(s; 3H); 2.03(m; 1H); 0.79(d; 6H)
1-514	7.53(d; 1H); 7.27(d; 1H); 7.16(dd; 1H); 3.72(s; 3H); 3.48(s; 3H); 2.92(d; 2H); 2.88(m; 1H); 2.43(s; 3H); 2.07(m; 1H); 1.21(d; 6H); 0.84(d; 6H)
1-515	7.41(d; 1H); 7.21(s; 1H); 7.19(d; 1H); 5.28(s; 2H); 3.92(m; 1H); 3.63(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.82(d; 2H); 2.19(s; 3H); 1.94(m; 1H); 1.21(d; 6H); 0.79(d; 6H)
1-516	7.55(d; 1H); 7.32(d; 1H); 7.16(dd; 1H); 3.79(s; 3H); 3.76(s; 3H); 3.49(s; 3H); 2.91(d; 2H); 2.47(s; 3H); 2.11(m; 1H); 0.92(d; 6H)

5

10

15

20

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
1-518	7.53(d; 1H); 7.28(d; 1H); 7.18(dd; 1H); 3.74(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.92(m; 1H); 2.91(d; 2H); 2.42(s; 3H); 2.07(m; 1H); 1.23(d; 6H); 0.84(d; 6H)
1-519	7.42(d; 1H); 7.22(d; 1H); 7.21(s; 1H); 5.28(s; 2H); 3.94(m; 1H); 3.63(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.82(d; 2H); 2.14(s; 3H); 1.95(m; 1H); 1.21(d; 6H); 0.79(d; 6H)
1-521	7.56(d; 1H); 7.35(d; 1H); 7.19(dd; 1H); 3.81(s; 3H); 3.76(s; 3H); 3.50(s; 3H); 2.94(d; 2H); 2.47(s; 3H); 2.14(m; 1H); 0.92(d; 6H)
1-522	8.17(br; 1H); 7.78(d; 1H); 7.47-7.53(m; 2H); 3.84(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.93(d; 2H); 2.62(s; 3H); 2.24(m; 1H); 0.95(d; 6H)
1-523	7.57(d; 1H); 7.39(d; 1H); 7.22(dd; 1H); 3.84(s; 3H); 3.76(s; 3H); 3.50(s; 3H); 2.95(d; 2H); 2.46(s; 3H); 2.15(m; 1H); 0.92(d; 6H)
1-524	7.51(d; 1H); 7.27(d; 1H); 7.20(dd; 1H); 3.74(s; 3H); 3.46(s; 3H); 2.99(m; 1H); 2.90(d; 2H); 2.37(s; 3H); 2.07(m; 1H); 1.26(d; 6H); 0.82(d; 6H)
1-539	7.55(d; 1H); 7.16(d; 1H); 7.11(dd; 1H); 6.87(s; 1H); 3.73(s; 3H); 3.48(s; 3H); 3.31(m; 1H); 2.89(d; 2H); 2.04(m; 1H); 1.27(d; 6H); 0.79(d; 6H)
1-540	7.55(d; 1H); 7.20(d; 1H); 7.12(dd; 1H); 7.05(s; 1H); 3.72(s; 3H); 3.49(s; 3H); 3.22(m; 1H); 2.90(d; 2H); 2.05(m; 1H); 1.26(d; 6H); 0.81(d; 6H)
1-541	7.56(d; 1H); 7.21(d; 1H); 7.15(s; 1H); 7.12(dd; 1H); 3.72(s; 3H); 3.49(s; 3H); 3.17(m; 1H); 2.91(d; 2H); 2.05(m; 1H); 1.25(d; 6H); 0.82(d; 6H)
1-542	7.57(d; 1H); 7.17(d; 1H); 7.09(dd; 1H); 7.06(s; 1H); 3.78(s; 3H); 3.49(s; 3H); 3.26(m; 1H); 2.90(d; 2H); 2.03(m; 1H); 1.24(d; 6H); 0.78(d; 6H)
1-544	7.51(d; 1H); 7.16(m; 1H); 6.97(d; 1H); 3.82(s; 3H); 3.65(s; 3H); 2.63(t; 2H); 2.27(s; 3H); 2.24(s; 3H); 2.10(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.67(m; 1H); 0.81(d; 6H)
1-545	7.47(d; 1H); 7.34(d; 1H); 7.11(m; 1H); 6.94(d; 1H); 6.86(d; 1H); 3.67(s; 3H); 2.60(t; 2H); 2.51(s; 3H); 2.38(s; 3H); 2.28(s; 3H); 1.73(m; 1H); 0.75(d; 6H)
2-28	7.62(s; 1H); 7.25(s; 1H); 3.71(s; 3H); 3.50(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.38(s; 3H); 2.32(s; 3H); 2.24(s; 3H); 2.02(m; 1H); 0.85(d; 6H)

5

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
2-38	7.41(s; 1H); 7.12(s; 1H); 3.72(s; 3H); 3.48(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.38(s; 3H); 2.30(s; 3H); 2.24(s; 3H); 2.40-2.30(m; 2H); 2.04(m; 1H); 1.14(t; 3H); 0.85(d; 6H)
2-40	8.26(s; 1H); 7.82(s; 1H); 7.27(br; 2H); 3.90(s; 3H); 3.45(s; 3H); 2.95(m; 2H); 2.57(s; 3H); 2.32(s; 3H); 1.71(m; 2H); 1.02(t; 3H)
2-41	7.37(s; 1H); 7.10(s; 1H); 6.30(s; 1H); 3.59(s; 3H); 3.47(s; 3H); 3.43(m; 1H); 2.92(br; 2H); 2.48(s; 3H); 2.17(s; 3H); 1.55(br; 2H); 1.28(d; 6H); 0.94(t; 3H)

El agente agrohortícola, en particular, insecticida o acaricida agrohortícola, conteniendo un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o una sal de la presente invención como ingrediente activo, es conveniente para controlar

5 las diversas plagas de insecto tales como las plagas de insecto agrohortícola, plagas de insecto de grano almacenado, plagas de insecto sanitarias, nemátodos, etc., las cuales son perjudiciales para arrozales, árboles de fruta, verduras, otros cultivos, flores y plantas ornamentales, etc. Los mismos tienen un marcado efecto insecticida, por ejemplo, en

10 LEPIDOPTEROS incluyendo tortrix de fruta de verano (Adoxophes orana fasciata), tortrix de té menor (Adoxophyes sp.), polilla de fruta manchú (Grapholita inopinata), polilla de fruta oriental (Grapholita molesta), perforador de vaina de soja (Leguminivora glycinivorella), enrollador de hoja de la morera (Olethreutes mori), enrollador de hoja de té (Caloptilia theviva), Caloptilia sp. (Caloptilia zachrysa), minador de hoja de manzano (Phyllonorycter ringoniella), minador de corteza de peral (Spulerrina astauota), blanca

15 comun (Piers rapae crucivora), isoca del tabaco (Heliothis sp.), mariposa de la manzana (Laspey resia pomonella), palomita de las coles (Plutella xylostella), polilla de fruta de manzano (Argyresthia conjugella), polilla de fruta del duraznero (Carposina niponensis), perforador del tallo de arroz (Chilo suppressalis), enrollador de hoja de arroz (Cnaphalocrocis medinalis), polilla del tabaco (Ephestia elutella), piralido de la morera

20 (Glyphodes pyloalis), taladrador del arroz amarillo (Scirpophaga incertulas), saltador de arroz (Parnara guttata), oruga militar de arroz (Pseudaletia separata), barrenador del arroz (Sesamia inferens), gusano gris del tabaco (Spodoptera litura), oruga militar de remolacha (Spodoptera exigua), etc.;

HEMIPTEROS incluyendo saltador de hoja aster (Macrosteles fascifrons),

25 saltador de hoja de arroz verde (Nephotettix cincticeps), saltador de planta de arroz castaño (Nilaparvata lugens), saltador de planta de arroz de lomo blanco (Sogatella furcifera), (Diaphorina citri), mosca blanca de la uva (Aleurolibus taonabae), mosca blanca de batata (Bemisia tabaci), mosca blanca de invernadero (Trialeurodes vaporariorum), pulgón de nabo (Lipaphis erysimi), pulgón de durazno verde (Myzus persicae), cochinilla

30 de cera India (Ceroplastes ceriferus), cochinilla algodonosa de cítricos (Pulvinaria aurantii), cochinilla de alcanfor (Pseudaonidia duplex), cochinilla de San José

(Comstockaspis perniciosa), cochinilla de punta de flecha (Unaspis yanonensis), etc.; TILENQUIDOS incluyendo escarabajo de la soja (Anomala rufocuprea), escarabajo japonés (Popillia japonica), escarabajo del tabaco (Lasioderma serricorne), escarabajo del aserrín (Lyctus brunneus), vaquita de veintiocho manchaa (Epilachna vigintiotopunctata),

5 gorgojo de poroto azuki (Callosobruchus chinensis), gorgojo de verdura (Listroderes costirostris), gorgojo de maíz (Sitophilus zeamais), picudo del algodón (Anthonomus grandis grandis), gorgojo de agua de arroz (Lissorhoptrus oryzophilus), Escarabajo de la hoja de cucurbita (Aulacophora femoralis), escarabajo de la hoja de arroz (Oulema oryzae), escarabajo pulga rayado (Phyllotreta striolata), escarabajo de retoño de pino

10 (Tomicus piniperda), Dorifora (Leptinotarsa decemlineata), escarabajo de frijol mexicano (Epilachna varivestis), vaquita de maíz (Diabrotica sp.), etc.;

DIPTEROS. incluso mosca del melón (Dacus(Zeugodacus) cucurbitae), mosca de fruta oriental (Dacus (Bactrocera) dorsalis), minador de hoja de arroz (Agnomyza oryzae), gusano de cebolla (Delia antiqua), gusano de semilla de maíz (Delia platura), mosca enana de vaina de soja (Asphondylia sp.), etc.; TILENQUIDOS incluyendo

15 nematodo de lesión de la raíz (Pratylenchus sp.), nematodo de quiste de papa (Globodera rostochiensis), nematodo de nudo de raíz (Meloidogyne sp.), nematodo de cítrico (Tylenchulus semipenetrans), Aphelenchus sp. (Aphelenchus avenae), foliar de crisantemo (Aphelenchoides ritzemabosi), etc.; y ACARINA incluyendo óbolo rojo

20 (Panonychus citri), la araña roja del árbol de fruta (Panonychus ulmi), arañuela carmín (Tetranychus cinnabarinus), arañuela Kanzawa (Tetranychus Kanzawai Kishida), arañuela de dos manchas (Tetranychus urticae Koch), acárido de la roya de té rosa (Acaphylla theae), acárido de la roya de cítricos rosa (Aculops pelekassi), acárido de té púrpura (Calacarus carinatus), acárido de la roya de pera (Epitimerus pyri), etc.

25 Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula

(I) o sal de mismo de la presente invención es usado preferentemente como insecticida o acaricida agrohortícola. Sin embargo, el compuesto exhibe un excelente efecto de control

contra las diversas plagas de insecto tales como las plagas de insecto del bosque y la

madera, plagas de insecto de forrajeras, plagas de insecto sanitarias, etc. y puede ser

30 usada como agente de control de plagas en los diversos campos amplios. Los ejemplos de plagas de insecto incluyen: Tabanidos tales como Tabanus rufidens Bigot; Muscidos

tales como mosca común (Musca domestica uicina MACQUART); Gasterofilidos tales como mosca de caballo (Gasterophilus intestinalis); Hypodermatidos tales como la larva del ganado (Hypoderma bovis L.); Foridos tales como Megaselia spiracularis; Culicidos tales como el mosquito doméstico pálido (Culex pipiens pallens), Anopheles sinensis,
5 mosquito rayado (Aedes albopictus), y Aedes japonicus; Pulicidos tales como pulga del gato (Ctenocephalides felis), pulga del perro (Ctenocephalides canis), pulga humana (Pulex irritans); Ixodidos tales como Ixodes ovatus Neumann; Limantriidos tales como Euproctis similes; Rhincoforidos como gorgojo de arroz (Sitophilus zeamais); Vespidos como Vespa simillima xanthoptera Cameron; Blatelidos como cucaracha alemana (Blattella germanica);
10 Blatidos como cucaracha americana (Periplaneta americana) y Periplaneta japónica; Ptiridos como piojo púbico (Phthirus pubis); Termitidos como termita japonesa (Reticulitermes speratus) y termita doméstica (Coptotermes formosanus); e Ixodidos como Ixodes persulcatus; y Macronisidos como rata tropical (Ornithonyssus bacoti).

El agente agrohortícola, en particular, insecticidas o acaricidas
15 agrohortícolas, conteniendo un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o sal de mismo de la presente invención como ingrediente activo posee un marcado efecto de control en las plagas de insecto ejemplificadas precedentemente las cuales son perjudiciales en cultivos de arrozal, cultivos en tierras altas, árboles frutales, verduras y otros cultivos, flores y planta ornamentales, y lo similar. Por consiguiente, el
20 efecto deseado de los insecticidas agrohortícolas de la presente invención puede ser exhibido aplicando los agentes a los arrozales, campos, árboles de fruta, verduras, otros cultivos, semillas de flores y plantas ornamentales, agua de arrozal, tallos y hojas, o tierra en una estación en la que se espera que aparezcan las plagas de insecto, antes de su aparición o en el momento en el cual su aparición es confirmada.

25 Las plantas para las cuales el agente agrohortícola de la presente invención puede ser usado, no están limitadas específicamente e incluyen, por ejemplo, la plantas ilustradas a continuación.

Los cereales (por ejemplo arroz (Oryza sativa), cebada (Hordeum vulgare), trigo (Triticum aestivum L.), centeno (Secale cereale), avena (Avena), maíz (Zea mays L.),
30 kaoliang, etc.); legumbre (soja, poroto adzuki, poroto fava, poroto, maní, etc.); árboles de fruta y frutos (manzana, frutas cítricas, pera, uvas, durazno, ciruela, cereza, nuez,

almendra, banana, fresa, etc.); verduras (repollo, tomate, espinaca, brócoli, lechuga, cebolla, cebolla welsh, pimienta verde, etc.); verduras de raíz (zanahoria, papa, batata, rábano, raíz de loto, nabo, etc.); cosecha para procesar (algodón, lino (Linum usitatissimum), papel de morera (Broussonetia kasinoki SIEB), arbusto de papel

5 (Edgeworthia papyrifera), pimienta (Brassica napus L.), remolacha (Beta vulgaris), lúpulo, caña de azúcar (Saccharum officinarum), remolacha azucarera (Beta vulgaris var. saccharifera), oliva, caucho, café, tabaco, té, etc.); calabaza (zapallo, pepino, sandía, melón, etc.); césped (césped de huerto, sorgo, timothy (pasto europeo), trébol, alfalfa, etc.); césped (césped coreano, césped torcido, etc.); cultivos para especies (lavanda

10 (Lavandula officinalis CHAIX), romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.); y flores (crisantemo, rosa, orquídea, etc.).

Recientemente, el cultivo de gen recombinante (cultivo resistente a herbicida, cultivo resistente a plaga de insecto que incorpora gen generador de toxina insecticida, cultivo resistente a enfermedad que incorpora gen productor del inductor de

15 resistencia a enfermedad, cultivo sabor mejorado, cultivo con preservabilidad mejorada, cultivo con rendimiento mejorado, etc.), feromona sexual de insecto (feromona que destruye los compuestos químicos para polillas de enrolladores de hoja, oruga militar de repollo, etc.), tecnología IPM (control de plaga integrado) que usa el insecto enemigo natural han progresado, y pueden ser usadas composiciones plaguicidas de la presente

20 invención en combinación con o para sistematización con tales tecnologías.

El agente agrohortícola de la presente invención generalmente es preparado en forma convenientemente utilizable según una modalidad convencional para la formulación de agroquímicos.

Es decir, el derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la

25 fórmula (I) o sal de la presente invención y, opcionalmente, un auxiliar es mezclado con un vehículo inerte conveniente en una proporción apropiada y es preparado en una forma de formulación conveniente tal como una suspensión, concentrado emulsionable, concentrado soluble, polvo humectable, gránulo dispersable en agua, gránulos, polvo, tabletas, conjunto o lo similar a través de disolución, dispersión, suspensión, mezcla,

30 impregnación, adsorción o adherencia.

El vehículo inerte utilizable en la presente invención puede ser tanto sólido

como líquido. Como material utilizable como vehículo sólido, puede ejemplificarse harina de soja, harina de cereal, aserrín de madera, aserrín de corteza, aserrín, tallos de tabaco pulverizados, berros de agua pulverizados, salvado, celulosa pulverizada, residuo de
5 extracto de vegetales, resinas tales como polímeros sintéticos pulverizados y lo similar, arcillas (por ejemplo caolín, bentonita, y arcilla ácida), talcos (por ejemplo talco y pirofilita), polvo o escamas de sílice (por ejemplo harina fósil, arena de cuarzo, mica y carbón blanco [sintético, ácido silícico de alta dispersión, también llamada sílice hidratada finamente dividida o ácido silícico hidratado, algunos de los productos disponibles
10 comercialmente contienen silicato de calcio como componente principal]), polvos o minerales inorgánicos tales como carbón activado, azufre pulverizado, piedra pómez, harina fósil calcinada, ladrillo molido, ceniza, arena, carbonato de calcio, fosfato de calcio y lo similar, vehículos plásticos tales como polietileno, polipropileno, cloruro de poli(vinilideno) y lo similar, fertilizantes químicos (por ejemplo sulfato de amonio, fosfato
15 de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio), y abono. Estos vehículos pueden ser usados exclusivamente o como una mezcla de dos o más tipos de los mismos.

Un material utilizable como vehículo líquido se selecciona de materiales que tienen solubilidad por sí mismos, incluso sin tal solubilidad, sean capaces de
20 dispersar un ingrediente activo con la ayuda de un auxiliar. Los siguientes son ejemplos típicos del vehículo líquido y pueden usarse exclusivamente o como una mezcla de dos o más tipos de los mismos: agua, alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol y etilen glicol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona y ciclohexanona), éteres (por ejemplo etil éter, dioxano,
25 Cellosolve, dipropil éter y tetrahidrofurano), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo querosén y aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, nafta disolutiva y alquilnaftalenos), hidrocarburos halogenados (por ejemplo dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno), ésteres (por ejemplo acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato dibutílico y ftalato de dioctilo), amidas (por ejemplo
30 dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida), nitrilos (por ejemplo el acetonitrilo), y dimetilsulfóxido.

Lo siguiente son ejemplos típicos del auxiliar, el cual es usado dependiendo en los propósitos y es usado exclusivamente o en combinación de dos o más tipos, o en algunos casos, no necesita ser usado en absoluto.

5 Para emulsionar, dispersar, disolver y/o humectar un compuesto tal como el ingrediente activo, se utiliza un agente tensoactivo. Como el agente tensoactivo, pueden ejemplificarse polioxietilen éteres de alquilo, polioxietilen éteres de alquilarilo, polioxietilen ésteres de ácido graso superior, polioxietilen resonatos, monolaurato de polioxietilen sorbitan, monooleato de polioxietilen sorbitan, alquilarilsulfonatos, productos de condensación de ácidos naftalen sulfónicos, ligninsulfonatos y ésteres de sulfato de alcohol superior.

10 Además, para estabilizar la dispersión de un compuesto como ingrediente activo, hacerla adhesiva y/o unificarla, también pueden usarse los auxiliares ejemplificados a continuación, a saber, también puede usarse auxiliares tales como caseína, gelatina, almidón, metil celulosa, carboximetil celulosa, goma árabe, poli(vinil alcohol)es, trementina, aceite de salvado, bentonita y ligninsulfonatos.

Para mejorar la fluidez de un producto sólido, pueden usarse también los auxiliares siguientes, a saber, pueden usarse auxiliares tales como ceras, estearatos, alquil fosfatos, etc.

20 Los auxiliares tales como los productos de condensación de ácidos naftalensulfónicos y fosfatos policondensados pueden ser usados como un peptizador para los productos dispersables.

Los auxiliares tales como aceites de silicona también pueden usarse como agente antiespuma.

25 Los auxiliares tales como 1,2-benzisotiazolin-3-ona, p-cloro-m-xilenol, butil p-hidroxibenzoato también pueden ser agregados como un conservante.

Además, si fuera necesario, agentes de extensión funcionales, mejoradores activos tales como inhibidor de descomposición metabólico como butóxido del piperonilo, agente anticongelante tal como propilenglicol, antioxidantes tales como BHT, también pueden ser agregados absorbentes ultravioletas, y otros aditivos.

30 El contenido del compuesto como ingrediente activo puede variar según sea requerido, y el compuesto como ingrediente activo puede ser usado en una

proporción apropiadamente elegida en la escala de 0.01 a 90 partes en peso por 100 partes de los agentes agrohortícolas. Por ejemplo, en polvos o gránulos, el contenido conveniente del compuesto como ingrediente activo es de 0.01 a 50% en peso. En la concentración emulsionable o polvo humectable, también es de 0.01 a 50% en peso.

5 El agente agrohortícola de la presente invención es utilizado para controlar una variedad de plagas de insecto de la manera siguiente: es aplicado a un cultivo en el cual se espera que aparezcan las plagas de insecto, o un sitio en donde no se desea la aparición o crecimiento de plagas de insecto, tal como está o después de ser apropiadamente diluído o suspendido en agua o lo similar, en una cantidad eficaz para el control de las plagas de insecto.

La dosificación aplicada del agente agrohortícola de la presente invención dependerá de los diversos factores tales como propósito, plagas de insecto a ser controlado, estado de crecimiento de planta, tendencia de aparición de plagas de insecto, tiempo, condiciones ambientales, forma de formulación, método de aplicación, sitio de aplicación y tiempo de aplicación. Puede elegirse apropiadamente en la escala de 0.001 g a 10 kg, preferentemente 0.01 g a 1 kg, (en lo que se refiere al compuesto como ingrediente activo) por acre dependiendo de los propósitos.

El agente agrohortícola de la presente invención puede usarse en una mezcla con otros insecticidas agrohortícolas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, plaguicidas bióticos o lo similar para extender tanto el espectro de especies de plaga de insecto controlable como el período de tiempo cuando es posible la aplicación eficaz o para reducir la dosificación. Además, puede usarse el insecticida agrohortícola de la presente invención en una mezcla con herbicidas, reguladores de crecimiento de planta, fertilizantes o lo similar, dependiendo de las situaciones de aplicación.

