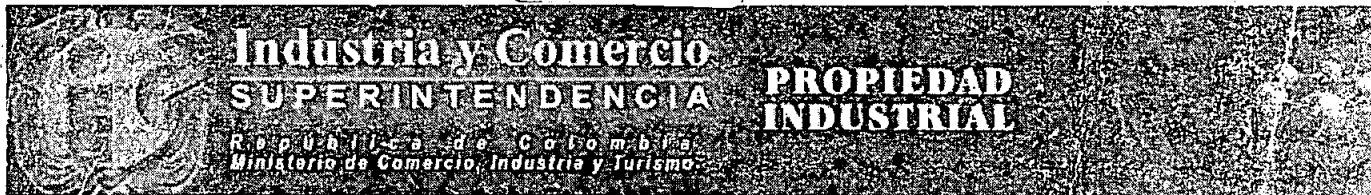




CSA238844

OP



Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

Organización de la Propiedad Industrial

SOLICITUD DE

PCT

**PATENTE DE INVENCION
PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL**

08-23840

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO: 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

52. CLASIFICACION INTERNACIONAL: C07D 231/14. A01N 43/56

71. SOLICITANTE: NIHON NOHYAKU CO., LTD.

DOMICILIO: 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo
103-8236 - JAPON

74. APODERADO: Dra. MARGARITA CASTELLANOS A.

22. BOGOTA, D.C.,

06 MAR. 2008

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-023840- -00000-0000

Fecha: 2008-03-06 13:03:10 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 175

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

12 Marzo 2008

SOLICITUD DE PATENTE EN COLOMBIA

①

☒ Patente de Invención.☐ Patente de Modelo de Utilidad.☒ Capítulo I☐ Capítulo II

②

SOLICITANTE (71)

Nombre: NIHON NOHYAKU CO., LTD.

Dirección: 2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 103-8236 - JAPON

Domicilio: Tokyo - JAPON

Lugar de Constitución: JAPON

Teléfono:

Fax:

E-mail:

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO (74)

Nombre: MARGARITA CASTELLANOS A.

Dirección: CALLE 94A No. 7A-09

Teléfono: 610 7420 Fax: 610 0706

E-mail: info@castellanosyco.com

IDENTIFICACIÓN

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

39'779.654

TPA

70,819

INVENTOR (ES) (72)

VER ANEXO # 1

⑤

PCT (86)

Solicitud Internacional No.

PCT/JP2006/316198

Fecha

11/08/2006

Publicación Internacional No.

WO 2007/020986

Fecha

22/02/2007

⑥

Título (54)

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

⑦

Clasificación Internacional (51)

⑧

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒NO ☐

JP

12/08/2005

234405/2005

JP

07/11/2005

322531/2005

JP

18/04/2006

114937/2006

⑨

Comprobante de pago No.

08-12,775

Fecha

Febrero 14 de 2008

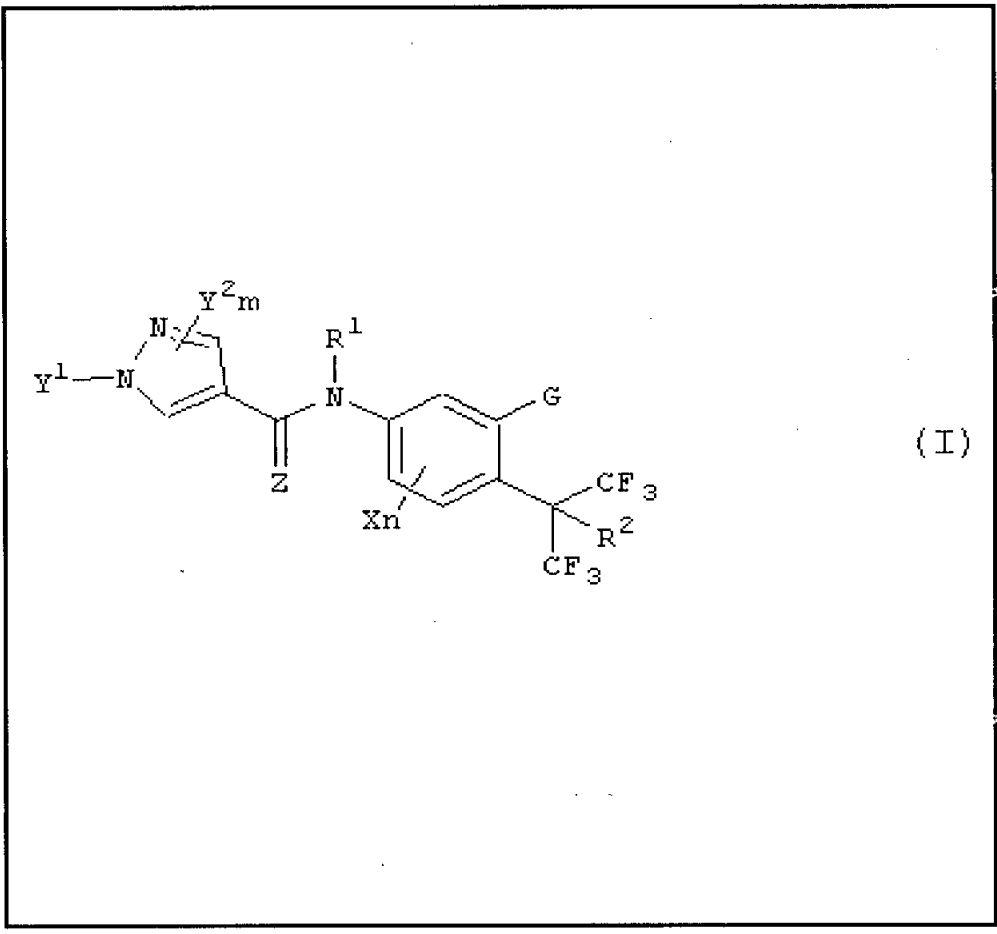
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página.

10

Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud.
- ☐ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
- ☐ Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
- ☐ Declaraciones.
- ☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos).
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA.
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☒ Otros **Tarjeta Propietario y Extracto para la Publicación**

11 FIGURA CARACTERISTICA:



12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO
FIRMA: *Margarita Castellanos*
C.C. No. 39'779.654 Usaquéen - TPA 70.819 C.S.J.

06 MAR. 2008

CASTELLANOS & CO LTDA

ABOGADOS
Calle 94 A No. 7 A-09
Bogotá, D.C. - COLOMBIA

ANEXO # 1

INVENTOR(ES) (72)

- 1 **TAKASHI FURUYA**
c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Research Center, 345 Oyamada-cho,
Kawachinagano-shi, Osaka 5860094
JAPON
- 2 **HIDEO KANNO**
c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Research Center, 345 Oyamada-cho,
Kawachinagano-shi, Osaka 5860094
JAPON
- 3 **KOZO MACHIYA**
10-6, Tamagawagakuen 7-chome,
Machida-shi, Tokyo 1940041
JAPON
- 4 **AKIYUKI SUWA**
c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Research Center, 345 Oyamada-cho,
Kawachinagano-shi, Osaka 5860094
JAPON
- 5 **NORIAKI YASOKAWA**
c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Research Center, 345 Oyamada-cho,
Kawachinagano-shi, Osaka 5860094
JAPON
- 6 **SHINSUKE FUJIOKA**
c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD.
Research Center, 345 Oyamada-cho,
Kawachinagano-shi, Osaka 5860094
JAPON

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 12,775
FECHA : FEBRERO 14 DE 2008

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-023840- -00000-0000

Fecha: 2008-03-06 13:03:10 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 175