25 Como otros insecticidas agrohortícolas, acaricidas y nematocidas que se usan para el propósito anterior pueden ejemplificarse los insecticidas agrohortícolas, acaricidas y nematocidas, tales como Etion, Triclorfon, Metamidofos, Acefato, Diclorvos, Mevinfos, Monocrotofos, Malation, Dimetoato, Formotion, Mecarbam, Vamidotion, Tiometon, Disulfoton, Oxideprofos, Naled, Metilparation, Fenitrothion, Cianofos, Propafos, Fention, Protiofos, Profenofos, Isofenfos, Temefos, Phentoato, Dimetilvinfos, Clorfenvinfos, Tetraclovinfos, Foxim, Isoxation, Piraclofos, Metidation, Clorpirifos,

Clorpirifos-metilo, Piridafention, Diazinon, Pirimifosmetil, Fosadona, Fosmet, Dioxabenzofos, Quinalfos, Terbufos, Etoprofos, Cadusafos, Mesulfenfos, Spiroclifofen, Metaflumizona, Flubendiamida, DPS (NK-0795), Fosfocarb, Fenamifos, Isoamidofos, Fostiazato, Isazofos, Etoprofos, Fention, Fostietano, Diclofention, Tionazin, Sulprofos, 5 Fensulfotion, Diamidafos, Piretrina, Aletrina, Praletrina, Resmetrina, Permetrina, Teflutrina, Bifentrina, Fenpropatrina, Cipermetrina, α -Cipermetrina, Cihalotrina, λ -Cihalotrina, Deltametrina, Acrinatrina, Fenvalerato, Esfenvalerato, Cicloprotrina, Etofenprox, Halfenprox, Silafluofen, Flucitrinato, Fluvalinato, Metomil, Oxamil, Tiodicarb, Aldicarb, Alanicarb, Cartap, Metolcarb, Xililcarb, Propoxur, Fenoxicarb, Fenobucarb, Etiofencarb, 10 Fenotiocarb, Bifenazato, BPMC, Carbarilo, Pirimicarb, Carbofuran, Carbosulfan, Furatiocarb, Benfuracarb, Aldoxicarb, Diafentiuron, Diflubenzuron, Teflubenzuron, Hexaflumuron, Novaluron, Lufenuron, Flufenoxuron, Clorfluazuron, óxido de Fenbutatina, hidróxido de Triciclohexiltina, oleato de sodio, oleato de potasio, Metopreno, Hidropreno, Binapacril, Amitraz, Dicofol, Kersen, Clorobenzilato, Bromopropilato, Tetradifon, 15 Bensultap, Benzoximato, Tebufenozida, Metoxifenozida, Piridalilo, Cromafenozida, Propargita, Acequinosil, Endosulfan, Diofenolan, Clorfenapil, Fenpiroximato, Tolfenpirad, Fipronil, Tebufenpirad, Triazamato, Etoxazol, Hexitiazox, sulfato de Nicotina, Nitenpiram, Acetamiprid, Tiaclopid, Imidaclopid, Tiametoxam, Clotianidin, Dinotefuran, Fluazinam, Piriproxifen, Hidrametilnon, Pirimidifen, Piridaben, Ciromazin, TPIC (isocianurato de 20 tripropilo), Pimetrozin, Clofentezin, Buprofedín, Thiociclam, Fenazaquin, Cinometionato, Indoxacarb, complejos de Polinactina, Milbemectina, Abamectina, Emamectin-benzoato, Spinosad, BT (Bacillus thuringiensis), Azadiractina, Rotenona, Hidroxipropil almidon, clorhidrato de Levamisol, Metam-sodio, tartrato de Morantel, Dazomet, Triclamida, Pasteuria penetrans, Monacrosporium-phymatophagum, etc.

25 Como los fungicidas agrohortícolas usados para el mismo propósito como el anterior, pueden ejemplificarse los fungicidas agrohortícolas tales como azufre, azufre de cal, sulfato de cobre básico, Iprobenfos, Edifenfos, Tolclofos-metilo, Tiram, Policarbamato, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Tiofanato, metil Tiofanato, Benomil, acetato de Iminoctadina, albecilato de Iminocutadina, Mepronil, Flutolanil, Pencicuron, 30 Furametpil, Tifluzamida, Metalaxil, Oxadixil, Carpropamid, Diclofluanid, Flusulfamida, Clorotalonil, Cresoxim-metilo, Fenoxanil, Himexazol, Etridiazol, Fluoroimida, Procimidona,

Vinclozolin, Iprodiona, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizol, Ipconazol, Fluconazol, Propiconazol, Difenconazol, Myclobutanil, Tetraconazol, Hexaconazol, Tebuconazol, Tiadinil, Imibenconazol, Procloraz, Pefurazoato, Ciproconazol, Isoprotilano, Fenarimol, Pirimetanil, Mepanipirim, Pirifenox, Fluazinam, Triforina, Diclomezina, Azoxistrobina, 5 Tiadiazina, Captan, Probenazol, Acibenzolar-S-metilo, Ftalida, Triciclazol, Piroquilon, Cinometionat, ácido Oxolínico, Ditianon, Casugamicina, Validamicina, Polioxin, Blasticidin, Estreptomicina, etc.

De manera similar, como los herbicidas, pueden ejemplificarse los herbicidas tales como Glifosato, Sulfosato, Glifosinato, Bialafos, Butamifos, Esprocarb, 10 Prosulcarb, Bentiocarb, Piributicarb, Asulam, Linuron, Dimron, Isouron, Bensulfuron metilo, Ciclosulfamuron, Cinosulfuron, Pirazosulfuron etilo, Azimsulfuron, Imazosulfuron, Tenilclor, Alaclor, Pretilaclor, Clomeprop, Etobenzanid, Mefenacet, Pendimetalina, Bifenox, Acifluorfen, Lactfen, Cihalofof-butilo, Ioxinil, Bromobutida, Aloxidim, Setoxidim, Napropamida, Indanofan, Pirazolato, Benzofenap, Piraflufen-etilo, Imazapil, Sulfentrazona, 15 Cafenstrol, Bentoxazon, Oxadiazon, Paraquat, Diquat, Piriminobac, Simazina, Atrazina, Dimetametrina, Triaziflam, Benflesato, Flutiacet-metilo, Quizalofop-etilo, Bentazon, peróxido de calcio, etc.

Como los plaguicidas bióticos, puede esperarse el mismo efecto como el anterior usando el agente agrohortícola de la presente invención en una mezcla, por 20 ejemplo, con las formulaciones virales obtenidas del virus de polihedrosis nuclear (NPV), virus de granulosis (GV), virus de polihedrosis citoplásmica (CPV), virus de entomopox (EPV), etc.; plaguicidas microbianos utilizados como insecticidas o nematicidas, tales como Monacrosporium phymatophagum, Steinernema carpocapsae, Steinernema kushidai, Pasteuria penetrans, etc.; plaguicidas microbianos utilizados como fungicidas, 25 tales como Trichoderma lignorum, Agrobacterium radiobactor, Erwinia carotovora no patógena, Bacillus subtilis, etc.; y los plaguicidas bióticos utilizados como herbicidas, tales como Xanthomonas campestris, etc.

Adicionalmente, el agente agrohortícola de la presente invención puede ser usado en combinación con plaguicidas bióticos que incluyen a los enemigos naturales 30 tales como la avispa parasitaria (Encarsia formosa), avispa parasitaria (Aphidius colemani), mosquito de agalla Aphidoletes aphidimyza, avispa parasitaria (Diglyphus

isaea), ácaro parasitario (Dacnusa sibirica), ácaro predador (Phytoseiulus persimilis), ácaro predador (Amblyseius cucumeris), bicho predador (Orius sauteri), etc.; plaguicidas microbianos tales como Beauveria brongniartii, etc.; y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona, 14-metil-1-octadeceno, etc.

EJEMPLOS

Los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I), y derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II) y ácido pirazolcarboxílico sustituido representado por la fórmula (IV), los cuales son compuestos intermedios, de la presente invención, serán explicados en lo siguiente con referencia a Ejemplos, los cuales no deberán ser interpretados como restrictivos de la presente.

EJEMPLO 1

Producción de ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (compuesto No. 4-1)

4-yodo-1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol (8.7 g, 30 mmoles) fue disuelto en tetrahidrofurano (87 ml), y fue agregada una solución (1.6 M; 28 ml) de n-butil litio en hexano despacio bajo una atmósfera de argón con enfriamiento con hielo seco-acetona (no superior que -60°C). Después de agitar a -70°C por 30 min, la mezcla fue calentada gradualmente a la temperatura ambiente mientras se hacía burbujear anhídrido carbónico. La mezcla de la reacción fue vertida en el agua, la capa orgánica fue eliminada, y la capa acuosa fue acidificada con ácido clorhídrico. La capa acuosa fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida. Los cristales en bruto obtenidos fueron lavados con hexano para dar el compuesto deseado (4.67 g) como cristales. Rendimiento 74%

Propiedad: punto de fusión 124 – 125.5°C

EJEMPLO 2

Producción de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-211)

El ácido 1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (2.09 g; 10 mmoles) fue disuelto en cloruro de tionilo, y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 3 hr. La mezcla fue concentrada bajo presión reducida para dar el cloruro de 1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carbonilo. Esto fue agregado a una solución de 3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (3.29 g; 10 mmoles) y trietilamina (3.03 g; 30 mmoles) en tetrahidrofurano (30 ml), y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 2 hr. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, lavada con agua, y secada sobre sulfato de magnesio. Después de concentración bajo presión reducida, el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:1) para dar el compuesto deseado (3.64 g) como cristales.

Rendimiento 70%.

Propiedad: punto de fusión 138-139°C.

EJEMPLO 3

Producción de N-metoximetil-N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-222)

El hidruro de sodio (32 mg; 60%; 0.8 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (250 mg; 0.48 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, una solución de éter metílico del clorometil (64 mg; 0.8 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml) fue agregada y la mezcla fue agitada por 5 hr. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluído y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio, y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=2:1) para dar el compuesto deseado

(238 mg).

Rendimiento 88%

Propiedad: n_D 1.4669 (22.4°C).

5

EJEMPLO 4

Producción de 2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto No. 3-1)

5-n-propil-2-metil-anilina (14.9 g; 0.1 moles) fueron diluidos en un solvente
mezclado (300 ml) de terc-butil metiléter-agua (1:1), y yoduro de heptafluoroisopropilo
(29.6 g; 0.1 moles), sulfato ácido de tetrabutilamonio (3.4 g; 0.01 moles), carbonato ácido
de sodio (8.4 g; 0.1 moles) y ditionito de sodio (17 g; 0.1 moles) fue agregado
consecutivamente. La mezcla fue agitada toda la noche a la temperatura ambiente. La
mezcla de reacción fue diluida en hexano, lavada dos veces con 3N ácido clorhídrico, y
fue lavada con carbonato ácido de sodio acuoso y solución salina saturada. La capa
orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio, y fue concentrada bajo presión reducida.
El residuo fue purificado por cromatografía de gel de sílice (hexano:acetato de etilo 5:1)
para dar el compuesto deseado (28.5 g).

Rendimiento 90%

Propiedad: $^1\text{H-RMN}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}]$, valor de δ (ppm) 7.09(s; 1H); 6.54(s; 1H);
3.76(bs; 2H); 2.63(m; 2H); 2.13(s; 3H); 1.58(m; 2H); 0.96(t; 3H)

EJEMPLO 5

Producción de 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n- propilanilina (compuesto No. 3-3)

2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (1.6 g; 5
mmoles) fue disuelto en una solución 28% (9.6 g) de metóxido de sodio en metanol, y la
mezcla fue calentada bajo reflujo por 3 hr. Después de permitir enfriar, la mezcla de
reacción fue vertida en agua helada y fue extractada con acetato de etilo. La capa
orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada

bajo presión reducida. El residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=5:1) para dar el compuesto deseado (1.31 g).

Rendimiento 79%.

Propiedad: ^1H -RMN[CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7.10(s; 1H); 6.66(s; 1H);

5 3.72(bs; 2H); 3.42(s; 3H); 2.84(m; 2H); 2.14(s; 3H); 1.61(m; 2H); 1.00(t; 3H).

EJEMPLO 6

Producción de 2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina

(compuesto No. 3-2)

10

2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (1.6 g; 5 mmoles) fue disuelto en dimetilsulfóxido (20 ml), borohidruro de sodio (378 mg, 10 mmoles) fue agregado por porciones pequeñas, y la mezcla fue agitada a 60°C por 5 hr. Fue agregado hielo a la mezcla de reacción por porciones pequeñas, y entonces el ácido acético fue agregado por gotas. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, y la capa orgánica fue lavada 4 veces con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida para dar el compuesto deseado (1.47 g).

15

Rendimiento: 99%

Propiedad: ^1H -RMN[CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7.18(s; 1H); 6.54(s; 1H);

20 4.45-4.20(br; 2H); 4.27(m; 1H); 2.50(dd; 2H); 2.14(s; 3H); 1.57(m; 2H); 0.98(t; 3H).

EJEMPLO 7

Producción de N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propylfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 2-15)

25

El cloruro de 1,3,5-Trimetilpirazol-4-carbonilo (172 mg, 1 mmoles), 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenilamina (329 mg, 1 mmol) y trietilamina (303 mg, 3 mmoles) fue disuelto en tetrahidrofurano (10 ml), y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 3 hr. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, y fue lavada con agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro y fue concentrada bajo presión reducida. El residuo obtenido fue purificado por

30

cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:2) para dar el compuesto deseado (360 mg).

Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 132-134°C.

5

EJEMPLO 8

Producción de N-acetil-N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 2-16)

10 El hidruro de sodio (32 mg; 60%; 0.8 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (250 mg; 0.53 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de anhídrido acético (80 mg; 15 0.78 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluido, y la mezcla fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el 20 compuesto deseado (139 mg).

Rendimiento: 52%

Propiedad: n_D^{25} 1.4905 (25.9°C).

EJEMPLO 9

Producción de N-{2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 2-13)

25 En la misma manera como en el Ejemplo 7 sólo que 2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina fue usada en lugar de 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-30 1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil, la reacción fue realizada durante 3 hr para dar el compuesto deseado.

Rendimiento: 66%

Propiedad: punto de fusión 128-131°C.

EJEMPLO 10

5 Producción de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}- 1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-155)

El cloruro de 1,3,5-trimetilpirazol-4-carbonilo (3.93 g; 22.8 mmoles), 3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (5.0 g; 15.2 mmoles); y
 10 trietilamine (3.07 g; 30.4 mmoles) fue disuelto en tetrahidrofurano (100 ml); y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 5 hr. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, y fue lavada con agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro y fue concentrada bajo presión reducida. Los cristales obtenidos en bruto fueron lavados con éter para dar el compuesto deseado (5.62 g).

15 Rendimiento: 80%

Propiedad: punto de fusión 189-190°C.

EJEMPLO 11

20 Producción de N-etoximetil-N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-145)

El hidruro de sodio (29 mg; 60%; 0.73 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (260 mg; 0.48 mmoles) en
 25 tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de clorometil etil éter (70 mg; 0.73 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluído, y la mezcla fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue
 30 concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el compuesto deseado

(200 mg).

Rendimiento: 69%

Propiedad: n_D 1.4892 (22.4°C).

5

EJEMPLO 12

Producción de N-isobutiloxycarbonil-N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-152)

El hidruro de sodio (29 mg; 60%; 0.73 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (260 mg; 0.48 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de clorocarbonato de isobutilo (100 mg; 0.73 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluido y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:1) para dar el compuesto deseado (280 mg).

20

Rendimiento: 91%

Propiedad: n_D 1.4829 (22.3°C).

EJEMPLO 13

Producción de N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-123)

25

El cloruro de 1,3,5-Trimetilpirazol-4-carbonilo (2.09 g; 10.0 mmoles), 3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (2.0 g; 6.69 mmoles), y trietilamina (1.35 g; 13.4 mmoles) fueron disueltos en tetrahidrofurano (60 ml), y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 5 hr. La mezcla de reacción fue diluida con acetato de etilo, y fue lavada con agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por

30

cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el compuesto deseado (2.41 g).

Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 148-151°C.

5

EJEMPLO 14

Producción de N-acetil-N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-125)

10 El hidruro de sodio (38 mg; 60%, 0.96 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (300 mg; 0.64 mmoles) fue
 15 agregada por gotas en tetrahidrofurano (5 ml). Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de cloruro de acetilo (75 mg; 0.96 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de
 20 reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluido y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el compuesto deseado (90 mg).

Rendimiento: 28%.

Propiedad: n_D 1.5021 (22.5°C).

PRODUCCION DE EJEMPLO DE REFERENCIA 1

4-yodo-1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol

25

El yodo (30 g) fue disuelto en 60% ácido sulfúrico (humeante, 80 g), y fue agregado 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol (13.12 g; 80 mmoles) despacio bajo enfriamiento con hielo. La mezcla fue agitada a 0°C por 2 hr. La mezcla de reacción fue vertida en agua helada y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada
 30 con tiosulfato de sodio acuoso y solución salina saturada, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida. Los cristales en bruto obtenidos

fueron lavados con hexano para dar el compuesto deseado (20 g) como cristales.

Rendimiento: 86%

Propiedad: ¹H-RMN[CDCl₃/TMS, valor de δ (ppm)] 3.98(s; 3H); 2.26(s; 3H).

Los ejemplos de formulación y ejemplo de prueba típicos de la presente invención se describen a continuación pero los mismos no deben ser interpretados como limitando el alcance de la invención.

Como se utiliza en los ejemplos, los términos "parte" y "partes" están en peso.

Ejemplo de Formulación 1

Cada compuesto en el Cuadro 1 o Cuadro 2	10 partes
Xileno	70 partes
N-metilpirrolidona	10 partes
Mezcla de polioxietilen nonilfenil éter y alquilbencensulfonato de calcio	10 partes

Una concentración emulsionable fue preparada mezclando uniformemente los ingredientes anteriores para efectuar la disolución.

Ejemplo de Formulación 2

Cada compuesto en el Cuadro 1 o Cuadro 2	3 partes.
Polvo de arcilla	82 partes
Polvo de tierra de diatomeas	15 partes

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

Ejemplo de Formulaición 3

Cada compuesto en el Cuadro 1 o Cuadro 2	5 partes.
polvo mezcla de bentonita y arcilla	90 partes
Ligninsulfonato de calcio	5 partes

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

seguido por granulación y secado.

Ejemplo de Formulación 4

Cada compuesto

- 5

enumerado en el Cuadro 1 o Cuadro 220 partes
- Mezcla de caolín y ácido silícico sintético
- de alta-dispersión75 partes
- Mezcla de polioxietilen nonilfenil éter y
- alquilbencensulfonato de calcio5 partes
- 10

Fue preparado un polvo humectable mezclando uniformemente y moliendo los ingredientes anteriores.

EJEMPLO DE PRUEBA 1

La acción acaricida en el ácaro arañuela de dos manchas (Tetranychus urticae)

- 15

El disco de lámina de poroto riñón con un diámetro de 2 cm fue colocado en el papel de filtro humedecido. Se inocularon diez hembras adultas de arañuela de dos manchas en cada disco de hoja, y fue rociado con 50 ml de solución de prueba, preparada diluyendo una formulación que contiene cada compuesto enumerado en el
- 20

Cuadro 1 o Cuadro 2 como ingrediente activo ajustando cada una de las concentraciones a 500 ppm, 50 ppm y 5 ppm.. Dos días después del tratamiento, las arañuelas sobrevividas fueron contadas. La mortalidad corregida fue calculada por la ecuación siguiente y la actividad acaricida fue evaluada según el criterio ilustrado a continuación. El experimento fue realizado con dos copias bajo la condición de 25°C.

25

Mortalidad corregida (%)

=

Número de ácaros sobrevivientes en el grupo sin tratar

—

Número de ácaros sobrevivientes en el grupo tratado

Número de ácaros sobrevivientes en el grupo sin tratar

× 100

- 30

Criterio:

A --- Mortalidad corregida 100%

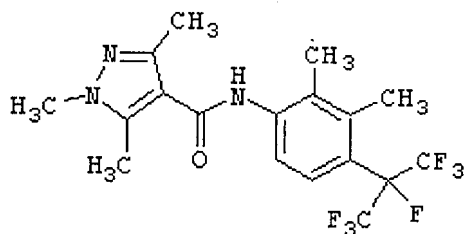
B --- Mortalidad corregida 99%-90%

C --- Mortalidad corregida 89%-80%

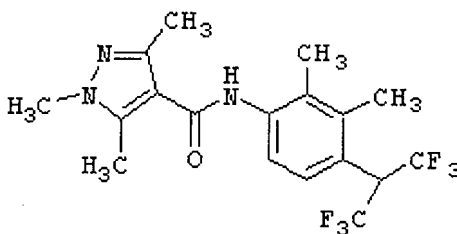
D --- Mortalidad corregida 79%-50%.

Como compuestos comparativos, fueron utilizados los compuestos Nros. 1-

5 163 y 1-164 descritos en JP-A-2003-48878.



10 (1-163)



(1-164)

Como resultado de la prueba indicada precedentemente, los compuestos

Nros. 1-1, 1-3, 1-4, 1-6, 1-8, 1-10, 1-12, 1-13, 1-15, 1-16, 1-25 a 1-28, 1-31, 1-34 a 1-37,

1-45, 1-47 a 1-49, 1-51 a 54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-67, 1-69 a 1-72, 1-74 a 1-76, 1-89, 1-101

a 1-114, 1-120 a 1-160, 1-176 a 1-225, 1-228, 1-234, 1-246, 1-258, 1-260, 1-266, 1-270,

15 1-282, 1-285, 1-294, 1-306 a 1-325, 1-327 a 1-332, 1-335 a 1-337, 1-339 a 1-342, 1-344 a

1-358, 1-361 a 1-373, 1-375 a 1-380, 1-382 a 1-384, 1-386 a 1-389, 1-391 a 1-394, 1-396,

1-399 a 1-406, 1-412 a 416, 1-420 a 1-423, 1-425 a 1-427, 1-429 a 1-433, 1-435 a 1-439,

1-441 a 1-445, 1-448, 1-450 a 1-452, 1-454 a 1-463, 1-467 a 1-470, 1-473, 1-477, 1-478,

1-482 a 1-487, 1-489 a 1-493, 1-496 a 1-502, 1-510, 1-514, 1-515, 1-518, 1-519, 1-523 a

20 1-527, 1-531, 1-539 a 1-541, 1-546 a 1-549, 2-13, 2-15 a 2-17, 2-21 a 2-23, 2-25, 2-34, 2-

36 a 39, 2-41 a 43 y 2-45 de la presente invención demostraron una actividad A en

cualquier concentración de 500 ppm, 50 ppm y 5 ppm, y los compuestos Nros. 1-23, 1-32,

1-78, 1-173, 1-284, 1-326, 1-334, 1-338, 1-343, 1-385, 1-397 a 1-398, 1-408, 1-410, 1-

417, 1-440, 1-447, 1-449, 1-464, 1-472, 1-475, 1-476, 1-479, 1-480, 1-504 a 1-506, 1-509,

25 1-521, 1-529, 1-530, 1-533, 1-542, 2-26 a 2-33, 2-40 y 2-46 demostraron una actividad A

en cualquier concentración de 500 ppm y 50 ppm. En contraste, los dos compuestos de

control ni siquiera demostraron una actividad acaricida a la concentración de 500 ppm.

Actividad Industrial

30 Según la presente invención, se pueden proveer agentes agrohortícolas,

particularmente insecticidas y acaricidas, que poseen propiedades superiores en

comparación a las técnicas convencionales.

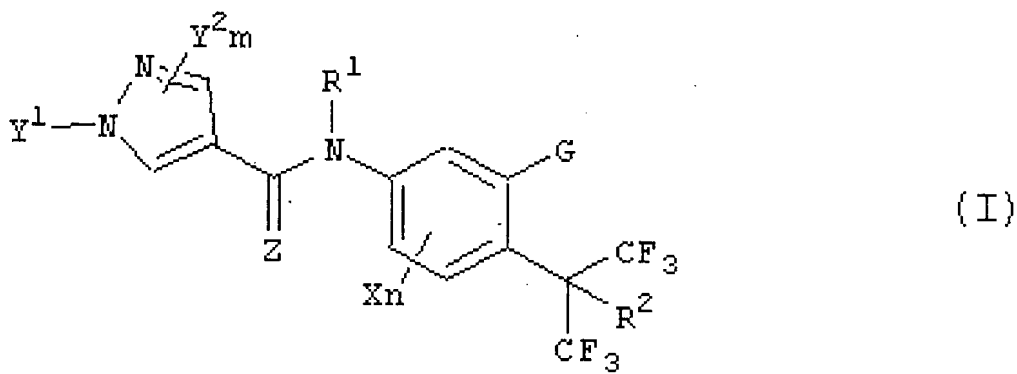
Esta solicitud está basada en las solicitudes de patente Nos. 234405/2005, 322531/2005 y 114937/2006 presentadas en Japón, cuyos contenidos son incorporados a la presente por referencia.

5 Mientras esta invención se ha ilustrado y se ha descrito con referencia a las modalidades preferidas de la misma, los expertos en la técnica entenderán que pueden hacerse varios cambios en la forma y detalles en la misma sin apartarse del alcance de la invención abarcado por las reivindicaciones anexas.

10 Todas las patentes, las publicaciones patentes y otras publicaciones identificadas o referenciadas están incorporados dentro de la presente por referencia en su totalidad.

RESUMEN DE LA INVENCION

Se describe un derivado de anilida del ácido pirazolcarboxílico sustituido representado por la siguiente fórmula (I):



pesticida o

acaricida para uso agrohortícola; (en la fórmula, R^1 representa H, un alquilo, un alquilcarbonilo, un alquenilcarbonilo, un cicloalquilo, un fenilalquilo, fenilcarbonilo y lo similar; R^2 representa H, un halógeno, alquilo, CN, OH, un alcoxilo, un fenoxilo, un feniltio, un fenilsulfonilo y lo similar; G representa un alquilo, un alquenilo, un alquinilo, un cicloalquilo, un cicloalquenilo de C_3-C_{10} y lo similar; Z representa O ó S; X representa H, un halógeno, CN, NO_2 , un alquilo y lo similar; Y^1 representa H, un alquilo, un alquenilo, un fenilo, un alcoxialquilo y lo similar; Y^2 representa H, un halógeno, CN, NO_2 , OH, un mercapto, un amino, un carboxilo, un alquilo de C_1-C_6 , un fenilo, un fenoxilo, un anillo heterociclo y lo similar, m representa 1 ó 2; y n representa un número de 1-3).

41B

P08/85F

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	Espacio libre para el adhesivo de radicación
--	--

**DIRECCION DE NUEVAS CREACIONES
CONVERSION, DIVISION Y FUSION DE SOLICITUDES**

1. Identificación del Trámite

☐ Conversión	☒ División	☐ Fusión
☒ Patente de Invención		
☐ Patente de Modelo de Utilidad		
☐ Registro de Diseño Industrial		
☐ Esquema de Trazado de Circuitos Integrados		

2. Datos del solicitante

Persona Natural ☐ Persona Jurídica ☒

NIHON NOHYAKU CO., LTD.

Nombre o Denominación / Nombre social

Tipo de empresa Micro ☐ Pequeña ☐ Mediana ☐ Otra _____

Nacionalidad/País de constitución	Dirección del titular	Ciudad
JAPON	2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku	Tokyo 103-8236
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico

☐ Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del representante o apoderado

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO	39.779.654 de Bogotá	70.819 de C.S.J.
Apellidos y Nombre	Documento de Identificación	T.P. No.

Dirección del representante	Ciudad	
Calle 94 A No. 7 A - 09	Bogotá	
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
info@castellanosyco.co	7 550158	7 560770

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación.

4. Datos del trámite

CONVERSION	
Expediente	
De:	
A:	

DIVISION	
Expediente	08.023.840
No. de Divisional	1

FUSION	
Expediente	
De:	
A:	

5. Comprobante de Pago No. 12-0086230

Fecha Agosto 22, 2012

6. Anexos

☐

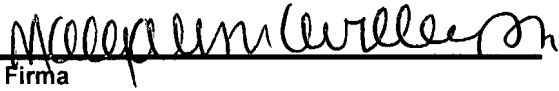
Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación

☒

Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación

7. Firma

MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO
Nombre y Apellidos


Firma

39.779.654 de Bogotá
C.C.

70.819 C.S.J.
T.P.

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA	RECIBO DE CAJA	No. 12 - 0086230
		Bogotá D.C., Agosto 22 de 2012 - 14:46:02

RECIBIDO DE : CASTELLANOS Y Y CO					NI 800.174.641	
*** Soporte del Pago ***						
TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO	
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	445930715	22/08/2012	9.325.000.00	

*** Conceptos Pagados ***				
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr.UNDITARIO	Vr.CONCEPTO
1 50005-01-01	SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE INVENCIÓN	590.000.00	590.000.00
				\$590.000.00
=====				

SON: **QUINIENTOS NOVENTA MIL PESOS MONEDA CORRIENTE**

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-023840- -00005-0000
Fecha: 2012-09-24 14:28:06 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 523 RESPUESTA Folios: 194

COLOMBIA

PODER

El (los)
NIHON NOHYAKU CO., LTD.

Domiciliados en
2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo
103-8236 JAPON

Nombran por el presente a XIMENA CASTELLANOS A. y/o
MARGARITA CASTELLANOS A. abogadas con oficinas en la
Calle 94A No. 7A-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad
Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para
que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas
de los órdenes administrativo, contencioso -administrativo y
judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y
gestiones:

- a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos
industriales; registro de marcas de fabrica, de servicio,
colectivas o defensivas y de denominaciones de origen,
depósito de nombres y enseñas comerciales; su
renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de
nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de
licencias de uso de esos derechos;
- b) Para la obtención de registros sanitarios;
- c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad,
medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales,
administrativos o contencioso - administrativos que
promovamos o se nos promuevan.

Pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados
sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar,
renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados
judiciales y extrajudiciales.

Finalmente, este poder ratifica la validez de todos los actos y
solicitudes que, a nombre de la poderdante hubieren realizado
los apoderados en relación con las facultades anteriormente
enumeradas, antes de la suscripción del presente poder

Dado y firmado hoy 15 de Mayo de 2008

en Osaka, JAPON

por NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Shukichi Ohuchi - Presidente

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Se requiere legalización consular o mediante apostilla)

POWER OF ATTORNEY

I (we) the undersigned
NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Of

2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo
103-8236 Japan

hereby grant(s) Power of Attorney to XIMENA
CASTELLANOS A. and /or MARGARITA CASTELLANOS a.
attorneys residing at Calle 94A No. 7A-09, Bogotá- Colombia,
to

and to obtain the protection of my (our Industrial Property, for
which purpose we authorize the said attorneys to represent us
before any authorities, or persons, specially those,
administrative, contentious and judicial, in all matters
concerning the following:

- a) Obtainment of patents, models and designs, registration of
trademarks, service, collective and defensive marks, and of
designations of origin; the deposit of trade names and
ensigns; its renewal, extension, recordal of assignments,
change of name or domicile, voluntary cancellation, and the
registration of licenses of use of the above rights;
- b) For the obtainment of Sanitary registrations;
- c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement,
granting of licenses; and in general the civil, criminal and
administrative suits related to those rights; actions and
suits instituted by us or against us;

In all the above matters they may substitute this power of
attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce,
accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of
court.

Finally, this power of attorney ratifies the validity of all acts
and applications made by the representatives in the name of
the signatory of this power of attorney, with regard to the
faculties above given, before the execution of the present
power of attorney.

Given and signed this

in
NIHON NOHYAKU CO., LTD.

by 
Shukichi OHUCHI
President

(Notary shall execute on the other side)

(Consular legalization or apostille is required)

CASTELLANOS & CO

ABOGADOS COLOMBIA

Calle 94A No. 7A-09- P.O.Box 6349 - Bogotá, Colombia

Tels.: (571) 610 74 20 / - Fax (571) 610 07 08 - e-mail info@castellanosyco.com



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Country: **JAPAN**

This public document

2. has been signed by **Junji MIYASHITA**

3. acting in the capacity of **Notary Public of the Osaka
Legal Affairs Bureau**

4. bears the seal/stamp of **Junji MIYASHITA, Notary Public**

Certified

5. at **Osaka**

6. **MAY. 16. 2008**

7. by the Ministry of Foreign Affairs

8. No. **2415**

9. Seal/stamp:



10. Signature:

T. Tanaki
Toshihiko TANAKI

For the Minister for Foreign Affairs



登簿番号平成20年第206号

嘱託人大内脩吉は、代理人 ソン ヘジナ ヒュン により
当公証人の面前でこの証書の署名を自認した。――

上記大内脩吉は、平成20年1月11日付の
登記簿謄本によって日本農薬株式会社の代表
取締役であることに相違ないことが認められ
ている。――

さらに、上記日本農薬株式会社は、上記登記簿謄本に
よって日本国東京都中央区日本橋1丁目2番5号に所在
し、日本の法律に基づいて設立された会社であることに
相違ないことが認められる。――

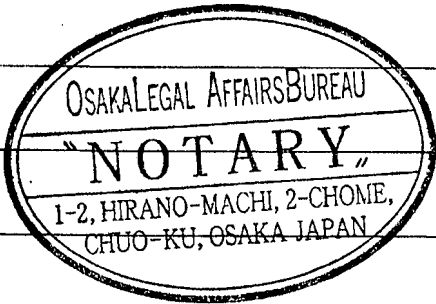
平成20年 5 月 15 日当公証人役場において。――

大阪市中心区平野町2丁目1番2号（沢の鶴ビル内）

大阪法務局所属

公証人

宮下 雅二



大阪法務局所属 公証人役場



Registered No.

206 - 2008

000103

NOTARIAL CERTIFICATE

This is to certify that Regina Hyun Son, an agent of Mr. Shukichi OHUCHI, President of NIHON NOHYAKU CO., LTD., as evidenced by a certified copy of the Commercial Register issued on January 11, 2008, has stated in my very presence that the said Mr. Shukichi OHUCHI has acknowledged to have signed the attached document.

In addition to the above, I hereby certify that said NIHON NOHYAKU CO., LTD. is a company duly organized and legally existing under the laws of Japan as evidenced by a certified copy of the Commercial Register issued on January 11, 2008 and that the main office of this company is located on 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 103-8236 Japan.

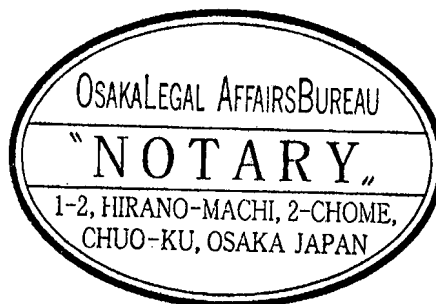
Dated this 15th day of May, 2008.

Junji Miyashita

JUNJI MIYASHITA

NOTARY

Osaka Legal Affairs Bureau
1-2, Hirano-machi 2-chome
Chuo-ku, Osaka Japan



総 第 1 7 5 0 号

証 明

大阪法務局所属公証人 宮下 準二

平成 20 年 5 月 16 日付

平成 20 年 登簿 第 206 号

この認証の付与は、在職中の公証人が
その権限に基づいてしたものであり、
かつ、その押印は、真実のものであること
を証明する。

平成 20 年 5 月 16 日
平成 年 月 日

大阪法務局長 高 野

伸



CERTIFICATE

This is to certify that the annexed Notarial Certificate has
been executed by Notary, duly authorized and practising in Osaka,
Japan, and that the Official Seal appearing on the same is genuine.

Date 08. 5. 16

Director of the Osaka Legal Affairs Bureau

-----TRADUCCION OFICIAL No. 06-12-01-----

De un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación lleva el sello y firma de la Traductora e Intérprete Oficial, Res. 2755/68 y 01144/97 de Minjusticia.-----

(Anexos a un documento de Poder de NIHON NOHYAKU CO, LTD.)

Registro No. 206 - 2008

CERTIFICADO NOTARIAL

Certifico por la presente que Regina Hyun Son, agente del señor Shukichi OHUCHI, Presidente de NIHON NOHYAKU CO., LTD. según lo evidencia con una copia certificada del Registro Comercial expedido el 11 de Enero de 2008, ha manifestado en mi propia presencia que dicho señor Shukichi OHUCHI ha reconocido haber firmado el documento adjunto.

Además de lo anterior, certifico por el presente que dicha NIHON NOHYAKU CO., LTD es una compañía debidamente constituida y existente legalmente bajo las leyes de Japón, según lo prueba mediante una copia certificada del Registro Comercial expedido el 11 de Enero de 2008 y que la oficina principal de esta compañía está localizada en 2-5 Nihmbashi 1-chome, Chuo.ku, Tokio 103-8236 Japón.

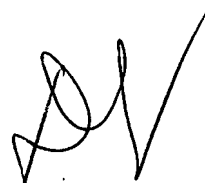
Dado hoy día 15 de Mayo de 2008.

(fdo) ilegible

Jinja MIYASHITA

NOTARIO

Oficina de Asuntos Legales de Osaka



1-2 Hirano-machi 2 chome

Chuo-ku, Osaka, Japón

(Sello) Oficina de Asuntos Legales de Osaka

NOTARIO – 1-2 Hirano-Mchi, 2-Chome – Chuo-ku, Osaka, Japón.

CERTIFICADO

Certifico por la presente que el Certificado Notarial anexo ha sido otorgado por Notario debidamente autorizado y en ejercicio en Osaka, Japón, y que el sello oficial que aparece en el mismo es auténtico.

Fecha: 08.5.16

Director de la Oficina de Asuntos Legales de Osaka

APOSTILLA

(Convención de La Haya de Octubre 5, 1961)

1. País: JAPON

Este documento público

2. ha sido firmado por: Jinji MIYASHITA

3. actuando en su carácter de: Notario Público de la Oficina de Asuntos Legales de Osaka

4. lleva el sello de Jinja MIYSAHITA, Notario Público

CERTIFICADO:

5. en Osaka

6. el día 16 de Mayo de 2008

7. por el Ministerio de Relaciones Exteriores

8. No. 2415

9. Sello

10. Firma:

(fdo) ilegible

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
2008 MAY 23 A 10:29
JEFE DE LEGALIZACIONES
OSAKA J.C.

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
166218
Jinji Miyashita
NOTARIO PUBLICO
OSAKA JAPAN
ASTORIA OREGON

DORA DUQUE DE BERNAL
TRADUCTORA JURADA OFICIAL
RES. 02755/68 Y 01144/87 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

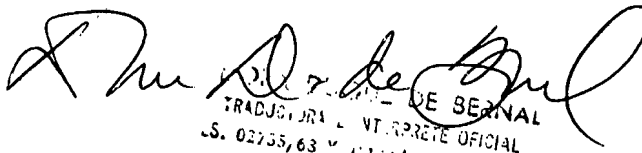
000107

Toshihiko TANAKI

Por el Ministerio de Relaciones Exteriores (Sello)

ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, D. C., Mayo 22, 2008


TRANSLADORA DE BERNAL
S. 02735, 63 V. 1011/07 - MINJUSTICIA
REP. DE COLOMBIA

DERIVADO DE ANILIDA DEL ACIDO PIRAZOLCARBOXILICO SUSTITUIDO O SAL
DEL MISMO, COMPUESTOS INTERMEDIOS DE LOS MISMOS, AGENTES
AGROHORTICOLAS, Y METODOS PARA LA UTILIZACION DE LOS MISMOS

5

CAMPO TECNICO

La presente invención se refiere a derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos o sales de los mismos, compuestos intermedios de los mismos, y agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas o acaricidas, conteniendo dichos compuestos como un ingrediente activo y método para utilización de los mismos.

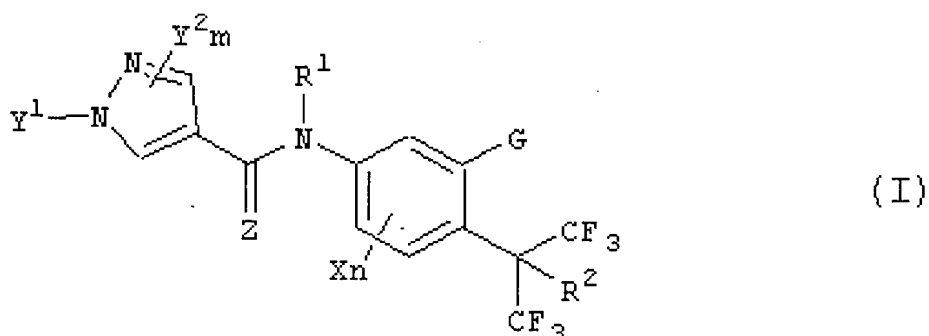
ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN

Convencionalmente, los derivados de pirazolcarboxamida sustituidos similares a la presente invención son conocidos por ser útiles como insecticidas agrohortícolas, fungicidas o acaricidas (por ejemplo, JP-A-2003-48878, JP-A-2004-189738 y JP-A-2004-269515). En JP-A-2003-48878, se describen los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos. Sin embargo, principalmente se limitan los sustituyentes en la fracción de anilina a sustituyentes de posición 2, el sustituyente de la posición 3 es exclusivamente del grupo metilo, y el compuesto descrito en la presente invención, en donde el grupo alquilo que tiene 2 o más átomos de carbono se introduce en la posición 3 no es incluido ni siquiera en su lista de compuestos. Además, la forma de metilo de posición 3 concretamente descrita en la misma no muestra una actividad acaricida. En la JP-A-2004-189738, se describen los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos. Sin embargo, se limitan los sustituyentes en la fracción de anilina al grupo alcoxilo, grupo alquiltio y grupo alquilamino, y el compuesto descrito en la presente invención, en donde el grupo alquilo que tiene 2 o más átomos de carbono que se introduce directamente en la posición 3 no es incluido ni siquiera en su lista de compuestos. En la JP-A-2004-269515, se describen los derivados de pirazolcarboxamida sustituidos. Sin embargo, sólo se describe un compuesto amida con la heterociclil amina, y no se describen los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos de la presente invención.

En la elaboración de cultivos en los campos agrícolas y hortícolas, los daños causados por las plagas de insecto son serios aún, y se desea el desarrollo de nuevos agentes agrohortícolas, particularmente el desarrollo de insecticidas y acaricidas debido a la generación de plagas de insecto resistentes a los agentes conocidos, y similares. Debido a que se requieren diversos mecanismos de economía de labor de granja debido al número creciente de la población trabajadora de granja envejecida, también se exige la creación de agentes agrohortícolas con propiedades convenientes para tal economía de trabajo de labor de granja, particularmente respecto a insecticidas y acaricidas.

Los presentes inventores han realizado extensos estudios en el desarrollo de nuevos agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas y acaricidas y como resultado, han encontrado que entre la amplia escala de compuestos descritos en el documento anterior mencionado, un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) en el cual un anillo de pirazol es seleccionado como la fracción de ácido carboxílico heterocíclico y un sustituyente específico que es introducido en la fracción de anilina en la posición 3, demuestra un efecto de control excelente como acaricida, no predicho en absoluto del contenido descrito en las referencias de la técnica anterior mencionada. Además, los inventores han encontrado que un compuesto intermedio de dicho compuesto, es decir unos derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II), y ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico o sal de mismo son compuestos nuevos, desconocidos en las referencias anteriores, y son útiles como compuestos intermedios para fabricar diversos derivados que tienen actividades fisiológicas como compuestos farmacéuticos, plaguicidas y lo similar, y así completaron la presente invención.

Concordantemente, la presente invención se refiere a derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I):



En donde

R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C_1-C_8 , 3a) un
 5 grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 4a) un grupo alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 5a) un grupo
 haloalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 6a) un grupo alquenilcarbonilo de C_2-C_6 , 7a) un grupo
 haloalquenilcarbonilo de C_2-C_6 , 8a) un grupo alquilcarbonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 9a)
 un grupo cicloalquilo de C_3-C_6 , 10a) un grupo halocicloalquilo de C_3-C_6 , 11a) un grupo
 cicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 12a) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-
 10 C_6 , 13a) un grupo alquenilo de C_2-C_6 , 14a) un grupo haloalquenilo de C_2-C_6 , 15a) un grupo
 alquinilo de C_2-C_6 , 16a) un grupo haloalquinilo de C_2-C_6 , 17a) un grupo alcoxi de C_1-C_{10}
 alquilo de C_1-C_6 , 18a) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 19a) un grupo
 alqueniloxi de C_2-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 20a) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alcoxi de C_1-C_6 alquilo
 de C_1-C_6 , 21a) un grupo alquiltio de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 22a) un grupo haloalquiltio de
 15 C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 23a) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 24a) un
 grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 25a) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6
 alquilo de C_1-C_6 , 26a) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 27a) un grupo
 monoalquilamino de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 28a) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alquilo
 de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 29a) un grupo feniloalcoxi
 20 de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 30a) un grupo fenilalcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 sustituido
 que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a)
 un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e)
 un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de
 C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo
 25 alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo
 de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 ,
 o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_{16} , 32a) un
 grupo alcoxi de C_1-C_6 alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C_1-
 30 C_6 , 34a) un grupo alqueniloxycarbonilo de C_2-C_6 , 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C_1-C_6 ,
 36a) un grupo monoalquilaminocarbonilo de C_1-C_6 , 37a) un grupo dialquilaminocarbonilo
 de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 38a) un grupo

- alcoxicarbonilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 39a) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 40a) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 41a) un grupo cianoalquilo de C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b)
- 5 un grupo ciano, c) un grupo nitro d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo
- 10 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un
- 15 grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 46a) un grupo
- 20 heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k)
- 25 un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 48a) un grupo fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes
- 30 seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un haloalquiltio de C₁-C₆

grupo, j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 50a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 , 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 54a) un grupo dialquifosfono de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 55a) un grupo dialquifosfonotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 56a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcoxicarbonil de C_1-C_6 aminotio de C_1-C_6 , 57a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcoxicarbonil de C_1-C_6 alquilaminotio de C_1-C_6 , 58a) un grupo dialquilaminotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 60a) un grupo halocicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 61a) un grupo alquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 62a) un grupo haloalquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo

alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) grupo un alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 65a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 66a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 67a) un grupo cicloalquil de C_3-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 68a) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 69a) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 70a) un grupo fenoxialcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 71a) un grupo fenoxialcoxycarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 72a) un grupo alquilcarboniloxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 73a) un grupo alquilcarbonil de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , o 74a) un grupo alcoxycarbonil de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 ;

R^2 es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 3b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 4b) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 5b) un grupo ciano, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , 8b) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , 9b) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 10b) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 ,

- 11b) un grupo alquiltio de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 12b) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 13b) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 14b) un grupo haloalquilsulfinil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 15b) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 17b) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 , 18b) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_3 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 19b) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , 20b) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , 21b) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , 22b) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , 23b) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 24b) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , 25b) un grupo amino, 26b) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , 27b) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 28b) un grupo fenoxilo, 29b) un grupo fenoxilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 32b) un grupo fenilsulfinilo, 33b) un grupo fenilsulfinilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 .

de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆,
 o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34b) un grupo fenilsulfonilo, 35b) un grupo
 fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o
 5 diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d)
 un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxido de C₁-C₆,
 g) un grupo haloalcóxido de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio
 de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, l) un
 grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo
 10 monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo
 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 36b) un grupo
 fenilalcóxido de C₁-C₆, o 37b) un grupo fenilalcóxido de C₁-C₆ sustituido que posee, en el
 anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo
 halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo
 15 haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxido de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxido de C₁-C₆, h)
 un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfonilo de
 C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un
 grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo
 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo
 20 alcoxycarbonilo de C₁-C₆;

G es 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo de C₂-C₁₀, 3c)
 un grupo alquenilo de C₃-C₁₀, 4c) un grupo haloalquenilo de C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquinilo
 de C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquinilo de C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀, 8c) un
 grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes
 25 iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆,
 y c) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 9c) un cicloalquenilo de C₃-C₁₀, 10c) un grupo
 cicloalquenilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales
 o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆, y c) un
 grupo haloalquilo de C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆, o 12c) un
 30 grupo halocicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆;

Z es un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X puede ser igual o diferente y es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, 3d) un grupo ciano, 4d) un grupo nitro, 5d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , o 6d) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 ;

Y¹ es 1e) un átomo de hidrógeno, 2e) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 3e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 4e) un grupo alquenilo de C_2-C_6 , 5e) un grupo haloalquenilo de C_2-C_6 , 6e) un grupo alquinilo de C_2-C_6 , 7e) un grupo haloalquinilo de C_2-C_6 , 8e) un grupo alcoxi de C_1-C_6 , 9e) un grupo hidroalquilo de C_1-C_6 , 10e) un grupo alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 11e) un grupo cicloalquilo de C_3-C_6 , 12e) un grupo halocicloalquilo de C_3-C_6 , 13e) un grupo cicloalquil de C_3-C_6 , 14e) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 , 15e) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 16e) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , 17e) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , 18e) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , 19e) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 , 20e) un grupo haloalquilsulfinil de C_1-C_6 , 21e) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 , 22e) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 , 23e) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , 24e) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 25e) un grupo fenilo, 26e) un grupo fenilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxido de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxido de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes., y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 ;

Y² puede ser el mismo o diferente y es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 3f) un grupo ciano, 4f) un grupo nitro, 5f) un grupo hidroxilo, 6f) un grupo mercapto, 7f) un grupo amino, 8f) un grupo carboxilo, 9f) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 10f) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 11f) un grupo alquenilo de C_2-C_6 , 12f) un grupo haloalquenilo de C_2-C_6 , 13f) un grupo alquinilo de C_2-C_6 , 14f) un grupo haloalquinilo de C_2-C_6 , 15f) un grupo trialquilsilil de C_1-C_6 alquinilo de C_2-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 16f) un grupo fenilalquinilo de C_2-C_6 , 17f) un grupo alcoxi de C_1-C_6

- alcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 18f) un grupo hidroxialquilo de C_1-C_6 , 19f) un grupo alquilcarboniloxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 20f) un grupo cicloalquilo de C_3-C_6 , 21f) un grupo halocicloalquilo de C_3-C_6 , 22f) un grupo cicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 23f) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 24f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , 25f) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , 26f) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_6 , 27f) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alcoxilo de C_1-C_6 , 28f) un grupo fenilalcoxilo de C_1-C_6 , 29f) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 30f) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 31f) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , 32f) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , 33f) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , 34f) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , 35f) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 36f) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , 37f) un grupo alquiltio de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 38f) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 39f) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 40f) un grupo haloalquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 41f) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 42f) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 43f) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , 44f) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 45f) un grupo fenilamino, 46f) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 47f) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 48f) un grupo fenilo, 49f) un grupo fenilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 50f) un grupo fenoxilo, 51f) un grupo fenoxilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 ,

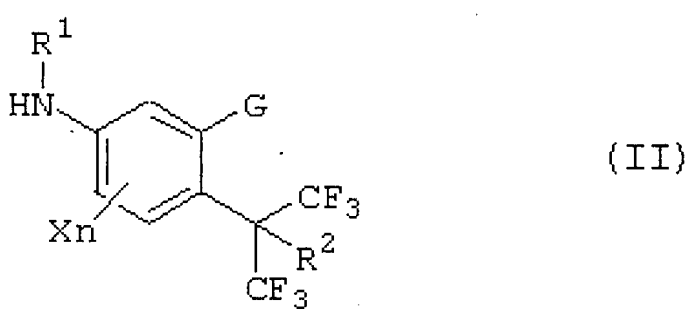
o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 52f) un grupo heterocíclico, o 53f) un grupo
 heterocíclico sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o
 diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d)
 5 un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxido de C₁-C₆,
 g) un grupo haloalcóxido de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio
 de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfínido de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfínido de C₁-C₆, l) un
 grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo
 monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo
 10 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆;

m es 1 ó 2; y

n es un entero de valor 1-3,

las sales del mismo y agentes agrohortícolas que contienen el compuesto
 como un ingrediente activo, y métodos de utilización del mismo.