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
VARO CASTELLANOS	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	1483368	13/02/2008	6,278,000.00

***** CONCEPTO *****

INT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	501,000.00
	TOTAL :	\$ 501,000.00

EN: QUINIENTOS UN MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2007年2月22日 (22.02.2007)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2007/020986 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 231/14 (2006.01) A01P 7/04 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01) C07C 211/52 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01) C07C 217/76 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01) C07D 231/16 (2006.01)

[JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野市小山田町3 4 5
日本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 藤岡 伸
祐 (FUJIOKA, Shinsuke) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河
内長野市小山田町3 4 5 日本農業株式会社総合研
究所内 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/316198

(22) 国際出願日: 2006年8月11日 (11.08.2006)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:

特願2005-234405 2005年8月12日 (12.08.2005) JP
特願2005-322531 2005年11月7日 (07.11.2005) JP
特願2006-114937 2006年4月18日 (18.04.2006) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日本農業
株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒
1038236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo
(JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 古谷 敬 (FU-
RUYA, Takashi) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長野
市小山田町3 4 5 日本農業株式会社総合研究所
内 Osaka (JP). 菅野 英夫 (KANNO, Hideo) [JP/JP];
〒5860094 大阪府河内長野市小山田町3 4 5 日
本農業株式会社総合研究所内 Osaka (JP). 町谷 幸
三 (MACHIYA, Kozo) [JP/JP]; 〒1940041 東京都町
田市玉川学園7丁目10-6 Tokyo (JP). 諏訪 明之
(SUWA, Akiyuki) [JP/JP]; 〒5860094 大阪府河内長
野市小山田町3 4 5 日本農業株式会社総合研
究所内 Osaka (JP). 八十川 伯朗 (YASOKAWA, Noriaki)

(74) 代理人: 高島 一 (TAKASHIMA, Hajime); 〒5410044
大阪府大阪市中央区伏見町四丁目1番1号 明治安
田生命大阪御堂筋ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護
が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG,
BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ,
LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK,
MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,
PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY,
TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA,
ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IL,
IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

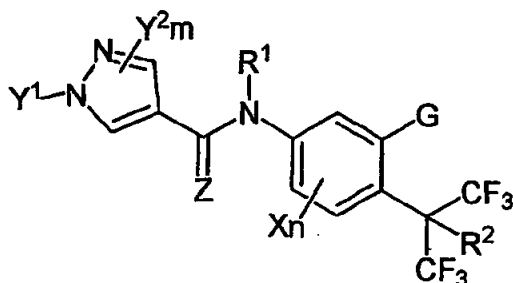
添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: SUBSTITUTED PYRAZOLECARBOXYLIC ACID ANILIDE DERIVATIVE OR SALT THEREOF, INTERMEDI-
ATE THEREOF, AGENT FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE, AND USE THEREOF

(54) 発明の名称: 置換ピラゾールカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類、その中間体及び農園芸用薬剤並びにそ
の使用方法



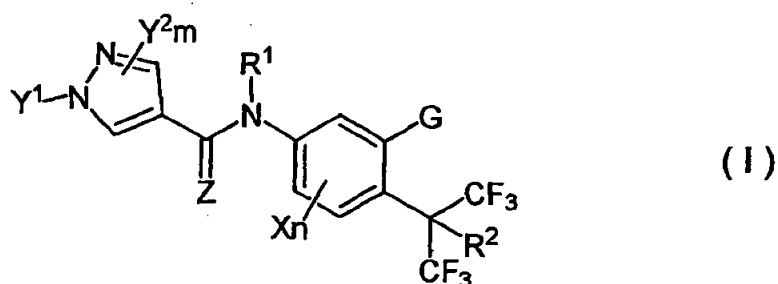
(I)

(57) Abstract: Disclosed is a substi-
tuted pyrazolecarboxylic acid anilide
derivative represented by the general
formula (I) below or a salt thereof,
which has excellent effects as a pesticide
or acaricide for agricultural and
horticultural use. (I) (In the formula, R¹
represents H, an alkyl, an alkylcarbonyl,
an alkenylcarbonyl, a cycloalkyl, a
phenylalkyl, a phenylcarbonyl or the
like; R² represents H, a halogen, an
alkyl, CN, OH, an alkoxy, a phenoxy, a
phenylthio, a phenylsulfonyl or the like; G represents an alkyl, an alkenyl, an alkynyl, a cycloalkyl, a C₃-C₁₀ cycloalkenyl or the like; Z represents O or S; X represents H, a halogen, CN, NO₂, an alkyl or the like; Y¹ represents H, an alkyl, an alkenyl, a phenyl,
an alkoxyalkyl or the like; Y² represents H, a halogen, CN, NO₂, OH, a mercapto, an amino, a carboxyl, a C₁-C₆ alkyl, a phenyl, a
phenoxy, a heterocyclic ring or the like; m represents 1 or 2; and n represents a number of 1-3.)

[続葉有]

(57) 要約:

一般式 (I)



{式中、 R^1 はH、アルキル、アルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、シクロアルキル、フェニルアルキル、フェニルカルボニル等； R^2 はH、ハロゲン、アルキル、CN、OH、アルコキシ、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルホニル等；Gはアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、 C_3 - C_{10} シクロアルケニル等；ZはO又はS；XはH、ハロゲン、CN、 NO_2 、アルキル等； Y^1 はH、アルキル、アルケニル、フェニル、アルコキシアルキル等； Y^2 はH、ハロゲン、CN、 NO_2 、OH、メルカプト、アミノ、カルボキシル、 C_1 - C_6 アルキル、フェニル、フェノキシ、複素環等、mは1又は2；nは1～3。}で表される置換ピラゾールカルボン酸アニリド誘導体又はその塩類は、農園芸用殺虫剤又は殺ダニ剤として優れた効果を示す。

DESCRIPTION

SUBSTITUTED PYRAZOLECARBOXYLIC ACID ANILIDE DERIVATIVE OR SALT
THEREOF, INTERMEDIATE THEREOF, AGENT FOR AGRICULTURAL AND
HORTICULTURAL USE, AND USE THEREOF

5

Technical Field

The present invention relates to substituted
pyrazolecarboxanilide derivatives or salts thereof,
intermediates thereof, and agrohorticultural agents,
particularly insecticides or acaricides, containing said
10 compounds as an active ingredient and method for use thereof.

Background Art

Conventionally, substituted pyrazolecarboxamide
derivatives similar to the present invention are known to be
useful as agrohorticultural insecticides, fungicides or
15 acaricides (e.g., JP-A-2003-48878, JP-A-2004-189738 and JP-A-
2004-269515). In JP-A-2003-48878, the substituted
pyrazolecarboxanilide derivatives are disclosed. However, the
substituents in the aniline moiety are mostly limited to the
2-position substituents, the 3-position substituent is methyl
20 group alone, and the compound described in the present
invention, wherein alkyl group having 2 or more carbon atoms
is introduced into the 3-position is not included even in its
compound list. Moreover, the 3-position methyl form concretely
disclosed therein does not show an acaricide activity. In JP-
25 A-2004-189738, substituted pyrazolecarboxanilide derivatives
are disclosed. However, the substituents in the aniline moiety
are limited to alkoxy group, alkylthio group and alkylamino
group, and the compound described in the present invention,
wherein alkyl group having 2 or more carbon atoms is directly
30 introduced into the 3-position is not included even in its
compound list. In JP-A-2004-269515, substituted
pyrazolecarboxamide derivatives are disclosed. However, only
an amide compound with heterocyclyl amine is disclosed, and
the substituted pyrazolecarboxanilide derivatives of the
35 present invention are not disclosed.

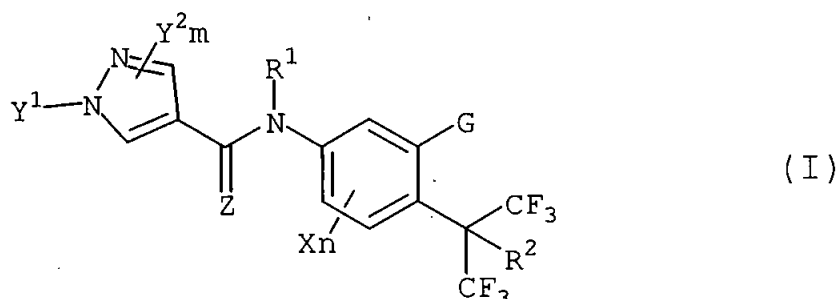
Disclosure of the Invention

In crop manufacturing in agricultural and horticultural
fields, damages caused by insect pests are still serious, and
development of novel agrohorticultural agents, particularly

development of insecticides and acaricides is desired due to generation of insect pests resistant to known agents, and the like. Since various labor saving farm works are required due to increasing numbers of the aged farm working population, 5 creation of agrohorticultural agents with properties suitable for such labor saving farm works, particularly insecticides and acaricides, is also demanded.

The present inventors have continued extensive studies on development of novel agrohorticultural agents, particularly 10 insecticides and acaricides and have found, as the result, that among broad range of compounds described in the aforementioned prior document, a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I), in which a pyrazole ring is selected as the heterocyclic 15 carboxylic acid moiety and a specific substituent is introduced into the aniline moiety at 3-position, showed excellent control effect as acaricides, not predicted at all from the content described in the aforementioned prior art references. Further, the inventors have found that an 20 intermediate of said compound, i.e. a substituted aniline derivatives represented by the formula (II), and 1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole-4-carboxylic acid or salt thereof were novel compounds unknown in prior references, and were useful as intermediates for manufacturing various derivatives 25 having physiological activities such as pharmaceuticals, pesticides and the like, and thus completed the present invention.

Accordingly, the present invention relates to substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by 30 the formula (I):



wherein

R¹ is 1a) a hydrogen atom, 2a) a C₁-C₈ alkyl group, 3a) a halo

C₁-C₆ alkyl group, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a halo
 C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 6a) a C₂-C₆ alkenylcarbonyl group,
 7a) a halo C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 8a) a C₁-C₆
 alkylcarbonyl C₁-C₆ alkyl group, 9a) a C₃-C₆ cycloalkyl group,
 5 10a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 11a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆
 alkyl group, 12a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group,
 13a) a C₂-C₆ alkenyl group, 14a) a halo C₂-C₆ alkenyl group,
 15a) a C₂-C₆ alkynyl group, 16a) a halo C₂-C₆ alkynyl group,
 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy
 10 C₁-C₆ alkyl group, 19a) a C₂-C₆ alkenyloxy C₁-C₆ alkyl group,
 20a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 21a) a C₁-C₆
 alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 22a) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆
 alkyl group, 23a) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 24a)
 a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 25a) a C₁-C₆
 15 alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 26a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl
 C₁-C₆ alkyl group, 27a) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl
 group, 28a) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the
 alkyl groups are the same or different, 29a) a phenyl C₁-C₆
 alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy
 20 C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or
 different substituents selected from a) a halogen atom, b) a
 cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a
 halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆
 alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆
 25 alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆
 alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo
 C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o)
 a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the
 same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 31a) a
 30 C₁-C₁₆ alkoxycarbonyl group, 32a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆
 alkoxycarbonyl group, 33a) a halo C₁-C₆ alkoxycarbonyl group,
 34a) a C₂-C₆ alkenyloxycarbonyl group, 35a) a C₁-C₆
 alkylthiocarbonyl group, 36a) a mono C₁-C₆ alkylaminocarbonyl
 group, 37a) a di C₁-C₆ alkylaminocarbonyl group wherein the
 35 alkyl groups are the same or different, 38a) a C₁-C₆
 alkoxycarbonyl C₁-C₆ alkyl group, 39a) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, 40a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 41a) a cyano C₁-C₆
 alkyl group, 42a) a phenyl C₁-C₆ alkyl group, 43a) a
 substituted phenyl C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one

or more, the same or different substituents selected from a) a
 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 5 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
 10 alkoxycarbonyl group, 44a) a phenylcarbonyl group, 45a) a
 substituted phenylcarbonyl group having, on the ring, one or
 more, the same or different substituents selected from a) a
 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 15 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 20 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
 alkoxycarbonyl group, 46a) a heterocyclylcarbonyl group, 47a)
 a substituted heterocyclylcarbonyl group having, on the ring,
 one or more, the same or different substituents selected from
 a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-
 25 C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 30 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
 alkoxycarbonyl group, 48a) a phenoxycarbonyl group, 49a) a
 substituted phenoxycarbonyl group having, on the ring, one or
 more, the same or different substituents selected from a) a
 35 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl

8

group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 50a) a phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 51a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 52a) a phenylsulfonyl group, 53a) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 54a) a di C₁-C₆ alkylphosphono group wherein the alkyl groups are the same or different, 55a) a di C₁-C₆ alkylphosphonothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 56a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxy carbonylaminothio group, 57a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxy carbonyl C₁-C₆ alkylaminothio group, 58a) a di C₁-C₆ alkylaminothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 59a) a C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 60a) a halo C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 61a) a C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 62a) a halo C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 63a) a phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 64a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano

group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 65a) a phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 66a) a substituted phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 67a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 68a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 69a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 70a) a phenoxy C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 71a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkoxycarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 72a) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 73a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, or 74a) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group; R² is 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen atom, 3b) a C₁-C₆ alkyl group, 4b) a halo C₁-C₆ alkyl group, 5b) a cyano group, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group, 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy

group, 9b) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 10b) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 11b) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 12b) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 13b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 14b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 15b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 16b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 17b) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group, 18b) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group wherein the alkyl groups are the same or different, 19b) a C₁-C₆ alkylthio group, 20b) a halo C₁-C₆ alkylthio group, 21b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 22b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 23b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 24b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 25b) an amino group, 26b) a mono C₁-C₆ alkylamino group, 27b) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, 28b) a phenoxy group, 29b) a substituted phenoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 30b) a phenylthio group, 31b) a substituted phenylthio group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 32b) a phenylsulfinyl group, 33b) a substituted phenylsulfinyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆

alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 34b) a phenylsulfonyl group, 35b) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 36b) a phenyl C₁-C₆ alkoxy group, or 37b) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group;

G is 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group, 2c) a halo C₂-C₁₀ alkyl group, 3c) a C₃-C₁₀ alkenyl group, 4c) a halo C₃-C₁₀ alkenyl group, 5c) a C₃-C₁₀ alkynyl group, 6c) a halo C₃-C₁₀ alkynyl group, 7c) a C₃-C₁₀ cycloalkyl group, 8c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 9c) a C₃-C₁₀ cycloalkenyl group, 10c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkenyl group having, on the ring, one or more, the same or different

substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 11c) a C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, or 12c) a halo C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group;

5 Z is an oxygen atom or a sulfur atom;

X may be the same or different and is 1d) a hydrogen atom, 2d) a halogen atom, 3d) a cyano group, 4d) a nitro group, 5d) a C₁-C₆ alkyl group, or 6d) a halo C₁-C₆ alkyl group;