15 Adicionalmente, la presente invención se refiere también a derivados de
 anilina sustituidos representados por la fórmula (II), los cuales son compuestos
 intermedios para el mismo:



En donde

R¹ es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C₁-C₈, 3a) un
 25 grupo haloalquilo de C₁-C₆, 4a) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo
 haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 6a) un grupo alquenilcarbonilo de C₂-C₆, 7a) un grupo
 haloalquenilcarbonilo de C₂-C₆, 8a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 9a)
 un grupo cicloalquilo de C₃-C₆, 10a) un grupo halocicloalquilo de C₃-C₆, 11a) un grupo
 cicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-C₆, 12a) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-
 30 C₆, 13a) un grupo alquenilo de C₂-C₆, 14a) un grupo halo alquenilo de C₂-C₆, 15a) un
 grupo alquinilo de C₂-C₆, 16a) un grupo haloalquinilo de C₂-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-
 C₁₀ alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 19a) un grupo

- alqueniloxi de C₂-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 21a) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 22a) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 23a) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 24a) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 25a) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 26a) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 27a) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 28a) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 29a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₁₆, 32a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34a) un grupo alqueniloxycarbonilo de C₂-C₆, 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C₁-C₆, 36a) un grupo monoalquilaminocarbonilo de C₁-C₆, 37a) un grupo dialquilaminocarbonilo de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 38a) un grupo alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 39a) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 40a) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆, 41a) un grupo cianoalquilo de C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes

seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 46a) un grupo heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 48a) un grupo fenóxicarbonilo, 49a) un grupo fenóxicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 50a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 , 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfinilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfinilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y

- p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 ,
5 g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 54a) un grupo
10 dialquifosfono de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 55a) un grupo dialquifosfonotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 56a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcóxicarbonilaminotio de C_1-C_6 , 57a) un grupo N-alquil de C_1-C_6 -N-alcóxicarbonil de C_1-C_6 alquilaminotio de C_1-C_6 , 58a) un grupo dialquilaminotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo
15 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 60a) un grupo halocicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 61a) un grupo alquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 62a) un grupo haloalquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un
20 grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo
25 dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 65a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 66a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f)
30 un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo

haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 67a) un grupo cicloalquil de C₃-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 69a) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 70a) un grupo fenoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 71a) un grupo fenoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 72a) un grupo alquilcarboniloxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 73a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o 74a) un grupo alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆;

R² es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 3b) un grupo alquilo de C₁-C₆, 4b) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 5b) un grupo ciano, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, 8b) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, 9b) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 10b) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 11b) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 12b) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 13b) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 14b) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 15b) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 17b) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃, 18b) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₃ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 19b) un grupo alquiltio de C₁-C₆, 20b) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, 21b) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, 22b) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, 23b) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 24b) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 25b) un grupo amino, 26b) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, 27b) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 28b) un grupo fenóxilo, 29b) un grupo fenóxilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo

- halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 32b) un grupo fenilsulfinilo, 33b) un grupo fenilsulfinilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más, sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34b) un grupo fenilsulfonilo, 35b) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 36b) un grupo fenilalcoxilo de C₁-C₆, o 37b) un grupo fenilalcoxilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el

anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno., b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfínilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfínilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆;

G es 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo de C₂-C₁₀, 3c) un grupo alquénilo de C₃-C₁₀, 4c) un haloalquénilo de C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquínilo de C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquínilo de C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀, 8c) un grupo cicloalquilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆, y c) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 9c) un grupo cicloalquénilo de C₃-C₁₀, 10c) un grupo cicloalquénilo de C₃-C₁₀ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C₁-C₆, y c) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆, o 12c) un grupo halocicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆;

X puede ser igual o diferente y es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, 3d) un grupo ciano, 4d) un grupo nitro, 5d) un grupo alquilo de C₁-C₆, o 6d) un grupo haloalquilo de C₁-C₆;

n es un entero de valor 1-3,

las sales del mismo y ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico y una sal del mismo.

DESCRIPCION DETALLADA DE LA INVENCION

En las definiciones de un derivado pirazolcarboxanilida sustituido de la fórmula (I) y un derivado de la anilina sustituida de la fórmula (II) de la presente invención, "halo", "alquilo de C₁-C₆", "alcoxilo de C₁-C₆", "alquénilo de C₂-C₆", "alquínilo de C₂-C₆" o un "grupo heterocíclico", y lo similar en cada uno de sustituyentes tiene el significado siguiente.

El "halo" o el "átomo de halógeno" significa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un átomo de flúor.

El "alquilo de C_1-C_6 " es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 2-etilbutilo y lo similar.

El "alquilo de C_1-C_8 " es lineal o alquilo de cadena ramificada que tiene 1 a 8 átomos de carbono, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo y lo similar.

El "alquilo de C_2-C_{10} " es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 10 átomos de carbono, tal como etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, 1-etilpropilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo, n-nonilo, n-decilo y lo similar.

El "cicloalquilo de C_3-C_6 " es alquilo cíclico que tiene 3 a 6 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y lo similar.

El "cicloalquilo de C_3-C_8 " es alquilo cíclico que tiene 3 a 8 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclooctilo y lo similar.

El "cicloalquilo de C_3-C_{10} " es alquilo cíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclooctilo, ciclodecilo y lo similar.

El "cicloalquenilo de C_3-C_{10} " es alquenilo cíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, tal como ciclopropenilo, ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclooctenilo, ciclodecenilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_3 " es alcoxilo cuya fracción alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 3 átomos de carbono, tal como metoxilo, etoxilo, propoxilo, isopropoxilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_6 " es alcoxilo cuya fracción de alquilo es "alquilo de C_1-C_6 " indicado precedentemente, tal como etoxilo, metoxilo, etoxilo, n-propoxilo, i-propoxilo, n-butoxilo, isobutoxilo, s-butoxilo, t-butoxilo, n-pentiloxilo, isopentiloxilo, neopentiloxilo, t-pentiloxilo, 2-metilbutoxilo, 1-etilpropoxilo, hexiloxilo, 2-etilbutoxilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_{10} " el donde su fracción alquilo de alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 10 átomos de carbono, tal como metoxilo, etoxilo, n-propxilo, i-propxilo, n-butoxilo, isobutoxilo, s-butoxilo, t-butoxilo, n-pentiloxilo, isopentiloxilo, neopentiloxilo, t-pentiloxilo, 2-metilbutoxilo, 1-etilpropxilo, hexilxilo, 2-etilbutoxilo, n-heptiloxilo, n-octiloxilo, 2-etilhexilxilo, n-nonilxilo, n-deciloxilo y lo similar.

El "alcoxilo de C_1-C_{16} " es alcoxilo cuya fracción alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 16 átomos de carbono, tal como metoxilo, etoxilo, n-propxilo, i-propxilo, n-butoxilo, isobutoxilo, s-butoxilo, t-butoxilo, n-pentiloxilo, isopentiloxilo, neopentiloxilo, t-pentiloxilo, 2-metilbutoxilo, 1-etilpropoxilo, hexiloxilo, 2-etilbutoxilo, n-heptiloxilo, n-octiloxilo, 2-etilhexiloxilo, n-noniloxilo, n-deciloxilo, n-undeciloxilo, n-dodeciloxilo, n-trideciloxilo, n-tetradeciloxilo, n-pentadeciloxilo, n-hexadeciloxilo y lo similar.

El "alquenilo de C_2-C_6 " es alquenilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 6 átomos de carbono que tiene por lo menos un enlace doble tal como vinilo, 1-propenilo, alilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-pentenilo, 2-metil-1-propenilo, 2,4-pentadienilo, 3-hexenilo y lo similar.

El "alquenilo de C_3-C_{10} " es alquenilo de cadena lineal o ramificada que tiene 3 a 10 átomos de carbono que tienen por lo menos un enlace doble tal como 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-pentenilo, 2,4-pentadienilo, 3-hexenilo, 3-heptenilo, 3-octenilo, 3-nonenilo, 3-decenilo y lo similar.

El "alquinilo de C_2-C_6 " es alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 6 átomos de carbono que tiene por lo menos un enlace triple tal como etinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 2-pentinilo, 3-hexinilo y lo similar.

El "alquinilo de C_3-C_{10} " es alquinilo de cadena lineal o ramificada que tiene 3 a 10 átomos de carbono que tienen un enlace triple por lo menos como 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 2-pentinilo, 3-hexinilo, 3-heptinilo, 3-octinilo, 3-noninilo, 3-decinilo y lo similar.

Los números en " C_2-C_6 ", " C_3-C_{10} " y lo similar demuestra la escala de números de átomo de carbono tal como 2 a 6 átomos de carbono y 3 a 10 átomos de carbono.

Además, las definiciones antedichas se pueden aplicar a los grupos en donde los sustituyente indicados precedentemente están conectados. Por ejemplo,

"haloalquilo de C₁-C₆" significa grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono que se sustituyen por el mismo o diferente o los átomos más halógenos tal como clorometilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 3-cloropropilo, 2-cloro-1,1-dimetiletilo, 1-bromo-1-metiletilo, difluorometil, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 5 perfluorohexilo y lo similar.

Un "grupo heterocíclico y "Un heterociclilo" son grupos heterocíclicos de 5 o 6 miembros que poseen uno o más heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno que incluye, por ejemplo, grupo piridilo, grupo piridina-N-óxido, los grupo pirimidinilo, grupo furilo, grupo tetrahydrofurilo, grupo 10 tienilo, grupo tetrahidrotienilo, grupo tetrahidropiranilo, grupo tetrahidrotiopiranilo, grupo oxazolilo, grupo isoxazolilo, grupo oxadiazolilo, grupo tiazolilo, grupo isotiazolilo, grupo tiadiazolilo, grupo imidazolilo, grupo triazolilo y grupo pirazolilo.

Una sal de un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) de la presente invención incluye una sal de un metal alcalino (litio, sodio, 15 potasio, etc.); una sal de un metal alcalino térreo (calcio, magnesio, etc.); una sal de amonio; y una sal de un amina orgánica (metilamina, trietilamina, dietanolamina, piperidina, piridina, etc.), o una sal de adición ácida. Por ejemplo, la sal de adición ácida incluye un carboxilato como el acetato, el propionato, el oxalato, trifluoroacetato, benzoato y lo similar; un sulfonato tal como metansulfonato, trifluorometansulfonato, p- 20 toluensulfonato y lo similar; una sal ácida inorgánica tal como un clorhidrato, un sulfato, un nitrato, un carbonato y lo similar.

En los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I) de la presente invención, R¹ es preferentemente 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C₁-C₆, 3a) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, 4a) un grupo 25 alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 6a) un grupo alquenilcarbonilo de C₂-C₆, 13a) un grupo alquenilo de C₂-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 19a) un grupo alqueniloxi de C₂-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 29a) un grupo fenilalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi de 30 C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-

- C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₁₆, 32a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆, 34a) un grupo alqueniloxycarbonilo de C₂-C₆, 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 46a) un grupo heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo

son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 48a) un grupo fenóxicarbonilo, 49a) un grupo fenóxicarbonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 50a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 , 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , f) un grupo alcóxilo de C_1-C_6 , g) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , h) un grupo alquiltio de C_1-C_6 , i) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 , j) un grupo alquilsulfínilo de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínilo de C_1-C_6 , l) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , m) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , n) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 , o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 58a) un grupo dialquilaminotio de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 61a) un grupo alquil de C_1-C_6 cicloalquilcarbonilo de C_3-C_6 , 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo

alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 65a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 66a) un grupo fenilcicloalquilcarbonilo de C₃-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, l) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, m) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, n) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, o) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, 73a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o 74a) un grupo alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1a) un átomo de hidrógeno, 4a) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₁₆, 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆ o 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆;

R² es preferentemente 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxilo de C₁-C₆ o 8b) un grupo haloalcoxilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1b) un átomo de hidrógeno o 7b) un grupo alcoxilo de C₁-C₆;

G es preferentemente 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀, 3c) un grupo alquenilo de C₃-C₁₀, o 11c) un grupo cicloalquil de C₃-C₈ alquilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀.

X es preferentemente 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, o 5d) un grupo alquilo de C₁-C₆, y más preferentemente 1d) un átomo de hidrógeno.

Z es preferentemente átomo de un oxígeno.

Y^1 es preferentemente 2e) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 3e) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , o 4e) un grupo alqueno de C_2-C_6 , y más preferentemente 2e) un grupo alquilo de C_1-C_6 ;

5 Y^2 es preferentemente 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 9f) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 10f) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , o 31f) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y más preferentemente 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 9f) un grupo alquilo de C_1-C_6 , o 10f) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 .

m es preferentemente 2.

10 Adicionalmente, una sal de un derivado de anilina sustituido representada por la fórmula (II) es preferentemente una sal de adición ácida, que incluye, por ejemplo, un carboxilato tal como acetato, propionato, oxalato, trifluoroacetato, benzoato y lo similar; un sulfonato tal como metansulfonato, trifluorometansulfonato, p-toluensulfonato y lo similar; una sal ácida inorgánica tal como un clorhidrato, un sulfato, un nitrato, un carbonato y lo similar.

15 Una sal de ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico de la presente invención incluye una sal de un metal alcalino (litio, sodio, potasio, etc.); una sal de un metal alcalino térreo (calcio, magnesio, etc.); una sal de amonio; y una sal de una amina orgánica (metilamina, trietilamina, dietanolamina, piperidina, piridina, etc.).

20 Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o un compuesto intermedio del mismo, es decir un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula (II), de la presente invención pueden contener uno o una pluralidad de centros asimétricos en la fórmula estructural, y además dos o más isómeros y diastereómeros ópticos pueden estar presentes. Por lo tanto, la presente invención abarca completamente cada isómero óptico y las mezclas en cualquier proporción.

25 Adicionalmente, un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) de la presente invención puede tener dos tipos de isómero geométrico derivado de un enlace doble C-C en la fórmula estructural. La presente invención abarca todos los isómeros geométricos y las mezclas que los contienen en cualquier proporción. Además, la presente invención abarca hidratos de los mismos.

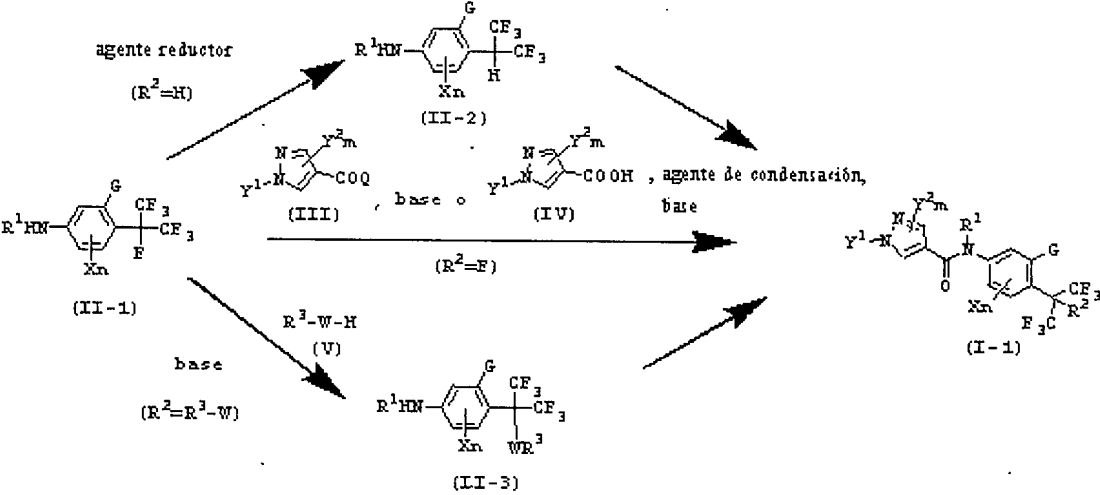
30 Los métodos de la producción representativos para un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) y un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula (II), como un compuesto intermedio del mismo se

ilustra a continuación, pero la presente invención no debe interpretarse como limitada al mismo.

Método de Producción 1

5

10



15

25

30

(en donde G, R¹, X, n, Y¹, Y² y m son iguales a los definidos anteriormente; y R³ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo de C₁-C₄; W es -O-, -S- ó -N(R⁴)-, en donde R⁴ es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C₁-C₆, un grupo haloalquilo de C₁-C₆, un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo de C₁-C₄; y Q es un átomo halógeno o un grupo alcoxilo de C₁-C₆).

Entre un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I), un derivado pirazolcarboxanilida sustituido (I-1) en donde Z es O, y R² es un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o WR³ en donde W y R³ son iguales a los definidos anteriormente se puede producir haciendo reaccionar un derivado de la anilina representado por las fórmulas (II-1) a (II-3) con un haluro pirazolcarboxílico o un éster pirazolcarboxilato representado por la fórmula (III) en presencia o ausencia de una base en un solvente inerte, o haciendo reaccionar un derivado de anilina representado por las fórmulas (II-1) a (II-3) con un ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (IV) en presencia de un agente de condensación, en la presencia o ausencia de una base, en un solvente inerte, y cualquier método de producción usual para las amidas puede ser aplicable.

Un derivado de anilina representado por la fórmula (II-2) se puede producir reduciendo un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1) en presencia de un agente de reducción, en un solvente inerte.

Un derivado de anilina representado por la fórmula (II-3) se puede producir haciendo reaccionar un derivado de la anilina representado por la fórmula (II-1) con un derivado de alcohol, un derivado de tiol o un derivado de amina representado por la fórmula (V), en presencia o ausencia de una base en un solvente inerte.

5

La fórmula (II-1) → la fórmula (II-2)

Un ejemplo de un agente reductor a ser usado en la presente reacción incluye hidruros de metal tal como hidruro de litio aluminio, borohidruro de litio, borohidruro de sodio, hidruro de diisobutil aluminio, hidruro del bis(2-metoxietoxi)aluminio de sodio y lo similar, metal como litio y lo similar o sales de metal, y lo similar. La cantidad del agente reductor a ser usado puede seleccionarse, según sea apropiado, en la escala de una cantidad de exceso al equivalente con relación a un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1).

Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción puede ser cualquiera con tal de que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye carburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los hidrocarburos halogenados tales como cloruro del metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y lo similar; los carburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, diclorobenceno y lo similar; los éteres de cadena lineal o cíclica como el dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar, o dimetilsulfoxido y lo similar y estos solventes inertes pueden usarse exclusivamente o en una combinación de dos o más tipos.

La temperatura de la reacción puede estar en la escala de la temperatura ambiente a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y puede estar en la escala de varios minutos a 50 horas, dependiendo de la escala de la reacción y temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de la reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede producirse por una purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si es necesario. El compuesto deseado también puede ser sometido a la etapa de reacción subsiguiente sin aislamiento de mezcla de reacción.

Fórmula (II-1) → la fórmula (II-3).

Un ejemplo de una base ser, usada en la presente reacción incluye hidruros de metal como el hidruro de litio, el hidruro de sodio, el hidruro de potasio y lo similar; alcoholatos de metal tales como el metóxido de sodio, el etóxido de sodio., terc-butóxido de potasio y lo similar; y metales de alquilo tales como el litio n-butilo, litio sec-butilo, litio terc-butilo y lo similar. La cantidad de base a ser usada puede ser seleccionada, si es apropiado, en la escala desde cantidad equivalente al exceso en relación a un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1).

Como un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción, el cual puede ser cualquiera con tal que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye los carburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los alcoholes tales como metanol, etanol y lo similar; los éteres de cadena lineal o cíclica tales como dietil éter, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar, y similares y estos solventes inertes pueden ser usados exclusivamente o en combinación de dos o más tipos.

La temperatura de reacción puede estar en la escala de -70°C a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 50 horas, dependiendo de la escala de la reacción y la temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido mediante purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si fuera necesario. El compuesto deseado también puede ser sometido a una etapa de reacción subsiguiente sin aislamiento de la mezcla de reacción.

La fórmula (II-1), (II-2) ó (II-3) → la fórmula (I-1)

Un ejemplo de un agente de condensación a ser usado en la presente reacción incluye cianofosfato de dietilo (DEPC), carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), cloroformatos, yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio y lo similar.

Como base para ser usado en la presente reacción, se incluye una base inorgánica o una base orgánica y un ejemplo de una base inorgánica incluye los

hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y lo similar; el hidruros de metal alcalino tal como hidruro de sodio, hidruro de potasio y lo similar; sal de metal alcalino de alcohol tal como etóxido de sodio, terc-butóxido de potasio y lo similar; los carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, 5 carbonato hidrógeno de sodio y lo similar; y un ejemplo de las bases orgánicas incluyen trietilamina, piridina, DBU y lo similar. La cantidad de base a ser usada puede ser seleccionada en la escala de cantidad equivalente al exceso en relación a un derivado de ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (III) o (IV).

Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción 10 puede ser cualquiera con la condición que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye los carburos aromáticos tales como benceno, tolueno., xileno y lo similar; los hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono y lo similar; los hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, diclorobenceno y lo similar; éteres de cadena lineal o cíclica tales como 15 dietil éter, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar; ésteres tales como acetato de etilo y lo similar; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida y lo similar; dimetilsulfóxido; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; acetona, etil metil cetona y lo similar. Estos solventes inertes pueden ser usados exclusivamente o en una combinación de dos o más tipos.

20 Como la presente reacción es una reacción equimolar, cada reactivo puede ser usado en igual cantidad molar, sin embargo, cualquiera de los reactivos también puede ser usado en exceso. La temperatura de reacción puede estar en la escala de la temperatura ambiente a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 48 horas, dependiendo 25 de la escala de la reacción y la temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por medio de un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc, si es necesario.