Y¹ is 1e) a hydrogen atom, 2e) a C₁-C₆ alkyl group, 3e) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4e) a C₂-C₆ alkenyl group, 5e) a halo C₂-C₆ alkenyl group, 6e) a C₂-C₆ alkynyl group, 7e) a halo C₂-C₆ alkynyl group, 8e) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 9e) a hydroxy C₁-C₆ alkyl group, 10e) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 11e) a C₃-C₆ cycloalkyl group, 12e) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 13e) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 14e) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 15e) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 16e) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 17e) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 18e) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 19e) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 20e) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 21e) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 22e) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 23e) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group, 24e) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 25e) a phenyl group, 26e) a substituted phenyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group;

Y² may be the same or different and is 1f) a hydrogen atom, 2f) a halogen atom, 3f) a cyano group, 4f) a nitro group, 5f) a hydroxyl group, 6f) a mercapto group, 7f) an amino group, 8f) a carboxyl group, 9f) a C₁-C₆ alkyl group, 10f) a halo C₁-C₆

alkyl group, 11f) a C₂-C₆ alkenyl group, 12f) a halo C₂-C₆
 alkenyl group, 13f) a C₂-C₆ alkynyl group, 14f) a halo C₂-C₆
 alkynyl group, 15f) a tri C₁-C₆ alkylsilyl C₂-C₆ alkynyl group
 wherein the alkyl groups are the same or different, 16f) a
 5 phenyl C₂-C₆ alkynyl group, 17f) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-
 C₆ alkyl group, 18f) a hydroxy C₁-C₆ alkyl group, 19f) a C₁-C₆
 alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 20f) a C₃-C₆ cycloalkyl
 group, 21f) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 22f) a C₃-C₆
 cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 23f) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆
 10 alkyl group, 24f) a C₁-C₆ alkoxy group, 25f) a halo C₁-C₆ alkoxy
 group, 26f) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy group, 27f) a halo C₁-C₆
 alkoxy C₁-C₆ alkoxy group, 28f) a phenyl C₁-C₆ alkoxy group,
 29f) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30f) a halo C₁-C₆ alkoxy
 C₁-C₆ alkyl group, 31f) a C₁-C₆ alkylthio group, 32f) a halo C₁-
 15 C₆ alkylthio group, 33f) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 34f) a
 halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 35f) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group,
 36f) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 37f) a C₁-C₆ alkylthio
 C₁-C₆ alkyl group, 38f) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group,
 39f) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 40f) a halo C₁-C₆
 20 alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 41f) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆
 alkyl group, 42f) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group,
 43f) a mono C₁-C₆ alkylamino group, 44f) a di C₁-C₆ alkylamino
 group wherein the alkyl groups are the same or different, 45f)
 a phenylamino group, 46f) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl
 25 group, 47f) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the
 alkyl groups are the same or different, 48f) a phenyl group,
 49f) a substituted phenyl group having, on the ring, one or
 more, the same or different substituents selected from a) a
 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 30 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 35 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
 alkoxycarbonyl group, 50f) a phenoxy group, 51f) a substituted
 phenoxy group having, on the ring, one or more, the same or
 different substituents selected from a) a halogen atom, b) a

11

cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 52f) a heterocyclic group, or 53f) a substituted heterocyclic group

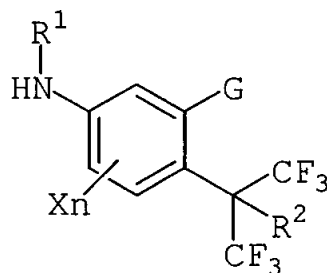
10 having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group;

20 m is 1 or 2; and

n is an integer of 1-3,

salts thereof and agrohorticultural agents containing the compound as an active ingredient, and methods of use thereof.

In addition, the present invention also relates to substituted aniline derivatives represented by the formula (II), which are intermediates therefor:



(II)

wherein

R¹ is 1a) a hydrogen atom, 2a) a C₁-C₈ alkyl group, 3a) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a halo C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 6a) a C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 7a) a halo C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 8a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkyl group, 9a) a C₃-C₆ cycloalkyl group, 10a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 11a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆

alkyl group, 12a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 13a) a C₂-C₆ alkenyl group, 14a) a halo C₂-C₆ alkenyl group, 15a) a C₂-C₆ alkynyl group, 16a) a halo C₂-C₆ alkynyl group, 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 19a) a C₂-C₆ alkenyloxy C₁-C₆ alkyl group, 20a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 21a) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 22a) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 23a) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 24a) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 25a) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 26a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 27a) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group, 28a) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 29a) a phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 31a) a C₁-C₁₆ alkoxycarbonyl group, 32a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 33a) a halo C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 34a) a C₂-C₆ alkenyloxy carbonyl group, 35a) a C₁-C₆ alkylthiocarbonyl group, 36a) a mono C₁-C₆ alkylaminocarbonyl group, 37a) a di C₁-C₆ alkylaminocarbonyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 38a) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl C₁-C₆ alkyl group, 39a) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 40a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 41a) a cyano C₁-C₆ alkyl group, 42a) a phenyl C₁-C₆ alkyl group, 43a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,

k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxy

5 alkoxy carbonyl group, 44a) a phenylcarbonyl group, 45a) a substituted phenylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy

10 group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the

15 alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxy carbonyl group, 46a) a heterocyclylcarbonyl group, 47a) a substituted heterocyclylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy

20 group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the

25 alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxy carbonyl group, 48a) a phenoxycarbonyl group, 49a) a substituted phenoxycarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a

30 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl

35 group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxy carbonyl group, 50a) a phenoxy C_1-C_6 alkylcarbonyl group, 51a) a substituted phenoxy C_1-C_6 alkylcarbonyl group having, on

the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 52a) a phenylsulfonyl group, 53a) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 54a) a di C₁-C₆ alkylphosphono group wherein the alkyl groups are the same or different, 55a) a di C₁-C₆ alkylphosphonothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 56a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxycarbonylaminothio group, 57a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxycarbonyl C₁-C₆ alkylaminothio group, 58a) a di C₁-C₆ alkylaminothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 59a) a C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 60a) a halo C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 61a) a C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 62a) a halo C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 63a) a phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 64a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo

C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 65a) a phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 66a) a substituted
5 phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
10 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
15 alkoxy carbonyl group, 67a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 68a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 69a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 70a) a phenoxy C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 71a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkoxy carbonyl group having, on the ring, one or
20 more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
25 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 72a) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl
30 group, 73a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, or 74a) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group;
R² is 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen atom, 3b) a C₁-C₆ alkyl group, 4b) a halo C₁-C₆ alkyl group, 5b) a cyano group, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group, 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy
35 group, 9b) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 10b) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 11b) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 12b) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 13b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 14b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 15b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-

C₃-alkoxy group, 16b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 17b) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group, 18b) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group wherein the alkyl groups are the same or different, 19b) a C₁-C₆ alkylthio group, 20b) a
 5 halo C₁-C₆ alkylthio group, 21b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 22b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 23b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 24b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 25b) an amino group, 26b) a mono C₁-C₆ alkylamino group, 27b) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same
 10 or different, 28b) a phenoxy group, 29b) a substituted phenoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h)
 15 a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or
 20 different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 30b) a phenylthio group, 31b) a substituted phenylthio group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a
 25 C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group
 30 wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 32b) a phenylsulfinyl group, 33b) a substituted phenylsulfinyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 35 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆

- alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 34b) a phenylsulfonyl group, 35b) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 36b) a phenyl C₁-C₆ alkoxy group, or 37b) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group;
- G is 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group, 2c) a halo C₂-C₁₀ alkyl group, 3c) a C₃-C₁₀ alkenyl group, 4c) a halo C₃-C₁₀ alkenyl group, 5c) a C₃-C₁₀ alkynyl group, 6c) a halo C₃-C₁₀ alkynyl group, 7c) a C₃-C₁₀ cycloalkyl group, 8c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 9c) a C₃-C₁₀ cycloalkenyl group, 10c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkenyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 11c) a C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, or 12c) a halo C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group;
- X may be the same or different and is 1d) a hydrogen atom, 2d)

a halogen atom, 3d) a cyano group, 4d) a nitro group, 5d) a C₁-C₆ alkyl group, or 6d) a halo C₁-C₆ alkyl group;
n is an integer of 1-3,
salts thereof and 1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole-4-
5 carboxylic acid and a salt thereof.

Best Mode for Embodying the Invention

In the definitions of a substituted pyrazolecarboxanilide derivative of the formula (I) and a substituted aniline derivative of the formula (II) of the present invention,
10 "halo", "C₁-C₆ alkyl", "C₁-C₆ alkoxy", "C₂-C₆ alkenyl", "C₂-C₆ alkynyl" or "a heterocyclic group", and the like in each of substituents has the following meaning.

The "halo" or "halogen atom" means a chlorine atom, a bromine atom, an iodine atom or a fluorine atom.

15 The "C₁-C₆ alkyl" is linear or branched chain alkyl having 1 to 6 carbon atoms, such as methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, s-butyl, t-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, t-pentyl, 2-methylbutyl, 1-ethylpropyl, n-hexyl, 2-ethylbutyl and the like.

20 The "C₁-C₈ alkyl" is linear or branched chain alkyl having 1 to 8 carbon atoms, such as methyl, ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, s-butyl, t-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, t-pentyl, 2-methylbutyl, 1-ethylpropyl, n-hexyl, 2-ethylbutyl, n-heptyl, n-octyl, 2-ethylhexyl and the
25 like.

The "C₂-C₁₀ alkyl" is linear or branched chain alkyl having 2 to 10 carbon atoms, such as ethyl, n-propyl, i-propyl, n-butyl, i-butyl, s-butyl, t-butyl, n-pentyl, isopentyl, neopentyl, t-pentyl, 2-methylbutyl, n-hexyl, 2-ethylbutyl, 1-
30 ethylpropyl, n-heptyl, n-octyl, 2-ethylhexyl, n-nonyl, n-decyl and the like.

The "C₃-C₆ cycloalkyl" is cyclic alkyl having 3 to 6 carbon atoms, such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl and the like.

35 The "C₃-C₈ cycloalkyl" is cyclic alkyl having 3 to 8 carbon atoms, such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl, cyclohexyl, cyclooctyl and the like.

The "C₃-C₁₀ cycloalkyl" is cyclic alkyl having 3 to 10 carbon atoms, such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl,

cyclohexyl, cyclooctyl, cyclodecyl and the like.

The "C₃-C₁₀ cycloalkenyl" is cyclic alkenyl having 3 to 10 carbon atoms, such as cyclopropenyl, cyclobutenyl, cyclopentenyl, cyclohexenyl, cyclooctenyl, cyclodecenyl and
5 the like.

The "C₁-C₃ alkoxy" is alkoxy wherein its alkyl moiety is linear or branched chain alkyl having 1 to 3 carbon atoms, such as methoxy, ethoxy, propoxy, isopropoxy and the like.

The "C₁-C₆ alkoxy" is alkoxy wherein its alkyl moiety is
10 the above-mentioned "C₁-C₆ alkyl", such as methoxy, ethoxy, n-propoxy, i-propoxy, n-butoxy, isobutoxy, s-butoxy, t-butoxy, n-pentyloxy, isopentyloxy, neopentyloxy, t-pentyloxy, 2-methylbutoxy, 1-ethylpropoxy, hexyloxy, 2-ethylbutoxy and the like.

15 The "C₁-C₁₀ alkoxy" is alkoxy wherein its alkyl moiety is linear or branched chain alkyl having 1 to 10 carbon atoms, such as methoxy, ethoxy, n-propoxy, i-propoxy, n-butoxy, isobutoxy, s-butoxy, t-butoxy, n-pentyloxy, isopentyloxy, neopentyloxy, t-pentyloxy, 2-methylbutoxy, 1-ethylpropoxy,
20 hexyloxy, 2-ethylbutoxy, n-heptyloxy, n-octyloxy, 2-ethylhexyloxy, n-nonyloxy, n-decyloxy and the like.

The "C₁-C₁₆ alkoxy" is alkoxy wherein its alkyl moiety is linear or branched chain alkyl having 1 to 16 carbon atoms, such as methoxy, ethoxy, n-propoxy, i-propoxy, n-butoxy,
25 isobutoxy, s-butoxy, t-butoxy, n-pentyloxy, isopentyloxy, neopentyloxy, t-pentyloxy, 2-methylbutoxy, 1-ethylpropoxy, hexyloxy, 2-ethylbutoxy, n-heptyloxy, n-octyloxy, 2-ethylhexyloxy, n-nonyloxy, n-decyloxy, n-undecyloxy, n-dodecyloxy, n-tridecyloxy, n-tetradecyloxy, n-pentadecyloxy,
30 n-hexadecyloxy and the like.

The "C₂-C₆ alkenyl" is linear or branched chain alkenyl having 2 to 6 carbon atoms, which has at least one double bond, such as vinyl, 1-propenyl, allyl, 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 2-pentenyl, 2-methyl-1-propenyl, 2,4-pentadienyl, 3-
35 hexenyl and the like.

The "C₃-C₁₀ alkenyl" is linear or branched chain alkenyl having 3 to 10 carbon atoms, which has at least one double bond, such as 1-butenyl, 2-butenyl, 3-butenyl, 2-pentenyl, 2,4-pentadienyl, 3-hexenyl, 3-heptenyl, 3-octenyl, 3-nonenyl,

3-decenyl and the like.

The "C₂-C₆ alkynyl" is linear or branched chain alkynyl having 2 to 6 carbon atoms, which has at least one triple bond, such as ethynyl, 2-propynyl, 1-butyne, 2-butyne, 3-butyne, 5 2-pentyne, 3-hexyne and the like.

The "C₃-C₁₀ alkynyl" is linear or branched chain alkynyl having 3 to 10 carbon atoms, which has at least one triple bond, such as 1-butyne, 2-butyne, 3-butyne, 2-pentyne, 3-hexyne, 3-heptyne, 3-octyne, 3-nonyne, 3-decynyl and the 10 like.

The numbers in "C₂-C₆", "C₃-C₁₀" and the like shows the range of carbon atom numbers such as 2 to 6 carbon atoms and 3 to 10 carbon atoms.

Moreover, the above-mentioned definitions can apply to 15 groups wherein the above-mentioned substituents are connected. For example, "halo C₁-C₆ alkyl" means linear or branched chain alkyl group having 1 to 6 carbon atoms, which is substituted by the same or different one or more halogen atoms, such as chloromethyl, 2-chloroethyl, 2,2,2-trichloroethyl, 3- 20 chloropropyl, 2-chloro-1,1-dimethylethyl, 1-bromo-1-methylethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, 2,2,2-trifluoroethyl, perfluorohexyl and the like.