30 Un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1), como una materia prima de la presente reacción, puede producirse de acuerdo con un método de producción descrito en JP-A-11-302233, JP-A-2001-122836 o JP-A-2006-8675.

Un derivado de ácido pirazolcarboxílico representado por las fórmulas (III) o (IV) puede ser producido de acuerdo con varios métodos descritos en las literaturas conocidas (por ejemplo, "Aust. J. Chem.", 1983, 36, 135-147, "Síntesis", 1986, 753-755, JP-A-52-87168, JP-A-63-45264, JP-A-1-106866 y lo similar).

5

Método de Producción 2



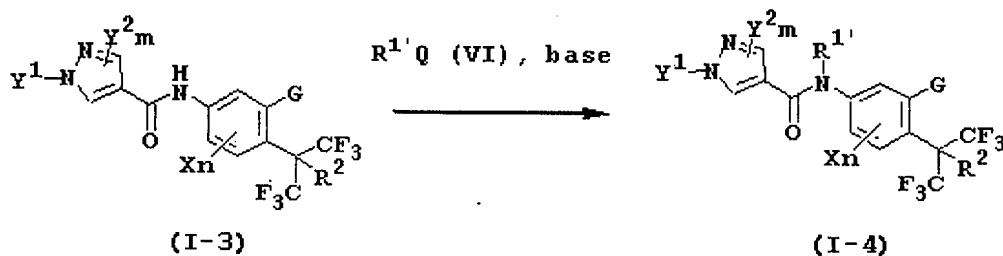
10

(en donde G, R¹, R², X, n, Y¹, Y² y m son iguales a los definidos anteriormente).

Entre los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I), un derivado pirazolcarboxanilida sustituido (I-2) en donde Z es S puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de anilida representado por (I-1) con el reactivo de Lawesson de acuerdo con un método conocido ("Tetrahedron Lett.", 21 (42), 4061 (1980)).

20

Método de Producción 3



25

(en donde G, R², X, n, Y¹, Y², m y Q son iguales a los definidos anteriormente y R^{1'} es igual al definido anteriormente excepto un átomo de hidrógeno).

Entre los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I), un derivado pirazolcarboxanilida sustituido (I-4) en donde R¹ es distinto de un átomo de hidrógeno puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de amida representado por la fórmula (I-3) con un derivado de haluro o un derivado de éster

30

representado por la fórmula (VI), en presencia o ausencia de una base, en un solvente inerte.

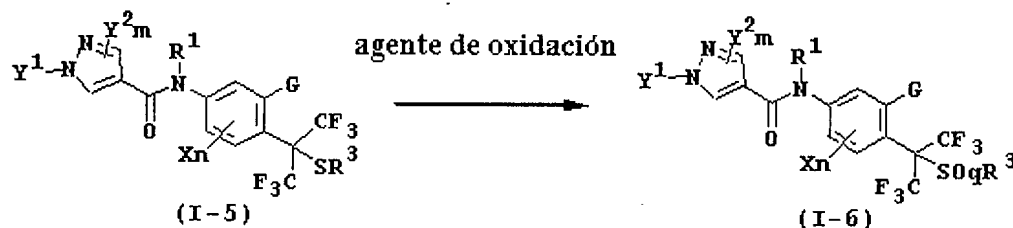
Como un ejemplo de una base a ser usada en la presente reacción se incluyen los hidróxidos de metal tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y lo similar; los carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato ácido de sodio y lo similar; hidruros de metal tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio y lo similar; alcoholatos de metal tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, terc-butoxido de potasio y lo similar; alquil metales tales como n-butil litio, sec-butil litio, terc-butil litio y lo similar. La cantidad de base a ser usada se puede seleccionar, según lo apropiado, en la escala de cantidad equivalente a un exceso del derivado de amida representado por la fórmula (I-3).

Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción que puede ser cualquiera con tal que no inhiba significativamente el progreso de la presente reacción, incluye los hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno y lo similar; los alcoholes tales como metanol, etanol y lo similar; éteres de cadena lineal o cíclica tales como dietil éter, 1,2-dimetóxietano, dioxano, tetrahidrofurano y lo similar; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida y lo similar; dimetilsulfóxido; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona y lo similar. Estos solventes inertes pueden ser usados exclusivamente o en combinación de dos o más tipos.

La temperatura de reacción puede estar en la escala de -70°C a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 50 horas, dependiendo de la escala de la reacción y temperatura de reacción.

Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc, si fuera necesario.

Método de Producción 4



(en donde G, R¹, R³, X, n, Y¹, Y² y m son iguales a los definidos anteriormente, y q es 1 ó 2).

5 Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I-6) puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de sulfuro representado por la fórmula (I-5) el cual puede ser producido en el método de Producción 1 con un agente de oxidación en presencia de un solvente inerte.

10 Un ejemplo de un solvente inerte a ser usado en la presente reacción incluye los hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo y lo similar; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y lo similar; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como fluorobenceno, clorobenceno, diclorobenceno y lo similar; ácidos tales como ácido acético y lo similar; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y lo similar.

15 Un ejemplo de un agente de oxidación incluye ácido m-peroxiclوروبenzóico, ácido peracético, metaperiodato de potasio, persulfato ácido de potasio (Oxone), agua oxigenada y lo similar. La cantidad del agente de oxidación a ser usado puede ser seleccionada, si fuera apropiado, en la escala de 0.5 a 3 equivalentes en relación a un derivado de sulfuro representado por la fórmula (I-5).

20 La temperatura de reacción puede estar en la escala de -50°C a la temperatura de ebullición de un solvente inerte a ser usado y el tiempo de reacción puede estar en la escala de varios minutos a 24 horas, dependiendo de la escala de la reacción y la temperatura de reacción.

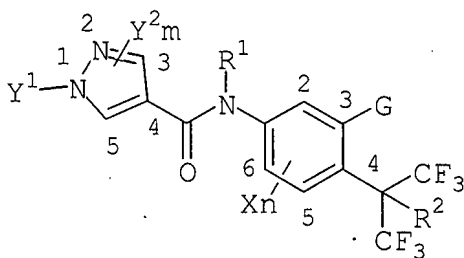
25 Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si fuera necesario.

30 Los compuestos típicos de derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I) son ejemplificados en el Cuadro 1 y Cuadro 2, y los compuestos típicos de derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II) se ejemplifican en el Cuadro 3, y un derivado de ácido pirazolcarboxílico sustituido

representado por la fórmula (IV) se ejemplifica en el Cuadro 4, sin embargo, la presente invención no debe ser interpretada como limitada a éstos.

En la columna de "propiedad" del cuadro 1 y cuadro 2, se ilustra el punto de fusión ($^{\circ}\text{C}$) o índice de refracción ($n_D(^{\circ}\text{C})$) y para los compuestos descritos como amorfo o pasta, se ilustran datos ^1H -RMN de los mismos en el Cuadro 5. En los Cuadros, "n-" es normal, e "i-" es iso, "t-" es terciario, "c-" es ciclo, "Me" es un grupo metilo, "Et" es un grupo etilo, "Pr" es un grupo propilo, "Bu" es un grupo butilo, "Pen" es un grupo pentilo, "Hex" es un grupo hexilo, "Ph" es un grupo fenilo, "Bn" es un grupo bencilo, "Ac" es un grupo acetilo y "Pyr" es un grupo pirazinilo.

Fórmula (I-4)



(I-4)

CUADRO I

(Xn=H)

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-1	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	H	72-75
1-2	Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-3	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	129-131
1-4	Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.5028(25.4)
1-5	Et	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	
1-6	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	118.8-121.6
1-7	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	
1-8	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1.4889(24.2)
1-9	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OMe	
1-10	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OMe	77.2-79.2
1-11	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	
1-12	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1.4895(25.4)
1-13	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	110-113
1-14	Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-15	Et	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OEt	90-91
1-16	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OEt	119-120
1-17	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-18	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-19	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-20	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-21	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	
1-22	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
1-23	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	1.4768(21.8)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-24	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	132-134
1-25	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	57-60
1-26	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4736(24.6)
1-27	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	134-135
1-28	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4830(26.2)
1-29	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	
1-30	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	
1-31	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	128-130
1-32	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1.4697(25.9)
1-33	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OMe	
1-34	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4681(26.2)
1-35	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	142-145
1-36	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	1.4720(24.5)
1-37	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OEt	1.4710(26.9)
1-38	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OEt	
1-39	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OEt	
1-40	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OEt	
1-41	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OEt	
1-42	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OEt	
1-43	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OEt	
1-44	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OEt	
1-45	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	H	167-168
1-46	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-47	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	184-185
1-48	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4953(25.0)
1-49	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4982(34.2)
1-50	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	
1-51	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	1.4979(22.1)
1-52	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1.4942(22.7)

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-53	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OMe	1.4980(22.7)
1-54	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OMe	1.4952(23.0)
1-55	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	
1-56	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1.4933(23.2)
1-57	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	178-179
1-58	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-59	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OEt	1.4980(22.7)
1-60	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OEt	
1-61	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-62	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-63	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-64	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-65	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	
1-66	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
1-67	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	131-133
1-68	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-69	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	124
1-70	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4711(25.6)
1-71	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	1.4700(26.8)
1-72	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4795(25.5)
1-73	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	
1-74	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	1.4658(26.9)
1-75	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	126-128
1-76	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1.4671(26.9)
1-77	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OMe	
1-78	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4645(26.9)
1-79	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-80	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-81	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OEt	

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-82	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OEt	
1-83	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OEt	
1-84	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OEt	
1-85	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OEt	
1-86	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OEt	
1-87	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OEt	
1-88	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OEt	
1-89	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	H	150-151.5
1-90	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	196-197
1-91	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-92	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-93	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-94	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	83-85
1-95	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-96	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-97	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-98	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-99	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	141-144
1-100	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-101	i-Bu	Me	3-Me	H	H	
1-102	i-Bu	Me	3-Me	Et	OMe	1.4916(23.7)
1-103	i-Bu	Me	3-Me	Ac	OMe	1.4961(26.4)
1-104	i-Bu	Me	3-Me	COEt	OMe	1.4973(26.2)
1-105	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Pr	OMe	1.5014(25.5)
1-106	i-Bu	Me	3-Me	CO(4-Me-Ph)	OMe	Amorfo
1-107	i-Bu	Me	3-Me	CO(4-NO ₂ -Ph)	OMe	Amorfo
1-108	i-Bu	Me	3-Me	COOMe	OMe	95.5-97.8
1-109	i-Bu	Me	3-Me	COOEt	OMe	84.6-86.2
1-110	i-Bu	Me	3-Me	COO-n-Pr	OMe	86.7-88.4

000144

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-111	i-Bu	Me	3-Me	COO-i-Bu	OMe	91.8-94.0
1-112	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ OMe	OMe	1.4919(24.0)
1-113	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ OEt	OMe	1.4920(24.4)
1-114	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	H	172-174
1-115	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	H	
1-116	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	OMe	amorfo
1-117	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	OMe	
1-118	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	OEt	
1-119	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	OEt	
1-120	i-Bu	Et	3-CF ₃	H	H	175-176
1-121	i-Bu	Me	5-CF ₃	H	H	155-156
1-122	i-Bu	Me	5-SMe	H	H	107-110
1-123	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	H	148-151
1-124	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	SO ₂ (4-F-Ph)	H	amorfo
1-125	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	1.5021(22.5)
1-126	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt		143.1-148.8
1-127	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh		51.3-65.3
1-128	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃		1.4859(22.0)
1-129	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt		1.4882(23.8)
1-130	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me		1.4854(22.0)
1-131	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe		1.4889(21.9)
1-132	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OBn		1.5212(21.9)
1-133	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl		121.1-124.8
1-134	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃		143.1-145.6
1-135	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ CH ₂ Cl		117.1-121.4
1-136	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu		122.2-138.0
1-137	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-t-Bu		39.2
1-138	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe		1.4750(23.5)
1-139	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₁₅ Me		90.5-92.1

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-140	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.5016(23.3)
1-141	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4981(23.5)
1-142	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	82.5-83
1-143	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh	OMe	1.5219(23.7)
1-144	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	1.4944(23.1)
1-145	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1.4892(22.2)
1-146	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4885(25.1)
1-147	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OMe	1.4926(23.2)
1-148	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OMe	1.4894(23.2)
1-149	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	OMe	1.4941(21.5)
1-150	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	1.4928(22.2)
1-151	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Pr	OMe	1.4884(23.0)
1-152	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1.4829(22.3)
1-153	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CMe ₃	OMe	1.4864(23.0)
1-154	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4959(23.0)
1-155	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	189-190
1-156	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Et	OMe	amorfo
1-157	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CCl ₃	OMe	1.4939(22.2)
1-158	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	1.4940(26.4)
1-159	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OEt	1.4921(26.5)
1-160	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	Pasta
1-161	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh	OEt	
1-162	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-163	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-164	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	OEt	
1-165	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-166	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-167	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	OEt	
1-168	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-169	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Pr	OEt	165-166
1-170	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
1-171	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CMe ₃	OEt	
1-172	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	OEt	
1-173	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-174	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Et	OEt	127-128
1-175	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CCl ₃	OEt	
1-176	i-Bu	Et	3, 5-Me ₂	H	H	
1-177	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	F	
1-178	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Et	H	
1-179	i-Bu	Me	3-Me-5-F	H	H	136.5-137.5
1-180	i-Bu	Me	3-Me-5-F	H	OMe	1.4904(25.7)
1-181	i-Bu	Me	3-Me-5-F	Et	OMe	169.5-171
1-182	i-Bu	Me	3-Me-5-F	Ac	OMe	135-137
1-183	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COPh	OMe	1.4825(26.0)
1-184	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COOMe	OMe	86.4
1-185	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COO-i-Bu	OMe	124.1-130.8
1-186	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	64.5-80.5
1-187	i-Bu	Me	3-Me-5-F	CH ₂ OEt	OMe	1.4789(23.7)
1-188	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	H	1.4857(22.3)
1-189	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	1.4804(23.8)
1-190	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Me	OMe	160-161
1-191	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Et	OMe	144-146
1-192	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OMe	OMe	1.4919(25.6)
1-193	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1.4938(26.0)
1-194	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COOMe	OMe	1.4961(26.0)
1-195	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COOEt	OMe	1.4932(25.6)
1-196	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COO-i-Bu	OMe	1.4883(25.6)
1-197	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4915(26.0)
						1.4850(25.6)
						1.4850(25.6)
						1.4946(26.0)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-198	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Ac	OMe	102.6-102.8
1-199	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COEt	OMe	101.8-104.2
1-200	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COPh	OMe	1.5210(26.0)
1-201	i-Bu	Et	3-Me-5-Cl	H	H	104.5-106
1-202	i-Bu	Me	3-Me-5-I	H	H	152-153
1-203	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	H	OMe	88-89
1-204	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	OMe	1.4710(25.7)
1-205	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	COOMe	OMe	1.4672(25.7)
1-206	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CH ₂ OEt	OMe	1.4652(25.7)
1-207	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	1.4869(23.4)
1-208	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	152-152.5
1-209	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	H	148.5-150
1-210	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	H	1.4623(22.8)
1-211	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	138-139
1-212	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	1.4729(20.7)
1-213	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1.4695(20.7)
1-214	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1.4742(24.5)
1-215	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₂ Me	OMe	1.4685(20.7)
1-216	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₃ Me	OMe	1.4689(24.5)
1-217	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1.4669(22.6)
1-218	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOPh	OMe	50-55
1-219	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1.4691(22.3)
1-220	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COSMe	OMe	1.4870(24.9)
1-221	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COSEt	OMe	1.4862(24.9)
1-222	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	1.4669(22.4)
1-223	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	108-110
1-224	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4720(20.6)
1-225	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1.4735(24.8)
1-226	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-227	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	136-137
1-228	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	H	
1-229	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	H	
1-230	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OMe	130-132
1-231	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OMe	
1-232	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OEt	
1-233	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OEt	128-130
1-234	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-235	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-236	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-237	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-238	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-239	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-240	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-241	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-242	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-243	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	174-176
1-244	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-245	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-246	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-247	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-248	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-249	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-250	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-251	CH ₂ CMe ₃	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-252	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-253	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-254	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-255	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-256	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	67-70
1-257	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-258	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-259	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-260	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-261	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	158-160
1-262	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-263	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-264	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-265	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-266	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	143-144
1-267	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-268	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-269	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-270	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-271	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	67-70
1-272	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-273	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-274	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-275	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-276	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-277	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-278	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-279	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-280	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-281	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	152-153
1-282	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	H	
1-283	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-284	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	166-167

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-285	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4925(21.8)
1-286	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-287	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-288	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-289	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-290	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	138-140
1-291	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-292	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-293	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-294	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	H	1.5052(23.3)
1-295	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
1-296	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-297	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
1-298	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
1-299	(CH ₂) ₇ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
1-300	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
1-301	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
1-302	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
1-303	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
1-304	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
1-305	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
1-306	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	H	H	141-143
1-307	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	H	OMe	152-153
1-308	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	OMe	1.4688(25.6)
1-309	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	H	112-113
1-310	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	H	1.4690(25.9)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-311	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COOCH ₂ CH ₂ Cl	OMe	1.4966(24.7)
1-312	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CH ₂ Cl	OMe	1.5039(24.8)
1-313	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃	OMe	1.4914(24.8)
1-314	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	1.5061(24.9)
1-315	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	171-173
1-316	i-Bu	Cl CH ₂ CH ₂	3, 5-Me ₂	H	OMe	170-171
1-317	i-Bu	Cl CH ₂ CH ₂	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4955(24.8)
1-318	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OMe	1.4943(24.8)
1-319	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	113-115
1-320	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-MeO-Ph)	OMe	1.5198(25.3)
1-321	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-Me-Ph)	OMe	1.5139(25.0)
1-322	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-Cl-Ph)	OMe	51-64
1-323	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	COEt	OMe	1.4705(26.8)
1-324	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-Cl-Ph)	OMe	1.5266(25.4)
1-325	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-Me-Ph)	OMe	1.5182(25.5)
1-326	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-MeO-Ph)	OMe	1.5165(26.5)
1-327	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2-Me-Ph)	OMe	88-128
1-328	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2-Cl-Ph)	OMe	121-122
1-329	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2-MeO-Ph)	OMe	57-83
1-330	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CH ₂	OMe	1.5088(24.5)
1-331	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCHClMe	OMe	amorfo
1-332	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3-Me-2-Pyr)	OMe	52-64
1-333	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	SNEt ₂	OMe	
1-334	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	H	161-163
1-335	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4680(26.4)
1-336	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Pen	OMe	95-96

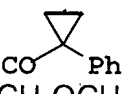
Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-337	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1.4939(26.5)
1-338	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	54
1-339	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ Ph	OMe	
1-340	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CMe ₂	OMe	1.5091(26.5)
1-341	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CHMe	OMe	1.5082(26.5)
1-342	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CH ₂ CO OEt	OMe	100-101
1-343	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=C H ₂	OMe	1.4728(27.0)
1-344	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-t-Bu	OMe	1.4715(26.9)
1-345	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-n-Pr	OMe	1.4660(26.8)
1-346	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH ₂ O Me	OMe	1.4695(26.2)
1-347	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-t-Bu	OMe	1.4730(26.2)
1-348	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ CH ₂ Cl	OMe	1.5062(26.7)
1-349	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.5019(26.8)
1-350	i-Bu	CH=CH 2	3, 5-Me ₂	H	OMe	124-130
1-351	i-Bu	CH=CH 2	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.5044(25.8)
1-352	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(2;4-Cl ₂ -Ph)	OMe	1.5220(26.1)
1-353	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(3;4-Cl ₂ -Ph)	OMe	53
1-354	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.5075(25.1)
1-355	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4741(25.8)
1-356	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=C H ₂	OMe	1.4781(25.9)
1-357	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	1.4888(26.0)
1-358	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-Cl-Ph)	OMe	41
1-359	Et	Me	3, 5-Me ₂	n-Pen	OMe	1.4897(25.0)
1-360	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (4-F-Ph)	OMe	107.9
1-361	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	1.4939(32.1)
1-362	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	100.3-103.4
1-363	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	1.5031(22.9)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-364	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	108
1-365	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ Et	OMe	1.4983(20.5)
1-366	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1.4958(21.6)
1-367	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	1.4991(21.8)
1-368	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.4977(30.5)
1-369	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1.4934(25.2)
1-370	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OPh	OMe	amorfo
1-371	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ -t-Bu	OMe	1.4962(32.1)
1-372	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	1.5023(32.2)
1-373	Et	Me	3, 5-Me ₂		OMe	1.4211(32.0)
1-374	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	OMe	1.4892(31.0)
1-375	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4855(30.2)
1-376	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4849(33.2)
1-377	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4982(23.1)
1-378	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4940(23.2)
1-379	Et	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃	OMe	145.2-145.8
1-380	Et	Me	3, 5-Me ₂	COO-n-Pen	OMe	1.4960(20.2)
1-381	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	127-128
1-382	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Bu	OMe	1.4818(19.1)
1-383	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4701(24.4)
1-384	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COCHEt ₂	OMe	1.4724(24.3)
1-385	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4670(23.7)
1-386	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4659(21.8)
1-387	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4672(21.8)
1-388	Et	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	127.3-128.5
1-389	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	134.1-135.4

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-390	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Bu	OMe	136.1-137.2
1-391	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-t-Bu	OMe	108.6-110.4
1-392	Et	Me	3-Me-5-Cl	COO-i-Bu	OMe	1.4931(32.1)
1-393	Et	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4884(30.5)
1-394	Et	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4875(29.1)
1-395	Et	Me	3-Me	H	OMe	183.8-185.4
1-396	Et	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	114.4-114.9
1-397	Et	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4975(31.0)
1-398	Et	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4902(23.4)
1-399	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1.4932(23.0)
1-400	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	80-81
1-401	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1.4841(23.7)
1-402	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CHEt-n-Bu	OMe	1.4894(23.8)
1-403	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	pasta
1-404	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Me	OMe	1.4983(22.0)
1-405	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	Et	OMe	1.4970(20.0)
1-406	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	1.5019(23.2)
1-407	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	(CH ₂) ₇ Me	OMe	1.4880(23.5)
1-408	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	H	140-145
1-409	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	H	129-130
1-410	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	140-145
1-411	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	H	135-137
1-412	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4673(21.8)
1-413	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-t-Bu	OMe	1.4669(21.7)
1-414	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	Me	OMe	pasta
1-415	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	n-Pr	OMe	pasta

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-416	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	70-71
1-417	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	OMe	Pasta
1-418	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ Ph	OMe	90-97
1-419	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (4-Me-Ph)	OMe	Pasta
1-420	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	59-65
1-421	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Bu	OMe	Pasta
1-422	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	Pasta
1-423	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Bu	OMe	80-82
1-424	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-t-Bu	OMe	Pasta
1-425	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-s-Bu	OMe	Pasta
1-426	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	OMe	Pasta
1-427	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	OMe	Pasta
1-428	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me	OMe	Pasta
1-429	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	Pasta
1-430	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	106.1-107.8
1-431	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	97.2-101.8
1-432	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ Br	OMe	93-106
1-433	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1.5035(24.7)
1-434	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ (2; 4; 6-Cl ₃ -Ph)	OMe	64.2-66.7
1-435	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		OMe	1.4991(20.5)
1-436	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCHMeOMe	OMe	1.4977(20.6)
1-437	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ OMe	OMe	1.4906(23.6)
1-438	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOPh	OMe	135.3-136.1
1-439	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	COO-i-Bu	OMe	1.4733(21.2)
1-440	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-t-Bu	OMe	1.4745(21.2)
1-441	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	1.4722(32.1)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-442	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-c-Pr	OMe	1.4780(32.0)
1-443	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	1.4727(24.1)
1-444	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1.4720(24.2)
1-445	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4658(22.7)
1-446	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1.4670(22.5)
1-447	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1.4625(21.9)
1-448	i-Bu	Me	3-Me-5-F	CO-t-Bu	OMe	amorfo
1-449	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	124-124.4
1-450	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-t-Bu	OMe	1.4860(31.4)
1-451	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Bu	OMe	114-115.3
1-452	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COCH ₂ OMe	OMe	Amorfo
1-453	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pen	OMe	136.2-137
1-454	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4887(31.6)
1-455	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-i-Bu	OMe	60.7-64.7
1-456	i-Bu	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	67.3-68.2
1-457	i-Bu	Me	3-Me	CO-t-Bu	OMe	124.1-125.5
1-458	i-Bu	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4914(32.0)
1-459	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Bu	OMe	83-88.6
1-460	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4990(31.7)
1-461	i-Bu	Me	3-Me	COCHEt ₂	OMe	1.4905(28.5)
1-462	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4817(31.7)
1-463	i-Bu	H	3, 5-Me ₂	H	OMe	82.8-90.5
1-464	i-Bu	Et	3, 5-Me ₂	H	OMe	162-163
1-465	i-Bu	CH ₂ C F ₃	3, 5-Me ₂	H	OMe	176-177
1-466	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	F	1.4860(22.7)
1-467	H ₂ CH MeEt	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4929(20.1)
1-468	CH ₂ C HMeEt	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4910(20.0)

5

10

15

20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-469	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4895(20.6)
1-470	n-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4835(18.9)
1-471	CH ₂ CH-c-Pen	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	200-201
1-472	CH ₂ CH ₂ C HMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4960(20.5)
1-473	CH ₂ CH ₂ C HMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4950(21.6)
1-474	Et	i-Pr	3, 5-Me ₂	H	OEt	173-174
1-475	Et	i-Pr	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	88-89
1-476	Et	Me	3, 5-Me ₂	H	O-n-Pr	104-105
1-477	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	O-n-Pr	1.4833(33.0)
1-478	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	O-n-Pr	1.4919(33.0)
1-479	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	O-n-Pr	1.4848(32.0)
1-480	Et	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	O-n-Pr	1.4729(23.5)
1-481	Et	Me	3-I-5-Me	H	H	134-135
1-482	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCHMeCO Et	OEt	
1-483	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OMe	1.4959(31.2)
1-484	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	1.4960(32.3)
1-485	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.4880(29.0)
1-486	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4869(28.0)
1-487	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4819(29.3)
1-488	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	135.4-139.0
1-489	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	128.1-128.2
1-490	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-s-Bu	OMe	99.2-99.7
1-491	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pr	OMe	123.0-123.9
1-492	n-Pr	Me	3-Me 5-Cl	CO-c-Pen	OMe	141.7-142.1
1-493	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1.4954(20.7)
1-494	n-Pr	Me	3-I-5-Me	H	H	183-185
1-495	n-Pr	Me	3-Me	H	OMe	146.8-147.0

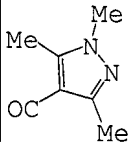
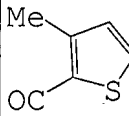
5

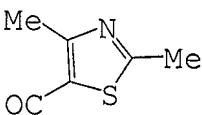
10

15

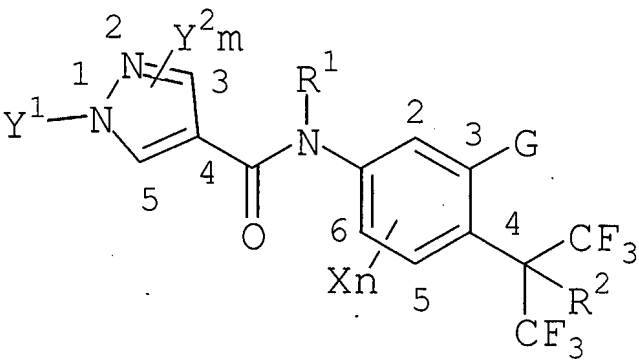
20

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-496	n-Pr	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	61.6-62.9
1-497	n-Pr	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4960(22.2)
1-498	n-Pr	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4991(22.1)
1-499	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4864(22.8)
1-500	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4863(22.4)
1-501	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1.4892(22.7)
1-502	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	1.4910(22.8)
1-503	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	H	O-n-Pr	158-159.5
1-504	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	COEt	O-n-Pr	1.4975(20.5)
1-505	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	O-n-Pr	1.4940(20.5)
1-506	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	O-n-Pr	1.4960(20.6)
1-507	i-Bu	CH ₂ C F ₃	3, 5-Me ₂	OEt	OMe	137-138
1-508	i-Bu	CH ₂ C F ₃	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	
1-509	i-Bu	i-Pr	3, 5-Me ₂	H	OMe	166-167
1-510	i-Bu	i-Pr	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	107-108
1-511	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	F	143.2-144.7
1-512	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	F	1.4888(23.0)
1-513	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	H	OMe	153-161
1-514	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CO-i-Pr	OMe	Pasta
1-515	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	Pasta
1-516	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	COOMe	OMe	Amorfo
1-517	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	H	OMe	172-174
1-518	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CO-i-Pr	OMe	Pasta
1-519	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	Pasta
1-520	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	H	178-183
1-521	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	COOMe	OMe	Pasta
1-522	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	OMe	Amorfo

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-523	i-Bu	Me	3-I-5-Me	COOMe	OMe	pasta
1-524	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-525	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ OEt	OMe	100-103
1-526	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	100-102
1-527	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CMe ₂	OMe	81-83
1-528	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-529	i-Bu	Me	5-CF ₃	H	OMe	170
1-530	i-Bu	Me	5-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	1.4680(22.8)
1-531	i-Bu	Et	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4913(23.0)
1-532	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	
1-533	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1.4870(22.5)
1-534	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	H	O-n-Pr	138-139
1-535	i-Bu	Me	3-I	H	OMe	210-218
1-536	i-Bu	Me	3-Br	H	OMe	203
1-537	i-Bu	Me	3-Cl	H	OMe	174-182
1-538	i-Bu	Me	3, 5-Cl ₂	H	OMe	132
1-539	i-Bu	Me	3-I	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-540	i-Bu	Me	3-Br	CO-i-Pr	OMe	Pasta
1-541	i-Bu	Me	3-Cl	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-542	i-Bu	Me	3-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-543	i-Bu	Me	3, 5-Cl ₂	CO-i-Pr	OMe	113-114
1-544	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		F	amorfo
1-545	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		F	amorfo

Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-546	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		OMe	150.4-151.2
1-547	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OAc	OMe	94-95
1-548	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OC(=O)Et	OMe	99
1-549	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OC(=O)-i-Pr	OMe	112
1-550	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COSMe	OMe	
1-551	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COSEt	OMe	

Fórmula (I-4)



(I-4)

CUADRO 2

(Y¹=Me)

Nro.	G	Xn	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
2-1	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	H	H	
2-2	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	
2-3	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
2-4	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
2-5	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	
2-6	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	
2-7	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
2-8	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
2-9	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
2-10	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
2-11	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
2-12	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
2-13	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	H	128-131
2-14	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	H	132-134
2-15	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
2-16	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	1.4905(25.9)
2-17	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OEt	154-155
2-18	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	Ac	OEt	104-106
2-19	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
2-20	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
2-21	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	

5

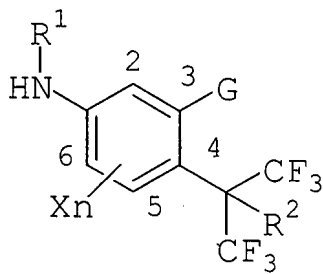
10

15

20

Nro.	G	Xn	Y _m ²	R ¹	R ²	Propiedad
2-22	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1.4751(26.7)
2-23	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	152-153
2-24	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
2-25	n-Pr	6-Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	127-128.5
2-26	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	151-152
2-27	i-Bu	6-Cl	3, 5-Me ₂	H	OMe	106-109
2-28	i-Bu	6-Cl	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	amorfo
2-29	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	138-140
2-30	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	132-134
2-31	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-n-Pr	OMe	1.4960(26.6)
2-32	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	165-166
2-33	i-Bu	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	126-127
2-34	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4955(33.5)
2-35	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	128.5-130.2
2-36	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	COCHE t ₂	OMe	1.4918(32.6)
2-37	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	COO-i- Bu	OMe	1.4870(30.1)
2-38	i-Bu	6-Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	Amorfo
2-39	Et	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4952(32.0)
2-40	n-Pr	6-Me	3-Me	H	OMe	amorfo
2-41	n-Pr	6-Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	pasta
2-42	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	111-112
2-43	i-Bu	6-Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	38-42
2-44	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	155
2-45	i-Bu	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	68-70
2-46	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OH	192-195

Fórmula (II)



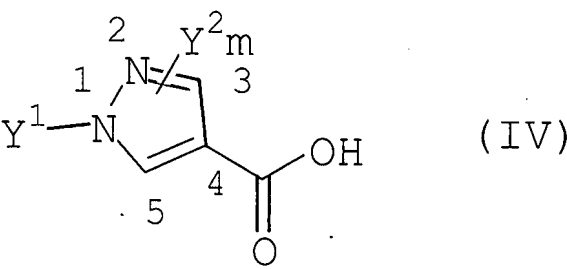
(II)

CUADRO 3

(R¹=H)

Nro	G	Xn	R ²	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
3-1	n-Pr	6-Me	F	7.09(s; 1H); 6.54(s; 1H); 3.76(bs; 2H); 2.63(m; 2H); 2.13(s; 3H); 1.58(m; 2H); 0.96(t; 3H)
3-2	n-Pr	6-Me	H	7.18(s; 1H); 6.54(s; 1H); 4.45-4.20(br; 2H); 4.27(m; 1H); 2.50(dd; 2H); 2.14(s; 3H); 1.57(m; 2H); 0.98(t; 3H)
3-3	n-Pr	6-Me	OMe	7.10(s; 1H); 6.66(s; 1H); 3.72(bs; 2H); 3.42(s; 3H); 2.84(m; 2H); 2.14(s; 3H); 1.61(m; 2H); 1.00(t; 3H)
3-4	Et	6-Me	F	7.09(s; 1H); 6.56(s; 1H); 3.78(bs; 2H); 2.71(m; 2H); 2.14(s; 3H); 1.19(td; 3H)
3-5	Et	6-Me	OMe	7.10(s; 1H); 6.68(s; 1H); 3.75(bs; 2H); 3.41(s; 3H); 2.91(dd; 2H); 2.15(s; 3H); 1.22(t; 3H)
3-6	Et	H	O-n-Pr	7.22(d; 1H); 6.67(d; 1H); 6.52(dd; 1H); 3.80(br; 2H); 3.46(t; 2H); 2.92(dd; 2H); 1.69(dd; 2H); 1.21(t; 3H); 0.94(t; 3H)
3-7	n-Pr	H	O-n-Pr	7.22(d; 1H); 6.66(d; 1H); 6.51(dd; 1H); 3.78(br; 2H); 3.47(t; 2H); 2.85(m; 2H); 1.70(dd; 2H); 1.60(m; 2H); 1.00(t; 3H); 0.94(t; 3H)
3-8	i-Bu	H	O-n-Pr	7.24(d; 1H); 6.70(d; 1H); 6.53(dd; 1H); 3.79(bs; 2H); 3.47(t; 2H); 2.81(d; 2H); 2.10(m; 1H); 1.70(m; 2H); 0.95(t; 3H); 0.91(d; 6H)

Fórmula (IV)



CUADRO 4

10

Nro	Y¹	Y²ᵐ	punto de fusión (°C)
4-1	Me	3-Me-5-CF₃	124-125.5

15

20

CUADRO 5

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
1-106	7.61(d; 2H); 7.52(d; 1H); 7.17(m; 4H); 7.11(m; 1H); 3.69(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.86(d; 2H); 2.39(s; 3H); 2.37(s; 3H); 1.96(m; 1H); 0.73(d; 6H)
1-107	8.27(d; 2H); 7.83(d; 2H); 7.59(d; 1H); 7.22(d; 1H); 7.17(m; 1H); 6.97(s; 1H); 3.66(s; 3H); 3.51(s; 3H); 2.91(d; 2H); 2.36(s; 3H); 1.97(m; 1H); 0.77(d; 6H)
1-116	8.04(s; 1H); 7.73(br; 1H); 7.72(d; 1H); 7.50(d; 1H); 7.43(dd; 1H); 4.01(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.93(d; 2H); 2.21(m; 1H); 0.94(d; 6H)
1-124	7.80(dd; 2H); 7.49(d; 1H); 7.13(dd; 2H); 7.02(dd; 1H); 6.89(d; 1H); 4.40-4.31(m; 1H); 3.57(s; 3H); 2.42(d; 2H); 2.28(s; 3H); 2.22(s; 3H); 1.70-1.59(m; 1H); 0.78(d; 6H)
1-156	7.41(d; 1H); 7.01(dd; 1H); 6.96(d; 1H); 3.98(dd; 2H); 3.56(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.79(d; 2H); 2.06(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.86(m; 1H); 1.25(dd; 3H); 0.74(d; 6H)
1-160	7.47(d; 1H); 7.16-7.05(m; 2H); 3.67(s; 3H); 3.60(dd; 2H); 3.04(m; 1H); 2.88(d; 2H); 2.37(s; 3H); 2.25(s; 3H); 1.97(m; 1H); 1.31(t; 3H); 1.26(d; 6H); 0.77(d; 6H)
1-331	7.48(d; 1H); 7.10(d; 1H); 7.08(s; 1H); 5.11(q; 1H); 3.64(s; 3H); 3.45(s; 3H); 2.96(dd; 1H); 2.74(dd; 1H); 2.31(s; 3H); 2.24(s; 3H); 1.92(m; 1H); 1.77(d; 3H); 0.84(d; 3H); 0.65(d; 3H)
1-370	7.41(d; 1H); 7.28(m; 2H); 7.08(d; 1H); 6.98(m; 2H); 6.84(m; 2H); 4.98(s; 2H); 3.63(s; 3H); 3.40(s; 3H); 2.96(q; 2H); 2.18(s; 3H); 2.14(s; 3H); 1.26(t; 3H)
1-403	7.43(d; 1H); 7.14(d; 1H); 7.18(m; 1H); 4.32(s; 2H); 3.66(s; 3H); 3.43(s; 3H); 3.39(s; 3H); 2.92(m; 2H); 2.31(s; 3H); 2.23(s; 3H); 1.51(m; 2H); 0.94(t; 3H)
1-414	7.41(d; 1H); 7.01(m; 2H); 3.58(s; 3H); 3.48(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.79(d; 2H); 2.06(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.85(m; 1H); 0.76(d; 6H)
1-415	7.39(d; 1H); 7.00(dd; 1H); 6.97(d; 1H); 3.88(m; 2H); 3.56(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.78(d; 2H); 2.05(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.84(m; 1H); 1.66(m; 2H); 0.95(t; 3H); 0.75(d; 6H)
1-417	8.18(d; 2H); 7.50(d; 2H); 7.38(d; 1H); 6.95(dd; 1H); 6.88(d; 1H); 5.22(s; 2H); 3.58(s; 3H); 3.41(s; 3H); 2.73(d; 2H); 2.08(s; 3H); 1.99(s; 3H); 1.73(m; 1H); 0.70(d; 6H)
1-419	7.33(d; 1H); 7.23(d; 2H); 6.93(dd; 1H); 6.89(d; 1H); 6.83(d; 2H); 5.06(s; 2H); 3.79(s; 3H); 3.56(s; 3H); 3.40(s; 3H); 2.73(d; 2H); 2.05(s; 3H); 2.01(s; 3H); 1.74(m; 1H); 0.70(d; 6H)

5

10

15

20

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
5	1-421 7.40(d; 1H); 7.16(m; 2H); 5.30(s; 2H); 3.61(t; 2H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.09(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 1.59(m; 2H); 1.37(m; 2H); 0.91(t; 3H); 0.76(d; 6H)
	1-422 7.39(d; 1H); 7.18(m; 2H); 5.31(s; 2H); 3.91(m; 1H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.08(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 1.22(d; 6H); 0.77(d; 6H)
	1-424 7.39(d; 1H); 7.23(m; 2H); 5.23(s; 2H); 3.58(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.07(s; 6H); 1.89(m; 1H); 1.26(s; 9H); 0.78(d; 6H)
10	1-425 7.39(d; 1H); 7.17(m; 2H); 5.43(d; 1H); 5.22(d; 1H); 3.68(m; 1H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.08(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 1.46-1.63(m; 2H); 1.20(d; 3H); 0.89(t; 3H); 0.77(dd; 6H)
	1-426 7.42(d; 1H); 7.10(m; 2H); 5.43(s; H); 4.14(q; 2H); 3.58(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.05(s; 3H); 2.01(s; 3H); 1.85(m; 1H); 0.76(d; 6H)
	1-427 7.40(d; 1H); 7.17(dd; 1H); 7.13(d; 1H); 5.87-5.98(m; 1H); 5.32(s; 2H); 5.29(dd; 1H); 5.20(dd; 1H); 4.16(d; 2H); 3.59(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.09(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.87(m; 1H); 0.76(d; 6H)
15	1-428 7.39(d; 1H); 7.15(m; 2H); 5.30(s; 2H); 3.60(t; 2H); 3.59(s; 3H); 3.43(s; 3H); 2.80(d; 2H); 2.09(s; 3H); 2.04(s; 3H); 1.88(m; 1H); 1.60(m; 2H); 1.27(m; 10H); 0.88(t; 3H); 0.77(d; 6H)
	1-429 7.49(d; 1H); 7.12(d; 1H); 7.08(dd; 1H); 3.68(s; 3H); 3.46(m; 1H); 3.46(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.40(m; 2H); 2.35(s; 3H); 2.25(s; 3H); 1.84-2.11(m; 5H); 0.80(d; 6H)
	1-448 7.49(d; 1H); 7.06(d; 1H); 6.98(m; 1H); 3.64(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.86(d; 2H); 2.39(s; 3H); 1.95(m; 1H); 1.38(s; 9H); 0.76(d; 6H)
20	1-452 7.49(d; 1H); 7.18(d; 1H); 7.13(m; 1H); 4.31(s; 2H); 3.71(s; 3H); 3.46(s; 3H); 3.42(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.32(s; 3H); 2.03(m; 1H); 0.79(d; 6H)
	1-514 7.53(d; 1H); 7.27(d; 1H); 7.16(dd; 1H); 3.72(s; 3H); 3.48(s; 3H); 2.92(d; 2H); 2.88(m; 1H); 2.43(s; 3H); 2.07(m; 1H); 1.21(d; 6H); 0.84(d; 6H)
	1-515 7.41(d; 1H); 7.21(s; 1H); 7.19(d; 1H); 5.28(s; 2H); 3.92(m; 1H); 3.63(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.82(d; 2H); 2.19(s; 3H); 1.94(m; 1H); 1.21(d; 6H); 0.79(d; 6H)
	1-516 7.55(d; 1H); 7.32(d; 1H); 7.16(dd; 1H); 3.79(s; 3H); 3.76(s; 3H); 3.49(s; 3H); 2.91(d; 2H); 2.47(s; 3H); 2.11(m; 1H); 0.92(d; 6H)

5

10

15

20

Nro.	^1H -RMN[CDCl_3 /TMS; valor δ (ppm)]
1-518	7.53(d; 1H); 7.28(d; 1H); 7.18(dd; 1H); 3.74(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.92(m; 1H); 2.91(d; 2H); 2.42(s; 3H); 2.07(m; 1H); 1.23(d; 6H); 0.84(d; 6H)
1-519	7.42(d; 1H); 7.22(d; 1H); 7.21(s; 1H); 5.28(s; 2H); 3.94(m; 1H); 3.63(s; 3H); 3.44(s; 3H); 2.82(d; 2H); 2.14(s; 3H); 1.95(m; 1H); 1.21(d; 6H); 0.79(d; 6H)
1-521	7.56(d; 1H); 7.35(d; 1H); 7.19(dd; 1H); 3.81(s; 3H); 3.76(s; 3H); 3.50(s; 3H); 2.94(d; 2H); 2.47(s; 3H); 2.14(m; 1H); 0.92(d; 6H)
1-522	8.17(br; 1H); 7.78(d; 1H); 7.47-7.53(m; 2H); 3.84(s; 3H); 3.47(s; 3H); 2.93(d; 2H); 2.62(s; 3H); 2.24(m; 1H); 0.95(d; 6H)
1-523	7.57(d; 1H); 7.39(d; 1H); 7.22(dd; 1H); 3.84(s; 3H); 3.76(s; 3H); 3.50(s; 3H); 2.95(d; 2H); 2.46(s; 3H); 2.15(m; 1H); 0.92(d; 6H)
1-524	7.51(d; 1H); 7.27(d; 1H); 7.20(dd; 1H); 3.74(s; 3H); 3.46(s; 3H); 2.99(m; 1H); 2.90(d; 2H); 2.37(s; 3H); 2.07(m; 1H); 1.26(d; 6H); 0.82(d; 6H)
1-539	7.55(d; 1H); 7.16(d; 1H); 7.11(dd; 1H); 6.87(s; 1H); 3.73(s; 3H); 3.48(s; 3H); 3.31(m; 1H); 2.89(d; 2H); 2.04(m; 1H); 1.27(d; 6H); 0.79(d; 6H)
1-540	7.55(d; 1H); 7.20(d; 1H); 7.12(dd; 1H); 7.05(s; 1H); 3.72(s; 3H); 3.49(s; 3H); 3.22(m; 1H); 2.90(d; 2H); 2.05(m; 1H); 1.26(d; 6H); 0.81(d; 6H)
1-541	7.56(d; 1H); 7.21(d; 1H); 7.15(s; 1H); 7.12(dd; 1H); 3.72(s; 3H); 3.49(s; 3H); 3.17(m; 1H); 2.91(d; 2H); 2.05(m; 1H); 1.25(d; 6H); 0.82(d; 6H)
1-542	7.57(d; 1H); 7.17(d; 1H); 7.09(dd; 1H); 7.06(s; 1H); 3.78(s; 3H); 3.49(s; 3H); 3.26(m; 1H); 2.90(d; 2H); 2.03(m; 1H); 1.24(d; 6H); 0.78(d; 6H)
1-544	7.51(d; 1H); 7.16(m; 1H); 6.97(d; 1H); 3.82(s; 3H); 3.65(s; 3H); 2.63(t; 2H); 2.27(s; 3H); 2.24(s; 3H); 2.10(s; 3H); 2.00(s; 3H); 1.67(m; 1H); 0.81(d; 6H)
1-545	7.47(d; 1H); 7.34(d; 1H); 7.11(m; 1H); 6.94(d; 1H); 6.86(d; 1H); 3.67(s; 3H); 2.60(t; 2H); 2.51(s; 3H); 2.38(s; 3H); 2.28(s; 3H); 1.73(m; 1H); 0.75(d; 6H)
2-28	7.62(s; 1H); 7.25(s; 1H); 3.71(s; 3H); 3.50(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.38(s; 3H); 2.32(s; 3H); 2.24(s; 3H); 2.02(m; 1H); 0.85(d; 6H)

5

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
2-38	7.41(s; 1H); 7.12(s; 1H); 3.72(s; 3H); 3.48(s; 3H); 2.88(d; 2H); 2.38(s; 3H); 2.30(s; 3H); 2.24(s; 3H); 2.40-2.30(m; 2H); 2.04(m; 1H); 1.14(t; 3H); 0.85(d; 6H)
2-40	8.26(s; 1H); 7.82(s; 1H); 7.27(br; 2H); 3.90(s; 3H); 3.45(s; 3H); 2.95(m; 2H); 2.57(s; 3H); 2.32(s; 3H); 1.71(m; 2H); 1.02(t; 3H)
2-41	7.37(s; 1H); 7.10(s; 1H); 6.30(s; 1H); 3.59(s; 3H); 3.47(s; 3H); 3.43(m; 1H); 2.92(br; 2H); 2.48(s; 3H); 2.17(s; 3H); 1.55(br; 2H); 1.28(d; 6H); 0.94(t; 3H)

El agente agrohortícola, en particular, insecticida o acaricida agrohortícola, conteniendo un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o una sal de la presente invención como ingrediente activo, es conveniente para controlar