"A heterocyclic group" and "A heterocyclyl" are 5- or 6-membered heterocyclic groups having one or more hetero atoms 25 selected from an oxygen atom, a sulfur atom and a nitrogen atom including, for example, pyridyl group, pyridine-N-oxide group, pyrimidinyl group, furyl group, tetrahydrofuryl group, thienyl group, tetrahydrothienyl group, tetrahydropyranyl group, tetrahydrothiopyranyl group, oxazolyl group, isoxazolyl 30 group, oxadiazolyl group, thiazolyl group, isothiazolyl group, thiadiazolyl group, imidazolyl group, triazolyl group and pyrazolyl group.

A salt of a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) of the present invention 35 includes a salt of an alkali metal (lithium, sodium, potassium, etc.); a salt of an alkaline earth metal (calcium, magnesium, etc.); an ammonium salt; and a salt of an organic amine (methylamine, triethylamine, diethanolamine, piperidine, pyridine, etc.), or an acid addition salt. The acid addition

salt includes, for example, a carboxylate such as acetate, propionate, oxalate, trifluoroacetate, benzoate and the like; a sulfonate such as methanesulfonate, trifluoromethanesulfonate, p-toluenesulfonate and the like; an
 5 inorganic acid salt such as a hydrochloride, a sulfate, a nitrate, a carbonate and the like.

In the substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by the formula (I) of the present invention, R^1 is preferably 1a) a hydrogen atom, 2a) a C_1-C_6 alkyl group, 3a) a
 10 halo C_1-C_6 alkyl group, 4a) a C_1-C_6 alkylcarbonyl group, 5a) a halo C_1-C_6 alkylcarbonyl group, 6a) a C_2-C_6 alkenylcarbonyl group, 13a) a C_2-C_6 alkenyl group, 17a) a C_1-C_{10} alkoxy C_1-C_6 alkyl group, 18a) a halo C_1-C_6 alkoxy C_1-C_6 alkyl group, 19a) a C_2-C_6 alkenyloxy C_1-C_6 alkyl group, 20a) a C_1-C_6 alkoxy C_1-C_6
 15 alkoxy C_1-C_6 alkyl group, 29a) a phenyl C_1-C_6 alkoxy C_1-C_6 alkyl group, 30a) a substituted phenyl C_1-C_6 alkoxy C_1-C_6 alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl
 20 group, f) a C_1-C_6 alkoxy group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6
 25 alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 31a) a C_1-C_{16} alkoxycarbonyl group, 32a) a C_1-C_6 alkoxy C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 33a) a halo C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 34a) a C_2-C_6 alkenyloxycarbonyl group, 35a) a C_1-C_6 alkylthiocarbonyl group,
 30 42a) a phenyl C_1-C_6 alkyl group, 43a) a substituted phenyl C_1-C_6 alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy group, g) a halo C_1-C_6
 35 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the alkyl groups are the

same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 44a) a phenyl carbonyl group, 45a) a substituted phenyl carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 46a) a heterocyclyl carbonyl group, 47a) a substituted heterocyclyl carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 48a) a phenoxy carbonyl group, 49a) a substituted phenoxy carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 50a) a phenoxy C₁-C₆ alkyl carbonyl group, 51a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkyl carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆

alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 52a) a phenylsulfonyl group, 53a) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 58a) a di C₁-C₆ alkylaminothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 59a) a C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 61a) a C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 63a) a phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 64a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 65a) a phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 66a) a substituted phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl

group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 68a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl carbonyl group, 73a) a C₁-C₆ alkyl carbonyl C₁-C₆ alkyl carbonyl group, or 74a) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl C₁-C₆ alkyl carbonyl group, and more preferably 1a) a hydrogen atom, 4a) a C₁-C₆ alkyl carbonyl group, 5a) a halo C₁-C₆ alkyl carbonyl group, 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a C₁-C₁₆ alkoxy carbonyl group, 32a) a halo C₁-C₆ alkoxy carbonyl group or 64a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl carbonyl group.

R² is preferably 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen atom, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group or 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy group, and more preferably 1b) a hydrogen atom or 7b) a C₁-C₆ alkoxy group.

G is preferably 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group, 3c) a C₃-C₁₀ alkenyl group, or 11c) a C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, and more preferably 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group.

X is preferably 1d) a hydrogen atom, 2d) a halogen atom, or 5d) a C₁-C₆ alkyl group, and more preferably 1d) a hydrogen atom.

Z is preferably an oxygen atom.

Y¹ is preferably 2e) a C₁-C₆ alkyl group, 3e) a halo C₁-C₆ alkyl group, or 4e) a C₂-C₆ alkenyl group, and more preferably 2e) a C₁-C₆ alkyl group.

Y² is preferably 1f) a hydrogen atom, 2f) a halogen atom, 9f) a C₁-C₆ alkyl group, 10f) a halo C₁-C₆ alkyl group, or 31f) a C₁-C₆ alkylthio group, and more preferably 1f) a hydrogen atom, 2f) a halogen atom, 9f) a C₁-C₆ alkyl group, or 10f) a halo C₁-C₆ alkyl group.

m is preferably 2.

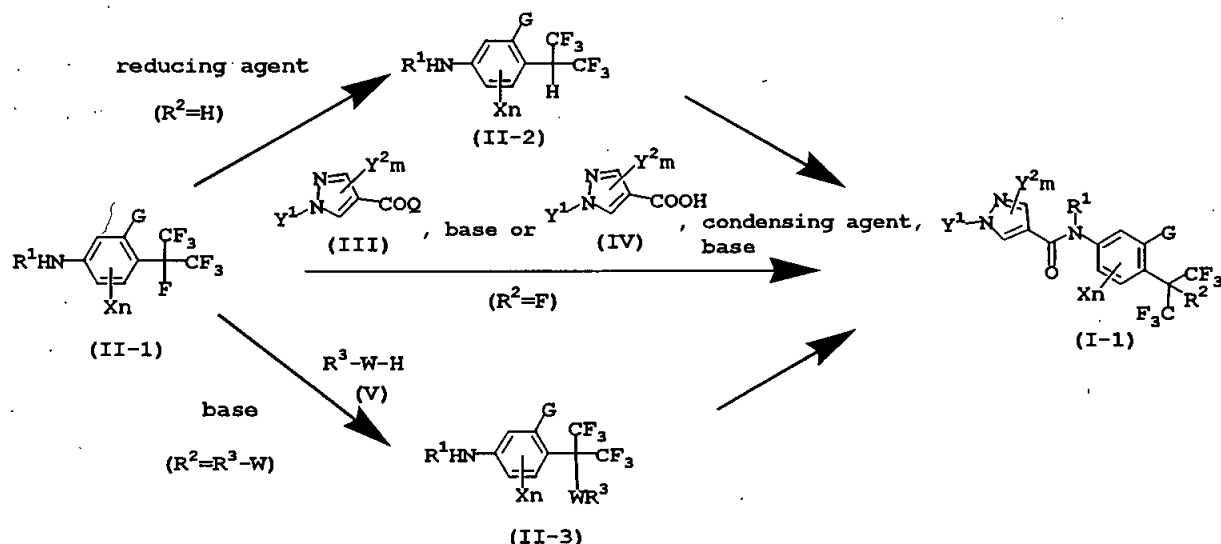
In addition, a salt of a substituted aniline derivative represented by the formula (II) is preferably an acid addition salt including, for example, a carboxylate such as acetate, propionate, oxalate, trifluoroacetate, benzoate and the like; a sulfonate such as methanesulfonate, trifluoromethanesulfonate, p-toluenesulfonate and the like; an inorganic acid salt such as a hydrochloride, a sulfate, a nitrate, a carbonate and the like.