5 las diversas plagas de insecto tales como las plagas de insecto agrohortícola, plagas de insecto de grano almacenado, plagas de insecto sanitarias, nemátodos, etc., las cuales son perjudiciales para arrozales, árboles de fruta, verduras, otros cultivos, flores y plantas ornamentales, etc. Los mismos tienen un marcado efecto insecticida, por ejemplo, en

10 LEPIDOPTEROS incluyendo tortrix de fruta de verano (Adoxophes orana fasciata), tortrix de té menor (Adoxophyes sp.), polilla de fruta manchú (Grapholita inopinata), polilla de fruta oriental (Grapholita molesta), perforador de vaina de soja (Leguminivora glycinivorella), enrollador de hoja de la morera (Olethreutes mori), enrollador de hoja de té (Caloptilia theviva), Caloptilia sp. (Caloptilia zachrysa), minador de hoja de manzano (Phyllonorycter ringoniella), minador de corteza de peral (Spulerrina astaurota), blanca

15 comun (Piers rapae crucivora), isoca del tabaco (Heliothis sp.), mariposa de la manzana (Laspey resia pomonella), palomita de las coles (Plutella xylostella), polilla de fruta de manzano (Argyresthia conjugella), polilla de fruta del duraznero (Carposina niponensis), perforador del tallo de arroz (Chilo suppressalis), enrollador de hoja de arroz (Cnaphalocrocis medinalis), polilla del tabaco (Ephestia elutella), piralido de la morera

20 (Glyphodes pyloalis), taladrador del arroz amarillo (Scirpophaga incertulas), saltador de arroz (Parnara guttata), oruga militar de arroz (Pseudaletia separata), barrenador del arroz (Sesamia inferens), gusano gris del tabaco (Spodoptera litura), oruga militar de remolacha (Spodoptera exigua), etc.;

HEMIPTEROS incluyendo saltador de hoja aster (Macrosteles fascifrons),

25 saltador de hoja de arroz verde (Nephotettix cincticeps), saltador de planta de arroz castaño (Nilaparvata lugens), saltador de planta de arroz de lomo blanco (Sogatella furcifera), (Diaphorina citri), mosca blanca de la uva (Aleurolibus taonabae), mosca blanca de batata (Bemisia tabaci), mosca blanca de invernadero (Trialeurodes vaporariorum), pulgón de nabo (Lipaphis erysimi), pulgón de durazno verde (Myzus persicae), cochinilla

30 de cera India (Ceroplastes ceriferus), cochinilla algodonosa de cítricos (Pulvinaria aurantii), cochinilla de alcanfor (Pseudaonidia duplex), cochinilla de San José

(Comstockaspis perniciosa), cochinilla de punta de flecha (Unaspis yanonensis), etc.;

TILENQUIDOS incluyendo escarabajo de la soja (Anomala rufocuprea), escarabajo japonés (Popillia japonica), escarabajo del tabaco (Lasioderma serricorne), escarabajo del aserrín (Lyctus brunneus), vaquita de veintiocho manchaa (Epilachna vigintiotopunctata),
 5 gorgojo de poroto azuki (Callosobruchus chinensis), gorgojo de verdura (Listroderes costirostris), gorgojo de maíz (Sitophilus zeamais), picudo del algodón (Anthonomus grandis grandis), gorgojo de agua de arroz (Lissorhoptrus oryzophilus), Escarabajo de la hoja de cucurbita (Aulacophora femoralis), escarabajo de la hoja de arroz (Oulema oryzae), escarabajo pulga rayado (Phyllotreta striolata), escarabajo de retoño de pino
 10 (Tomicus piniperda), Dorifora (Leptinotarsa decemlineata), escarabajo de frijol mexicano (Epilachna varivestis), vaquita de maíz (Diabrotica sp.), etc.;

DIPTEROS incluso mosca del melón (Dacus(Zeugodacus) cucurbitae),
 mosca de fruta oriental (Dacus (Bactrocera) dorsalis), minador de hoja de arroz (Agnomyza oryzae), gusano de cebolla (Delia antiqua), gusano de semilla de maíz (Delia
 15 platura), mosca enana de vaina de soja (Asphondylia sp.), etc.; TILENQUIDOS incluyendo nematodo de lesión de la raíz (Pratylenchus sp.), nematodo de quiste de papa (Globodera rostochiensis), nematodo de nudo de raíz (Meloidogyne sp.), nematodo de cítrico (Tylenchulus semipenetrans), Aphelenchus sp. (Aphelenchus avenae), foliar de crisantemo (Aphelenchoides ritzemabosi), etc.; y ACARINA incluyendo óbolo rojo
 20 (Panonychus citri), la araña roja del árbol de fruta (Panonychus ulmi), arañuela carmín (Tetranychus cinnabarinus), arañuela Kanzawa (Tetranychus Kanzawai Kishida), arañuela de dos manchas (Tetranychus urticae Koch), acárido de la roya de té rosa (Acaphylla theae), acárido de la roya de cítricos rosa (Aculops pelekassi), acárido de té púrpura (Calacarus carinatus), acárido de la roya de pera (Epitrimerus pyri), etc.

25 Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o sal de mismo de la presente invención es usado preferentemente como insecticida o acaricida agrohortícola. Sin embargo, el compuesto exhibe un excelente efecto de control contra las diversas plagas de insecto tales como las plagas de insecto del bosque y la madera, plagas de insecto de forrajeras, plagas de insecto sanitarias, etc. y puede ser
 30 usada como agente de control de plagas en los diversos campos amplios. Los ejemplos de plagas de insecto incluyen: Tabanidos tales como Tabanus rufidens Bigot; Muscidos

tales como mosca común (Musca domestica uicina MACQUART); Gasterofilidos tales como mosca de caballo (Gasterophilus intestinalis); Hypodermatidos tales como la larva del ganado (Hypoderma bovis L.); Foridos tales como Megaselia spiracularis; Culicidos tales como el mosquito doméstico pálido (Culex pipiens pallens), Anopheles sinensis,
 5 mosquito rayado (Aedes albopictus), y Aedes japonicus; Pulicidos tales como pulga del gato (Ctenocephalides felis), pulga del perro (Ctenocephalides canis), pulga humana (Pulex irritans); Ixodidos tales como Ixodes ovatus Neumann; Limantriidos tales como Euproctis similes; Rhincoforidos como gorgojo de arroz (Sitophilus zeamais); Vespidos como Vespa simillima xanthoptera Cameron; Blatelidos como cucaracha alemana (Blattella germanica);
 10 Blatidos como cucaracha americana (Periplaneta americana) y Periplaneta japónica; Ptiridos como piojo púbico (Phthirus pubis); Termitidos como termita japonesa (Reticulitermes speratus) y termita doméstica (Coptotermes formosanus); e Ixodidos como Ixodes persulcatus; y Macronisidos como rata tropical (Ornithonyssus bacoti).

El agente agrohortícola, en particular, insecticidas o acaricidas
 15 agrohortícolas, conteniendo un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o sal de mismo de la presente invención como ingrediente activo posee un marcado efecto de control en las plagas de insecto ejemplificadas precedentemente las cuales son perjudiciales en cultivos de arrozal, cultivos en tierras altas, árboles frutales, verduras y otros cultivos, flores y planta ornamentales, y lo similar. Por consiguiente, el
 20 efecto deseado de los insecticidas agrohortícolas de la presente invención puede ser exhibido aplicando los agentes a los arrozales, campos, árboles de fruta, verduras, otros cultivos, semillas de flores y plantas ornamentales, agua de arrozal, tallos y hojas, o tierra en una estación en la que se espera que aparezcan las plagas de insecto, antes de su aparición o en el momento en el cual su aparición es confirmada.

25 Las plantas para las cuales el agente agrohortícola de la presente invención puede ser usado, no están limitadas específicamente e incluyen, por ejemplo, la plantas ilustradas a continuación.

Los cereales (por ejemplo arroz (Oryza sativa), cebada (Hordeum vulgare), trigo (Triticum aestivum L.), centeno (Secale cereale), avena (Avena), maíz (Zea mays L.),
 30 kaoliang, etc.); legumbre (soja, poroto adzuki, poroto fava, poroto, maní, etc.); árboles de fruta y frutos (manzana, frutas cítricas, pera, uvas, durazno, ciruela, cereza, nuez,

almendra, banana, fresa, etc.); verduras (repollo, tomate, espinaca, brócoli, lechuga, cebolla, cebolla welsh, pimienta verde, etc.); verduras de raíz (zanahoria, papa, batata, rábano, raíz de loto, nabo, etc.); cosecha para procesar (algodón, lino (Linum usitatissimum), papel de morera (Broussonetia kasinoki SIEB), arbusto de papel

5 (Edgeworthia papyrifera), pimienta (Brassica napus L.); remolacha (Beta vulgaris), lúpulo, caña de azúcar (Saccharum officinarum), remolacha azucarera (Beta vulgaris var. saccharifera), oliva, caucho, café, tabaco, té, etc.); calabaza (zapallo, pepino, sandía, melón, etc.); césped (césped de huerto, sorgo, timothy (pasto europeo), trébol, alfalfa, etc.); césped (césped coreano, césped torcido, etc.); cultivos para especies (lavanda

10 (Lavandula officinalis CHAIX), romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.); y flores (crisantemo, rosa, orquídea, etc.).

Recientemente, el cultivo de gen recombinante (cultivo resistente a herbicida, cultivo resistente a plaga de insecto que incorpora gen generador de toxina insecticida, cultivo resistente a enfermedad que incorpora gen productor del inductor de

15 resistencia a enfermedad, cultivo sabor mejorado, cultivo con preservabilidad mejorada, cultivo con rendimiento mejorado, etc.), feromona sexual de insecto (feromona que destruye los compuestos químicos para polillas de errolladores de hoja, oruga militar de repollo, etc.), tecnología IPM (control de plaga integrado) que usa el insecto enemigo natural han progresado, y pueden ser usadas composiciones plaguicidas de la presente

20 invención en combinación con o para sistematización con tales tecnologías.

El agente agrohortícola de la presente invención generalmente es preparado en forma convenientemente utilizable según una modalidad convencional para la formulación de agroquímicos.

Es decir, el derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la

25 fórmula (I) o sal de la presente invención y, opcionalmente, un auxiliar es mezclado con un vehículo inerte conveniente en una proporción apropiada y es preparado en una forma de formulación conveniente tal como una suspensión, concentrado emulsionable, concentrado soluble, polvo humectable, gránulo dispersable en agua, gránulos, polvo, tabletas, conjunto o lo similar a través de disolución, dispersión, suspensión, mezcla,

30 impregnación, adsorción o adherencia.

El vehículo inerte utilizable en la presente invención puede ser tanto sólido como líquido. Como material utilizable como vehículo sólido, puede ejemplificarse harina de soja, harina de cereal, aserrín de madera, aserrín de corteza, aserrín, tallos de tabaco pulverizados, berros de agua pulverizados, salvado, celulosa pulverizada, residuo de extracto de vegetales, resinas tales como polímeros sintéticos pulverizados y lo similar, arcillas (por ejemplo caolín, bentonita, y arcilla ácida), talcos (por ejemplo talco y pirofilita), polvo o escamas de sílice (por ejemplo harina fósil, arena de cuarzo, mica y carbón blanco [sintético, ácido silícico de alta dispersión, también llamada sílice hidratada finamente dividida o ácido silícico hidratado, algunos de los productos disponibles comercialmente contienen silicato de calcio como componente principal]), polvos o minerales inorgánicos tales como carbón activado, azufre pulverizado, piedra pómez, harina fósil calcinada, ladrillo molido, ceniza, arena, carbonato de calcio, fosfato de calcio y lo similar, vehículos plásticos tales como polietileno, polipropileno, cloruro de poli(vinilideno) y lo similar, fertilizantes químicos (por ejemplo sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio), y abono. Estos vehículos pueden ser usados exclusivamente o como una mezcla de dos o más tipos de los mismos.

Un material utilizable como vehículo líquido se selecciona de materiales que tienen solubilidad por sí mismos, incluso sin tal solubilidad, sean capaces de dispersar un ingrediente activo con la ayuda de un auxiliar. Los siguientes son ejemplos típicos del vehículo líquido y pueden usarse exclusivamente o como una mezcla de dos o más tipos de los mismos: agua, alcoholes (por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, butanol y etilen glicol), cetonas (por ejemplo acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona y ciclohexanona), éteres (por ejemplo etil éter, dioxano, Cellosolve, dipropil éter y tetrahidrofurano), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo querosén y aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo benceno, tolueno, xileno, nafta disolutiva y alquilnaftalenos), hidrocarburos halogenados (por ejemplo dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno), ésteres (por ejemplo acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato dibutílico y ftalato de dioctilo), amidas (por ejemplo dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida), nitrilos (por ejemplo el acetonitrilo), y dimetilsulfóxido.

Lo siguiente son ejemplos típicos del auxiliar, el cual es usado dependiendo en los propósitos y es usado exclusivamente o en combinación de dos o más tipos, o en algunos casos, no necesita ser usado en absoluto.

5 Para emulsionar, dispersar, disolver y/o humectar un compuesto tal como el ingrediente activo, se utiliza un agente tensoactivo. Como el agente tensoactivo, pueden ejemplificarse polioxietilen éteres de alquilo, polioxietilen éteres de alquilarilo, polioxietilen ésteres de ácido graso superior, polioxietilen resonatos, monolaurato de polioxietilen sorbitan, monooleato de polioxietilen sorbitan, alquilarilsulfonatos, productos de condensación de ácidos naftalen sulfónicos, ligninsulfonatos y ésteres de sulfato de alcohol superior.

Además, para estabilizar la dispersión de un compuesto como ingrediente activo, hacerla adhesiva y/o unificarla, también pueden usarse los auxiliares ejemplificados a continuación, a saber, también puede usarse auxiliares tales como caseína, gelatina, almidón, metil celulosa, carboximetil celulosa, goma árabe, poli(vinil alcohol)es, trementina, aceite de salvado, bentonita y ligninsulfonatos.

Para mejorar la fluidez de un producto sólido, pueden usarse también los auxiliares siguientes, a saber, pueden usarse auxiliares tales como ceras, estearatos, alquil fosfatos, etc.

20 Los auxiliares tales como los productos de condensación de ácidos naftalensulfónicos y fosfatos policondensados pueden ser usados como un peptizador para los productos dispersables.

Los auxiliares tales como aceites de silicona también pueden usarse como agente antiespuma.

25 Los auxiliares tales como 1,2-benzisotiazolin-3-ona, p-cloro-m-xilenol, butil p-hidroxibenzoato también pueden ser agregados como un conservante.

Además, si fuera necesario, agentes de extensión funcionales, mejoradores activos tales como inhibidor de descomposición metabólico como butóxido del piperonilo, agente anticongelante tal como propilenglicol, antioxidantes tales como BHT, también pueden ser agregados absorbentes ultravioletas, y otros aditivos.

30 El contenido del compuesto como ingrediente activo puede variar según sea requerido, y el compuesto como ingrediente activo puede ser usado en una

000175

proporción apropiadamente elegida en la escala de 0.01 a 90 partes en peso por 100 partes de los agentes agrohortícolas. Por ejemplo, en polvos o gránulos, el contenido conveniente del compuesto como ingrediente activo es de 0.01 a 50% en peso. En la concentración emulsionable o polvo humectable, también es de 0.01 a 50% en peso.

5 El agente agrohortícola de la presente invención es utilizado para controlar una variedad de plagas de insecto de la manera siguiente: es aplicado a un cultivo en el cual se espera que aparezcan las plagas de insecto, o un sitio en donde no se desea la aparición o crecimiento de plagas de insecto, tal como está o después de ser apropiadamente diluído o suspendido en agua o lo similar, en una cantidad eficaz para el control de las plagas de insecto.

La dosificación aplicada del agente agrohortícola de la presente invención dependerá de los diversos factores tales como propósito, plagas de insecto a ser controlado, estado de crecimiento de planta, tendencia de aparición de plagas de insecto, tiempo, condiciones ambientales, forma de formulación, método de aplicación, sitio de aplicación y tiempo de aplicación. Puede elegirse apropiadamente en la escala de 0.001 g a 10 kg, preferentemente 0.01 g a 1 kg, (en lo que se refiere al compuesto como ingrediente activo) por acre dependiendo de los propósitos.

El agente agrohortícola de la presente invención puede usarse en una mezcla con otros insecticidas agrohortícolas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, plaguicidas bióticos o lo similar para extender tanto el espectro de especies de plaga de insecto controlable como el período de tiempo cuando es posible la aplicación eficaz o para reducir la dosificación. Además, puede usarse el insecticida agrohortícola de la presente invención en una mezcla con herbicidas, reguladores de crecimiento de planta, fertilizantes o lo similar, dependiendo de las situaciones de aplicación.

25 Como otros insecticidas agrohortícolas, acaricidas y nematocidas que se usan para el propósito anterior pueden ejemplificarse los insecticidas agrohortícolas, acaricidas y nematocidas, tales como Etion, Triclorfon, Metamidofos, Acefato, Diclorvos, Mevinfos, Monocrotofos, Malation, Dimetoato, Formotion, Mecarbam, Vamidotion, Tiometon, Disulfoton, Oxideprofos, Naled, Metilparation, Fenitrothion, Cianofos, Propafos, Fention, Protiofos, Profenofos, Isofenfos, Temefos, Phentoato, Dimetilvinfos, Clorfeninfos, Tetraclorvinfos, Foxim, Isoxation, Piraclofos, Metidation, Clorpirifos,

Clorpirifos-metilo, Piridafention, Diazinon, Pirimifosmetil, Fosalona, Fosmet, Dioxabenzofos, Quinalfos, Terbufos, Etoprofos, Cadusafos, Mesulfenfos, Spiroclifofen, Metaflumizona, Flubendiamida, DPS (NK-0795), Fosfocarb, Fenamifos, Isoamidofos, Fostiazato, Isazofos, Etoprofos, Fention, Fostietano, Diclofention, Tionazin, Sulprofos, 5 Fensulfotion, Diamidafos, Piretrina, Aletrina, Praletrina, Resmetrina, Permetrina, Teflutrina, Bifentrina, Fenpropatrina, Cipermetrina, α -Cipermetrina, Cihalotrina, λ -Cihalotrina, Deltametrina, Acrinatrina, Fenvalerato, Esfenvalerato, Cicloprotrina, Etofenprox, Halfenprox, Silafluofen, Flucitrinato, Fluvalinato, Metomil, Oxamil, Tiodicarb, Aldicarb, Alanicarb, Cartap, Metolcarb, Xililcarb, Propoxur, Fenoxicarb, Fenobucarb, Etiofencarb, 10 Fenotiocarb, Bifenazato, BPMC, Carbarilo, Pirimicarb, Carbofuran, Carbosulfan, Furatiocarb, Benfuracarb, Aldoxicarb, Diafentiuron, Diflubenzuron, Teflubenzuron, Hexaflumuron, Novaluron, Lufenuron, Flufenoxuron, Clorfluazuron, óxido de Fenbutatina, hidróxido de Triciclohexiltina, oleato de sodio, oleato de potasio, Metopreno, Hidropreno, Binapacril, Amitraz, Dicofol, Kersen, Clorobenzilato, Bromopropilato, Tetradifon, 15 Bensultap, Benzoximato, Tebufenozida, Metoxifenoza, Piridalilo, Cromafenozida, Propargita, Acequinosil, Endosulfan, Diofenolan, Clorfenapil, Fenpiroximato, Tolfenpirad, Fipronil, Tebufenpirad, Triazamato, Etoxazol, Hexitiazox, sulfato de Nicotina, Nitenpiram, Acetamiprid, Tiaclopid, Imidaclopid, Tiametoxam, Clotianidin, Dinotefuran, Fluazinam, Piriproxifen, Hidrametilnon, Pirimidifen, Piridaben, Ciromazin, TPIC (isocianurato de 20 tripropilo), Pimetrozin, Clofentezin, Buprofedín, Thiociclám, Fenazaquin, Cinometionato, Indoxacarb, complejos de Polinactina, Milbemectina, Abamectina, Emamectin-benzoato, Spinosad, BT (Bacillus thuringiensis), Azadiractina, Rotenona, Hidroxipropil almidon, clorhidrato de Levamisol, Metam-sodio, tartrato de Morantel, Dazomet, Triclamida, Pasteuria penetrans, Monacrosporium-phymatophagum, etc.

25 Como los fungicidas agrohortícolas usados para el mismo propósito como el anterior, pueden ejemplificarse los fungicidas agrohortícolas tales como azufre, azufre de cal, sulfato de cobre básico, Iprobenfos, Edifenfos, Tolclofos-metilo, Tiram, Policarbamato, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Tiofanato, metil Tiofanato, Benomil, acetato de Iminoctadina, albecilato de Iminocutadina, Mepronil, Flutolanil, Pencicuron, 30 Furametpil, Tifluzamida, Metalaxil, Oxadixil, Carpropamid, Diclofluánid, Flusulfamida, Clorotalonil, Cresoxim-metilo, Fenoxanil, Himexazol, Etridiazol, Fluoroimida, Procimidona,

Vinclozolin, Iprodiona, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizol, Ipconazol, Fluconazol, Propiconazol, Difenconazol, Myclobutanil, Tetraconazol, Hexaconazol, Tebuconazol, Tiadinil, Imibenconazol, Procloraz, Pefurazoato, Ciproconazol, Isoprotilano, Fenarimol, Pirimetanil, Mepanipirim, Pirifenox, Fluazinam, Triforina, Diclomezina, Azoxistrobina, 5 Tiadiazina, Captan, Probenazol, Acibenzolar-S-metilo, Ftalida, Triciclazol, Piroquilon, Cinometionat, ácido Oxolínico, Ditianon, Casugamicina, Validamicina, Polioxin, Blasticidin, Estreptomicina, etc.

De manera similar, como los herbicidas, pueden ejemplificarse los herbicidas tales como Glifosato, Sulfosato, Glifosinato, Bialafos, Butamifos, Esprocarb, 10 Prosulcarb, Bentiocarb, Piributicarb, Asulam, Linuron, Dimron, Isouron, Bensulfuron metilo, Ciclosulfamuron, Cinosulfuron, Pirazosulfuron etilo, Azimsulfuron, Imazosulfuron, Tenilclor, Alaclor, Pretilaclor, Clomeprop, Etobenzanid, Mefenacet, Pendimetalina, Bifenox, Acifluorfen, Lactfen, Cihalofof-butilo, Ioxinil, Bromobutida, Aloxidim, Setoxidim, Napropamida, Indanofan, Pirazolato, Benzofenap, Piraflufen-etilo, Imazapil, Sulfentrazona, 15 Cafenstrol, Bentoxazon, Oxadiazon, Paraquat, Diquat, Piriminobac, Simazina, Atrazina, Dimetametrina, Triaziflam, Benflesato, Flutiacet-metilo, Quizalofop-etilo, Bentazon, peróxido de calcio, etc.

Como los plaguicidas bióticos, puede esperarse el mismo efecto como el anterior usando el agente agrohortícola de la presente invención en una mezcla, por 20 ejemplo, con las formulaciones virales obtenidas del virus de polihedrosis nuclear (NPV), virus de granulosis (GV), virus de polihedrosis citoplásmica (CPV), virus de entomopox (EPV), etc.; plaguicidas microbianos utilizados como insecticidas o nematicidas, tales como Monacrosporium phymatophagum, Steinernema carpocapsae, Steinernema kushidai, Pasteuria penetrans, etc.; plaguicidas microbianos utilizados como fungicidas, 25 tales como Trichoderma lignorum, Agrobacterium radiobactor, Erwinia carotovora no patógena, Bacillus subtilis, etc.; y los plaguicidas bióticos utilizados como herbicidas, tales como Xanthomonas campestris, etc.

Adicionalmente, el agente agrohortícola de la presente invención puede ser usado en combinación con plaguicidas bióticos que incluyen a los enemigos naturales 30 tales como la avispa parasitaria (Encarsia formosa), avispa parasitaria (Aphidius colemani), mosquito de agalla Aphidoletes aphidimyza, avispa parasitaria (Diglyphus

isaea), ácaro parasitario (Dacnusa sibirica), ácaro predador (Phytoseiulus persimilis), ácaro predador (Amblyseius cucumeris), bicho predador (Orius sauteri), etc.; plaguicidas microbianos tales como Beauveria brongniartii, etc.; y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona, 14-metil-1-octadeceno, etc.

EJEMPLOS

Los derivados de pirazolcarboxanilida sustituidos representados por la fórmula (I), y derivados de anilina sustituidos representados por la fórmula (II) y ácido pirazolcarboxílico sustituido representado por la fórmula (IV), los cuales son compuestos intermedios, de la presente invención, serán explicados en lo siguiente con referencia a Ejemplos, los cuales no deberán ser interpretados como restrictivos de la presente.

EJEMPLO 1

Producción de ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (compuesto No. 4-1)

4-yodo-1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol (8.7 g, 30 mmoles) fue disuelto en tetrahidrofurano (87 ml), y fue agregada una solución (1.6 M; 28 ml) de n-butil litio en hexano despacio bajo una atmósfera de argón con enfriamiento con hielo seco-acetona (no superior que -60°C). Después de agitar a -70°C por 30 min, la mezcla fue calentada gradualmente a la temperatura ambiente mientras se hacía burbujear anhídrido carbónico. La mezcla de la reacción fue vertida en el agua, la capa orgánica fue eliminada, y la capa acuosa fue acidificada con ácido clorhídrico. La capa acuosa fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida. Los cristales en bruto obtenidos fueron lavados con hexano para dar el compuesto deseado (4.67 g) como cristales. Rendimiento 74%

Propiedad: punto de fusión 124 – 125.5°C

EJEMPLO 2

Producción de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-211)

El ácido 1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (2.09 g; 10 mmoles) fue disuelto en cloruro de tionilo, y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 3 hr. La mezcla fue concentrada bajo presión reducida para dar el cloruro de 1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carbonilo. Esto fue agregado a una solución de 3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (3.29 g; 10 mmoles) y trietilamina (3.03 g; 30 mmoles) en tetrahidrofurano (30 ml), y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 2 hr. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, lavada con agua, y secada sobre sulfato de magnesio. Después de concentración bajo presión reducida, el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:1) para dar el compuesto deseado (3.64 g) como cristales.

Rendimiento 70%.

Propiedad: punto de fusión 138-139°C.

EJEMPLO 3

Producción de N-metoximetil-N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-222)

El hidruro de sodio (32 mg; 60%; 0.8 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (250 mg; 0.48 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, una solución de éter metílico del clorometil (64 mg; 0.8 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml) fue agregada y la mezcla fue agitada por 5 hr. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluído y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio, y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=2:1) para dar el compuesto deseado

(238 mg).

Rendimiento 88%

Propiedad: n_D 1.4669 (22.4°C).

5

EJEMPLO 4

Producción de 2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto No. 3-1)

5-n-propil-2-metilanilina (14.9 g; 0.1 moles) fueron diluidos en un solvente
10 mezclado (300 ml) de terc-butil metiléter-agua (1:1), y yoduro de heptafluoroisopropilo
(29.6 g; 0.1 moles), sulfato ácido de tetrabutilamonio (3.4 g; 0.01 moles), carbonato ácido
de sodio (8.4 g; 0.1 moles) y ditionito de sodio (17 g; 0.1 moles) fue agregado
consecutivamente. La mezcla fue agitada toda la noche a la temperatura ambiente. La
mezcla de reacción fue diluida en hexano, lavada dos veces con 3N ácido clorhídrico, y
15 fue lavada con carbonato ácido de sodio acuoso y solución salina saturada. La capa
orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio, y fue concentrada bajo presión reducida.
El residuo fue purificado por cromatografía de gel de sílice (hexano:acetato de etilo 5:1)
para dar el compuesto deseado (28.5 g).

Rendimiento 90%

20 Propiedad: $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7.09(s; 1H); 6.54(s; 1H);
3.76(bs; 2H); 2.63(m; 2H); 2.13(s; 3H); 1.58(m; 2H); 0.96(t; 3H)

EJEMPLO 5

Producción de 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n- 25 propilanilina (compuesto No. 3-3)

2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (1.6 g; 5
mmoles) fue disuelto en una solución 28% (9.6 g) de metóxido de sodio en metanol, y la
mezcla fue calentada bajo reflujo por 3 hr. Después de permitir enfriar, la mezcla de
30 reacción fue vertida en agua helada y fue extractada con acetato de etilo. La capa
orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada

bajo presión reducida. El residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=5:1) para dar el compuesto deseado (1.31 g).

Rendimiento 79%.

Propiedad: ^1H -RMN[CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7.10(s; 1H); 6.66(s; 1H);

5 3.72(bs; 2H); 3.42(s; 3H); 2.84(m; 2H); 2.14(s; 3H); 1.61(m; 2H); 1.00(t; 3H).

EJEMPLO 6

Producción de 2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina

(compuesto No. 3-2)

10

2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (1.6 g; 5 mmoles) fue disuelto en dimetilsulfóxido (20 ml), borohidruro de sodio (378 mg, 10 mmoles) fue agregado por porciones pequeñas, y la mezcla fue agitada a 60°C por 5 hr. Fue agregado hielo a la mezcla de reacción por porciones pequeñas, y entonces el ácido acético fue agregado por gotas. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, y la capa orgánica fue lavada 4 veces con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida para dar el compuesto deseado (1.47 g).

15

Rendimiento: 99%

Propiedad: ^1H -RMN[CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 7.18(s; 1H); 6.54(s; 1H);

20 4.45-4.20(br; 2H); 4.27(m; 1H); 2.50(dd; 2H); 2.14(s; 3H); 1.57(m; 2H); 0.98(t; 3H).

EJEMPLO 7

Producción de N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propylfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 2-15)

25

El cloruro de 1,3,5-Trimetilpirazol-4-carbonilo (172 mg, 1 mmoles), 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil (329 mg, 1 mmol) y trietilamina (303 mg, 3 mmoles) fue disuelto en tetrahidrofurano (10 ml), y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 3 hr. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, y fue lavada con agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro y fue concentrada bajo presión reducida. El residuo obtenido fue purificado por

30

cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:2) para dar el compuesto deseado (360 mg).

Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 132-134°C.

5

EJEMPLO 8

Producción de N-acetil-N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 2-16)

10 El hidruro de sodio (32 mg; 60%; 0.8 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (250 mg; 0.53 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de anhídrido acético (80 mg; 15 0.78 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluido, y la mezcla fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el 20 compuesto deseado (139 mg).

Rendimiento: 52%

Propiedad: n_D 1.4905 (25.9°C).

EJEMPLO 9

Producción de N-{2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 2-13)

25 En la misma manera como en el Ejemplo 7 sólo que 2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina fue usada en lugar de 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-30 1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilanilina, la reacción fue realizada durante 3 hr para dar el compuesto deseado.

Rendimiento: 66%

000183

Propiedad: punto de fusión 128-131°C.

EJEMPLO 10

5 Producción de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-
1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-155)

10 El cloruro de 1,3,5-trimetilpirazol-4-carbonilo (3.93 g; 22.8 mmoles), 3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (5.0 g; 15.2 mmoles); y trietilamine (3.07 g; 30.4 mmoles) fue disuelto en tetrahidrofurano (100 ml); y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 5 hr. La mezcla de reacción fue diluída con acetato de etilo, y fue lavada con agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro y fue concentrada bajo presión reducida. Los cristales obtenidos en bruto fueron lavados con éter para dar el compuesto deseado (5.62 g).

15 Rendimiento: 80%

Propiedad: punto de fusión 189-190°C.

EJEMPLO 11

20 Producción de N-etoximetil-N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-
(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-145)

25 El hidruro de sodio (29 mg; 60%; 0.73 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (260 mg; 0.48 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de clorometil etil éter (70 mg; 0.73 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluído, y la mezcla fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el compuesto deseado

30

(200 mg).

Rendimiento: 69%

000184

Propiedad: n_D 1.4892 (22.4°C).

5

EJEMPLO 12

Producción de N-isobutiloxycarbonil-N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-152)

El hidruro de sodio (29 mg; 60%; 0.73 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (260 mg; 0.48 mmoles) en tetrahidrofurano (5 ml) fue agregada por gotas. Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de clorocarbonato de isobutilo (100 mg; 0.73 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluido y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:1) para dar el compuesto deseado (280 mg).

20

Rendimiento: 91%

Propiedad: n_D 1.4829 (22.3°C).

EJEMPLO 13

Producción de N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-123)

25

El cloruro de 1,3,5-Trimetilpirazol-4-carbonilo (2.09 g; 10.0 mmoles), 3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (2.0 g; 6.69 mmoles), y trietilamina (1.35 g; 13.4 mmoles) fueron disueltos en tetrahidrofurano (60 ml), y la mezcla fue calentada bajo reflujo por 5 hr. La mezcla de reacción fue diluida con acetato de etilo, y fue lavada con agua. La capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidro y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por

30

cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el compuesto deseado (2.41 g).

Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 148-151°C.

5

EJEMPLO 14

Producción de N-acetil-N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto No. 1-125)

10 El hidruro de sodio (38 mg; 60%, 0.96 mmoles) fue suspendido en tetrahidrofurano (10 ml), y una solución de N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (300 mg; 0.64 mmoles) fue
agregada por gotas en tetrahidrofurano (5 ml). Después de agitar a la temperatura ambiente por 30 min, fue agregada una solución de cloruro de acetilo (75 mg; 0.96
15 mmoles) en tetrahidrofurano (2 ml), y la mezcla fue agitada durante un día. La mezcla de reacción fue vertida en ácido clorhídrico diluído y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada con agua, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida, y el residuo obtenido fue purificado por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo=1:3) para dar el compuesto deseado
20 (90 mg).

Rendimiento: 28%.

Propiedad: n_D1.5021 (22.5°C).

PRODUCCION DE EJEMPLO DE REFERENCIA 1

4-yodo-1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol

25 El yodo (30. g) fue disuelto en 60% ácido sulfúrico (humeante, 80 g), y fue agregado 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol (13.12 g; 80 mmoles) despacio bajo enfriamiento con hielo. La mezcla fue agitada a 0°C por 2 hr. La mezcla de reacción fue vertida en agua helada y fue extractada con acetato de etilo. La capa orgánica fue lavada
30 con tiosulfato de sodio acuoso y solución salina saturada, fue secada sobre sulfato de magnesio y fue concentrada bajo presión reducida. Los cristales en bruto obtenidos

fueron lavados con hexano para dar el compuesto deseado (20 g) como cristales.

Rendimiento: 86%

Propiedad: ^1H -RMN[CDCl_3/TMS , valor de δ (ppm)] 3.98(s; 3H); 2.26(s; 3H).

Los ejemplos de formulación y ejemplo de prueba típicos de la presente
5 invención se describen a continuación pero los mismos no deben ser interpretados como limitando el alcance de la invención.

Como se utiliza en los ejemplos, los términos "parte" y "partes" están en peso.

10 Ejemplo de Formulación 1

Cada compuesto en el Cuadro 1 o Cuadro 2 10 partes

Xileno 70 partes

N-metilpirrolidona 10 partes

Mezcla de polioxietilen nonilfenil 10 partes

15 éter y alquilbencensulfonato de calcio

Una concentración emulsionable fue preparada mezclando uniformemente los ingredientes anteriores para efectuar la disolución.

Ejemplo de Formulación 2

20 Cada compuesto en el Cuadro 1 o Cuadro 2 3 partes.

Polvo de arcilla 82 partes

Polvo de tierra de diatomeas 15 partes

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

25

Ejemplo de Formulaición 3

Cada compuesto en el Cuadro 1 o Cuadro 2 5 partes.

polvo mezcla de bentonita y arcilla 90 partes

Ligninsulfonato de calcio 5 partes

30 Los gránulos fueron preparados mezclando uniformemente los ingredientes anteriores, y amasando la mezcla resultante junto con una cantidad conveniente de agua,

seguido por granulación y secado.

Ejemplo de Formulación 4

	Cada compuesto	
5	enumerado en el Cuadro 1 o Cuadro 2	20 partes
	Mezcla de caolín y ácido silícico sintético	
	de alta-dispersión	75 partes
	Mezcla de polioxietilen nonilfenil éter y	
	alquilbencensulfonato de calcio	5 partes
10	Fue preparado un polvo humectable mezclando uniformemente y moliendo los ingredientes anteriores.	

EJEMPLO DE PRUEBA 1

La acción acaricida en el ácaro arañuela de dos manchas (Tetranychus urticae)

15 El disco de lámina de poroto riñón con un diámetro de 2 cm fue colocado en el papel de filtro humedecido. Se inocularon diez hembras adultas de arañuela de dos manchas en cada disco de hoja, y fue rociado con 50 ml de solución de prueba, preparada diluyendo una formulación que contiene cada compuesto enumerado en el

20 Cuadro 1 o Cuadro 2 como ingrediente activo ajustando cada una de las concentraciones a 500 ppm, 50 ppm y 5 ppm.. Dos días después del tratamiento, las arañuelas sobrevividas fueron contadas. La mortalidad corregida fue calculada por la ecuación siguiente y la actividad acàricida fue evaluada según el criterio ilustrado a continuación. El experimento fue realizado con dos copias bajo la condición de 25°C.

25

$$\text{Mortalidad corregida (\%)} = \frac{\text{Número de ácaros sobrevivientes en el grupo sin tratar} - \text{Número de ácaros sobrevivientes en el grupo tratado}}{\text{Número de ácaros sobrevivientes en el grupo sin tratar}} \times 100$$

30 Criterio:

A --- Mortalidad corregida 100%

B --- Mortalidad corregida 99%-90%

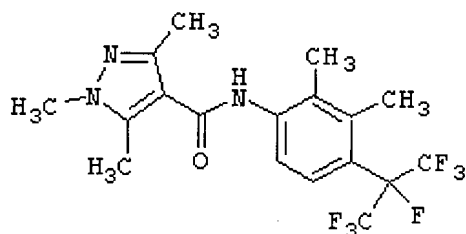
000188

C --- Mortalidad corregida 89%-80%

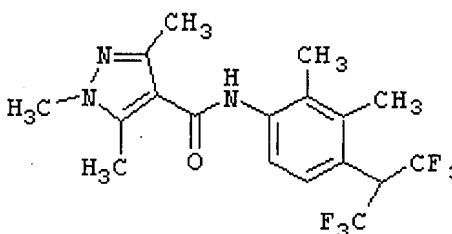
D --- Mortalidad corregida 79%-50%.

Como compuestos comparativos, fueron utilizados los compuestos Nros. 1-

5 163 y 1-164 descritos en JP-A-2003-48878.



10 { 1-163 }



{ 1-164 }

Como resultado de la prueba indicada precedentemente, los compuestos

Nros. 1-1, 1-3, 1-4, 1-6, 1-8, 1-10, 1-12, 1-13, 1-15, 1-16, 1-25 a 1-28, 1-31, 1-34 a 1-37,

1-45, 1-47 a 1-49, 1-51 a 54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-67, 1-69 a 1-72, 1-74 a 1-76, 1-89, 1-101

a 1-114, 1-120 a 1-160, 1-176 a 1-225, 1-228, 1-234, 1-246, 1-258, 1-260, 1-266, 1-270,

15 1-282, 1-285, 1-294, 1-306 a 1-325, 1-327 a 1-332, 1-335 a 1-337, 1-339 a 1-342, 1-344 a

1-358, 1-361 a 1-373, 1-375 a 1-380, 1-382 a 1-384, 1-386 a 1-389, 1-391 a 1-394, 1-396,

1-399 a 1-406, 1-412 a 416, 1-420 a 1-423, 1-425 a 1-427, 1-429 a 1-433, 1-435 a 1-439,

1-441 a 1-445, 1-448, 1-450 a 1-452, 1-454 a 1-463, 1-467 a 1-470, 1-473, 1-477, 1-478,

1-482 a 1-487, 1-489 a 1-493, 1-496 a 1-502, 1-510, 1-514, 1-515, 1-518, 1-519, 1-523 a

20 1-527, 1-531, 1-539 a 1-541, 1-546 a 1-549, 2-13, 2-15 a 2-17, 2-21 a 2-23, 2-25, 2-34, 2-

36 a 39, 2-41 a 43 y 2-45 de la presente invención demostraron una actividad A en

cualquier concentración de 500 ppm, 50 ppm y 5 ppm, y los compuestos Nros. 1-23, 1-32,

1-78, 1-173, 1-284, 1-326, 1-334, 1-338, 1-343, 1-385, 1-397 a 1-398, 1-408, 1-410, 1-

417, 1-440, 1-447, 1-449, 1-464, 1-472, 1-475, 1-476, 1-479, 1-480, 1-504 a 1-506, 1-509,

25 1-521, 1-529, 1-530, 1-533, 1-542, 2-26 a 2-33, 2-40 y 2-46 demostraron una actividad A

en cualquier concentración de 500 ppm y 50 ppm. En contraste, los dos compuestos de

control ni siquiera demostraron una actividad acaricida a la concentración de 500 ppm.

Actividad Industrial

30 Según la presente invención, se pueden proveer agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas y acaricidas, que poseen propiedades superiores en

comparación a las técnicas convencionales.

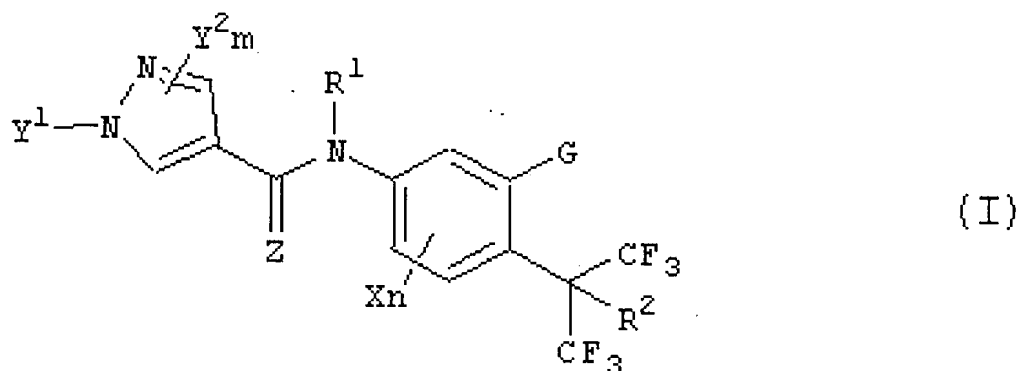
Esta solicitud está basada en las solicitudes de patente Nos. 234405/2005, 322531/2005 y 114937/2006 presentadas en Japón, cuyos contenidos son incorporados a la presente por referencia.

5 Mientras esta invención se ha ilustrado y se ha descrito con referencia a las modalidades preferidas de la misma, los expertos en la técnica entenderán que pueden hacerse varios cambios en la forma y detalles en la misma sin apartarse del alcance de la invención abarcado por las reivindicaciones anexas.

10 Todas las patentes, las publicaciones patentes y otras publicaciones identificadas o referenciadas están incorporados dentro de la presente por referencia en su totalidad.

RESUMEN DE LA INVENCION

Se describe un derivado de anilida del ácido pirazolcarboxílico sustituido representado por la siguiente fórmula (I):



pesticida o

acaricida para uso agrohortícola; (en la fórmula, R¹ representa H, un alquilo, un alquilcarbonilo, un alquenilcarbonilo, un cicloalquilo, un fenilalquilo, fenilcarbonilo y lo similar; R² representa H, un halógeno, alquilo, CN, OH, un alcoxilo, un fenoxilo, un feniltio, un fenilsulfonilo y lo similar; G representa un alquilo, un alquenilo, un alquinilo, un cicloalquilo, un cicloalquenilo de C₃-C₁₀ y lo similar; Z representa O ó S; X representa H, un halógeno, CN, NO₂, un alquilo y lo similar; Y¹ representa H, un alquilo, un alquenilo, un fenilo, un alcoxialquilo y lo similar; Y² representa H, un halógeno, CN, NO₂, OH, un mercapto, un amino, un carboxilo, un alquilo de C₁-C₆, un fenilo, un fenoxilo, un anillo heterociclo y lo similar, m representa 1 ó 2; y n representa un número de 1-3).

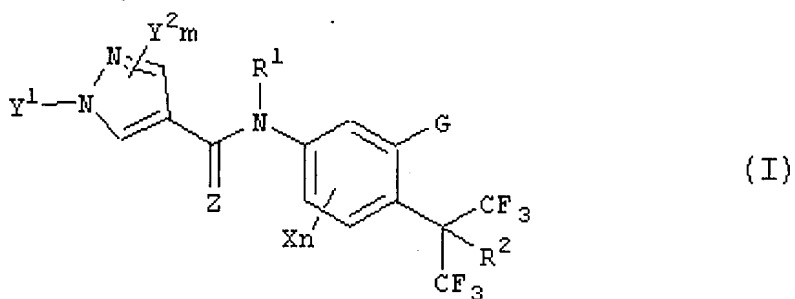
41B

P08/85F

REIVINDICACIONES DE SOLICITUD DIVISIONAL

1. Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I):

5



10 en donde

R^1

R^1 es un átomo de hidrógeno, o un grupo alquilcarbonilo C_1-C_6 ;

R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alcoxi C_1-C_3 ;

G es un grupo alquilo C_2-C_8 ;

15 Z es un átomo de oxígeno;

Y^1 es un grupo alquilo C_1-C_3 ;

Y^2 es un grupo alquilo C_1-C_3 ; y

m es 2,

o una sal de los mismos.

20

2. El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R^1 es un grupo isobutiril;

R^2 es un grupo metoxi;

25 G es un grupo isobutil;

Z es un átomo de oxígeno;

Y^1 es metil;

Y^2 es metil; y

m es 2,

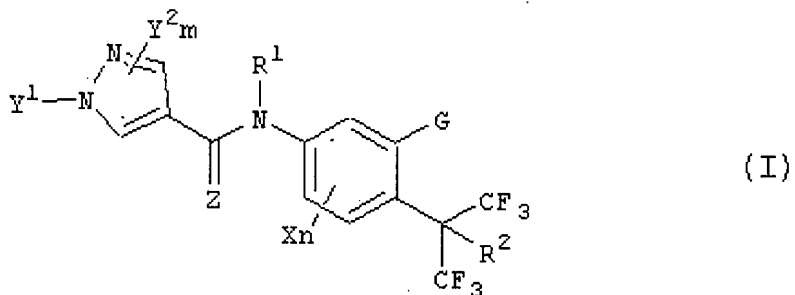
30 o una sal de los mismos

3. Una composición agrohortícola que comprende un derivado pirazolcarboxanilida sustituido de la reivindicación 1 a 2 o una sal del mismo.
- 5 4. La composición agrohortícola de conformidad con la reivindicación 3, caracterizada porque es un insecticida o acaricida agrohortícola.

REIVINDICACIONES DE SOLICITUD DIVISIONAL

1. Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I):

5



10 en donde

R^1

R^1 es un átomo de hidrógeno, o un grupo alquilcarbonilo C_1-C_6 ;

R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alcoxi C_1-C_3 ;

G es un grupo alquilo C_2-C_8 ;

15 Z es un átomo de oxígeno;

Y^1 es un grupo alquilo C_1-C_3 ;

Y^2 es un grupo alquilo C_1-C_3 ; y

m es 2,

o una sal de los mismos.

20

2. El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R^1 es un grupo isobutiril;

R^2 es un grupo metoxi;

25 G es un grupo isobutil;

Z es un átomo de oxígeno;

Y^1 es metil;

Y^2 es metil; y

m es 2,

o una sal de los mismos

3. Una composición agrohortícola que comprende un derivado pirazolcarboxanilida sustituido de la reivindicación 1 a 2 o una sal del mismo.

5

4. La composición agrohortícola de conformidad con la reivindicación 3, caracterizada porque es un insecticida o acaricida agrohortícola.