A salt of 1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole-4-carboxylic acid of the present invention includes a salt of an alkali metal (lithium, sodium, potassium, etc.); a salt of an alkaline earth metal (calcium, magnesium, etc.); an ammonium
5 salt; and a salt of an organic amine (methylanine, triethylamine, diethanolamine, piperidine, pyridine, etc.).

A substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) or an intermediate thereof, i.e. a substituted aniline derivative represented by the formula
10 (II), of the present invention may contain one or plural numbers of asymmetric centers in the structural formula, and further two or more optical isomers and diastereomers may be present. Consequently, the present invention entirely encompasses each optical isomer and the mixtures with any
15 ratio thereof. In addition, a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) of the present invention may have two types of geometric isomers derived from a C-C double bond in the structural formula. The present invention encompasses all of geometric
20 isomers and the mixtures containing them in any ratio. Moreover, the present invention encompasses hydrates thereof.

Representative production methods for a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) and a substituted aniline derivative represented by the
25 formula (II), as an intermediate thereof are illustrated hereinbelow, but the present invention should not be construed as limiting thereto.

Production method 1



(wherein G , R^1 , X , n , Y^1 , Y^2 and m are as defined above; and R^3 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl group, a halo C_1 - C_6 alkyl group, a phenyl group, a substituted phenyl group or a phenyl C_1 - C_4 alkyl group; W is $-O-$, $-S-$ or $-N(R^4)-$, wherein R^4 is a hydrogen atom, a C_1 - C_6 alkyl group, a halo C_1 - C_6 alkyl group, a phenyl group, a substituted phenyl group or a phenyl C_1 - C_4 alkyl group; and Q is a halogen atom or a C_1 - C_6 alkoxyl group).

Among a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I), a substituted pyrazolecarboxanilide derivative (I-1) wherein Z is O , and R^2 is a hydrogen atom, a fluorine atom or WR^3 wherein W and R^3 are as defined above can be produced by reacting an aniline derivative represented by the formulas (II-1) to (II-3) with a pyrazolecarboxylic halide or a pyrazolecarboxylate ester represented by the formula (III) in the presence or absence of a base in an inert solvent, or by reacting an aniline derivative represented by the formulas (II-1) to (II-3) with a pyrazolecarboxylic acid represented by the formula (IV) in the presence of a condensing agent, in the presence or absence of a base, in an inert solvent, and any usual production methods for amides may be applicable.

An aniline derivative represented by the formula (II-2) can be produced by reducing an aniline derivative represented by the formula (II-1) in the presence of a reducing agent, in an inert solvent.

An aniline derivative represented by the formula (II-3)

can be produced by reacting an aniline derivative represented by the formula (II-1) with an alcohol derivative, a thiol derivative or an amine derivative represented by the formula (V), in the presence or absence of a base in an inert solvent.

5

The formula (II-1) → the formula (II-2)

An example of a reducing agent, to be used in the present reaction includes metal hydrides such as lithium aluminum hydride, lithium borohydride, sodium borohydride, diisobutyl
10 aluminum hydride, sodium bis(2-methoxyethoxy)aluminum hydride and the like, metal such as lithium and the like or metal salts, and the like. The amount of the reducing agent to be used may be selected, as appropriate, in the range from equivalent to excess amount relative to an aniline derivative
15 represented by the formula (II-1).

An example of an inert solvent to be used in the present reaction, which may be any one as long as it does not significantly inhibit progress of the present reaction, includes aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene,
20 xylene and the like; halogenated hydrocarbons such as methylene chloride, chloroform, carbon tetrachloride and the like; halogenated aromatic hydrocarbons such as chlorobenzene, dichlorobenzene and the like; straight chain or cyclic ethers such as diethyl ether, dioxane, tetrahydrofuran and the like,
25 or dimethylsulfoxide and the like and these inert solvents can be used alone or in combination of two or more kinds.

Reaction temperature may be in the range from room temperature to boiling temperature of an inert solvent to be used and reaction time may be in the range from several
30 minutes to 50 hours, while depending on reaction scale and reaction temperature.

After completion of the reaction, desired compound may be isolated from the reaction mixture by a conventional method and the desired compound can be produced by purification using
35 recrystallization or column chromatography, etc, if necessary. The desired compound may also be subjected to subsequent reaction step without isolation from the reaction mixture.

The formula (II-1) → the formula (II-3)

An example of a base to be used in the present reaction includes metal hydrides such as lithium hydride, sodium hydride, potassium hydride and the like; metal alcoholates
5 such as sodium methoxide, sodium ethoxide, potassium tert-butoxide and the like; and alkyl metals such as n-butyl lithium, sec-butyl lithium, tert-butyl lithium and the like. The amount of the base to be used may be selected, as appropriate, in the range from equivalent to excess amount
10 relative to an aniline derivative represented by the formula (II-1).

As an example of an inert solvent to be used in the present reaction, which may be any one as long as it does not significantly inhibit progress of the present reaction,
15 includes aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene, xylene and the like; alcohols such as methanol, ethanol and the like; straight chain or cyclic ethers such as diethyl ether, 1,2-dimethoxyethane, dioxane, tetrahydrofuran and the like, and the like and these inert solvents can be used alone
20 or in combination of two or more kinds.

Reaction temperature may be in the range from -70°C to boiling temperature of an inert solvent to be used and reaction time may be in the range from several minutes to 50 hours, while depending on reaction scale and reaction
25 temperature.

After completion of the reaction, desired compound may be isolated from the reaction mixture by a conventional method and the desired compound can be produced by purification using recrystallization or column chromatography, etc, if necessary.
30 The desired compound may also be subjected to subsequent reaction step without isolation from the reaction mixture.

The formula (II-1), (II-2) or (II-3) → the formula (I-1)

An example of a condensing agent to be used in the present reaction includes diethyl cyanophosphate (DEPC),
35 carbonyldiimidazole (CDI), 1,3-dicyclohexylcarbodiimide (DCC), chloroformates, 2-chloro-1-methylpyridinium iodide and the like.

As a base to be used in the present reaction, an inorganic base or an organic base is included and an example

of an inorganic base includes alkali metal hydroxides such as sodium hydroxide, potassium hydroxide and the like; alkali metal hydrides such as sodium hydride, potassium hydride and the like; alkali metal salts of alcohol such as sodium
5 ethoxide, potassium tert-butoxide and the like; carbonates such as sodium carbonate, potassium carbonate, sodium hydrogen carbonate and the like; and an example of organic bases includes triethylamine, pyridine, DBU and the like. The amount of the base to be used may be selected in the range from
10 equivalent to excess amount relative to a pyrazolecarboxylic acid derivative represented by the formula (III) or (IV).

An example of an inert solvent to be used in the present reaction, which may be any one as long as it does not significantly inhibit progress of the present reaction,
15 includes aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene, xylene and the like; halogenated hydrocarbons such as methylene chloride, chloroform, carbon tetrachloride and the like; halogenated aromatic hydrocarbons such as chlorobenzene, dichlorobenzene and the like; straight chain or cyclic ethers
20 such as diethyl ether, dioxane, tetrahydrofuran and the like; esters such as ethyl acetate and the like; amides such as dimethylformamide, dimethylacetamide and the like; dimethylsulfoxide; 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone; acetone, methyl ethyl ketone and the like. These inert solvents can be
25 used alone or in combination of two or more kinds.

As the present reaction is an equimolar reaction, each reactant may be used in equal mole, however, any of the reactants may also be used in excess. Reaction temperature may be in the range from room temperature to boiling temperature
30 of an inert solvent to be used and reaction time may be in the range from several minutes to 48 hours, while depending on reaction scale and reaction temperature.

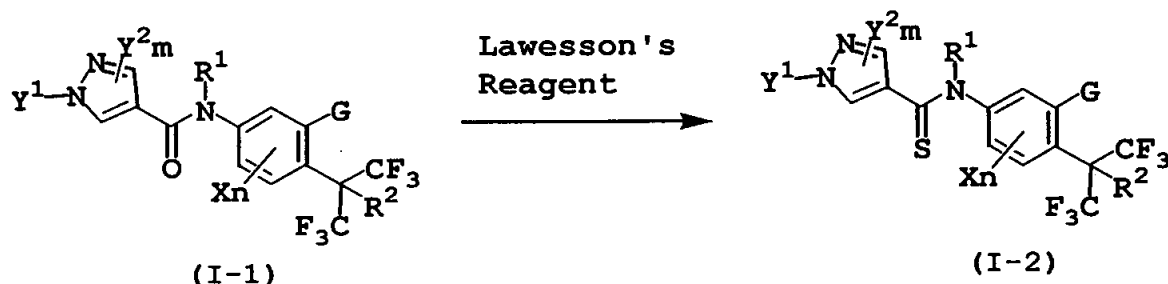
After completion of the reaction, desired compound may be isolated from the reaction mixture by a conventional method
35 and the desired compound can be produced by purification using recrystallization or column chromatography, etc, if necessary.

An aniline derivative represented by the formula (II-1), as a raw material of the present reaction, can be produced in accordance with a production method disclosed in JP-A-11-

302233, JP-A-2001-122836 or JP-A-2006-8675.

A pyrazolecarboxylic acid derivative represented by the formulas (III) or (IV) can be produced in accordance with several methods described in known literatures (for example, Aust. J. Chem., 1983, 36, 135-147, Synthesis, 1986, 753-755, JP-A-52-87168, JP-A-63-45264, JP-A-1-106866 and the like).

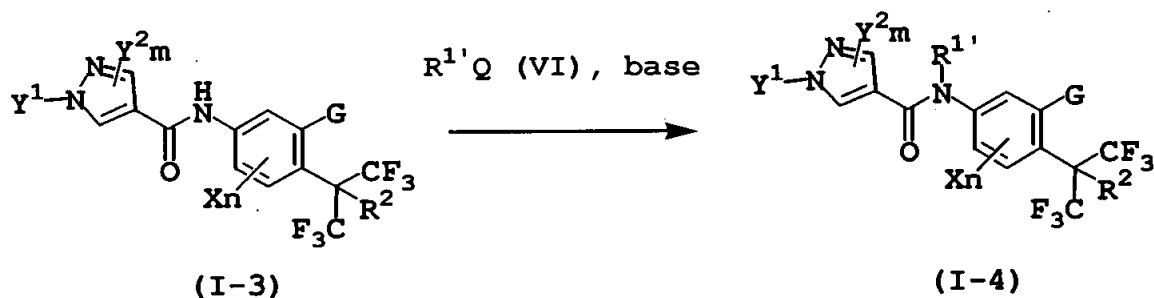
Production method 2



(wherein G, R¹, R², X, n, Y¹, Y² and m are as defined above).

Among substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by the formula (I), a substituted pyrazolecarboxanilide derivative (I-2) wherein Z is S can be produced by reacting an anilide derivative represented by (I-1) with Lawesson's Reagent in accordance with a known method (Tetrahedron Lett., 21 (42), 4061 (1980)).

Production method 3



(wherein G, R², X, n, Y¹, Y², m and Q are as defined above and R^{1'} is as defined above except a hydrogen atom).

Among substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by the formula (I), a substituted pyrazolecarboxanilide derivative (I-4) wherein R¹ is other than a hydrogen atom can be produced by reacting an amide derivative represented by the formula (I-3) with a halide derivative or an ester derivative represented by the formula (VI), in the presence or absence of a base, in an inert

solvent.

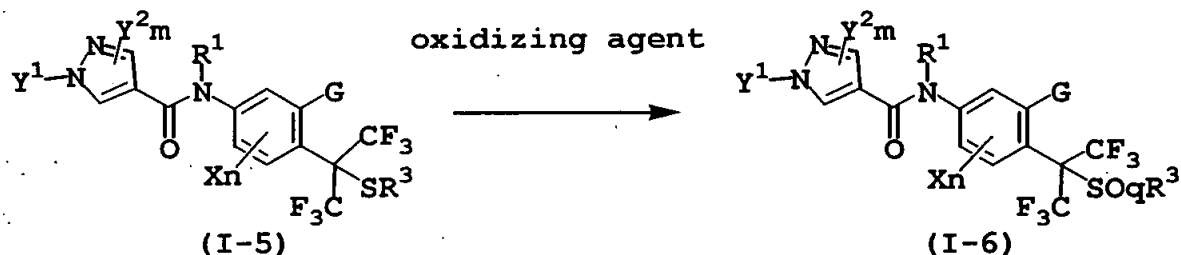
As an example of a base to be used in the present reaction includes metal hydroxides such as sodium hydroxide, potassium hydroxide and the like; carbonates such as sodium carbonate, potassium carbonate, sodium hydrogen carbonate and the like; metal hydrides such as lithium hydride, sodium hydride, potassium hydride and the like; metal alcoholates such as sodium methoxide, sodium ethoxide, potassium tert-butoxide and the like; alkyl metals such as n-butyl lithium, sec-butyl lithium, tert-butyl lithium and the like. The amount of the base to be used may be selected, as appropriate, in the range from equivalent to excess amount relative to an amide derivative represented by the formula (I-3).

An example of an inert solvent to be used in the present reaction, which may be any one as long as it does not significantly inhibit progress of the present reaction, includes aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene, xylene and the like; alcohols such as methanol, ethanol and the like; straight chain or cyclic ethers such as diethyl ether, 1,2-dimethoxyethane, dioxane, tetrahydrofuran and the like; amides such as dimethylformamide, dimethylacetamide and the like; dimethylsulfoxide; 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone and the like. These inert solvents can be used alone or in combination of two or more kinds.

Reaction temperature may be in the range from -70°C to boiling temperature of an inert solvent to be used and reaction time may be in the range from several minutes to 50 hours, while depending on reaction scale and reaction temperature.

After completion of the reaction, desired compound may be isolated from the reaction mixture by a conventional method and the desired compound can be produced by purification using recrystallization or column chromatography, etc, if necessary.

Production method 4.



(wherein G, R¹, R³, X, n, Y¹, Y² and m are as defined above, and q is 1 or 2).

A substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by the formula (I-6) can be produced by reacting a sulfide derivative represented by the formula (I-5) which can be produced in Production method 1 with an oxidizing agent in the presence of an inert solvent

An example of an inert solvent to be used in the present reaction includes halogenated hydrocarbons such as methylene chloride, chloroform and the like; aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene and the like; halogenated aromatic hydrocarbons such as fluorobenzene, chlorobenzene, dichlorobenzene and the like; acids such as acetic acid and the like; alcohols such as methanol, ethanol, propanol and the like.

An example of an oxidizing agent includes m-peroxychlorobenzoic acid, peracetic acid, potassium metaperiodate, potassium hydrogen persulphate (Oxone), hydrogen peroxide and the like. The amount of the oxidizing agent to be used may be selected, as appropriate, in the range of 0.5 to 3 equivalents relative to a sulfide derivative represented by the formula (I-5).

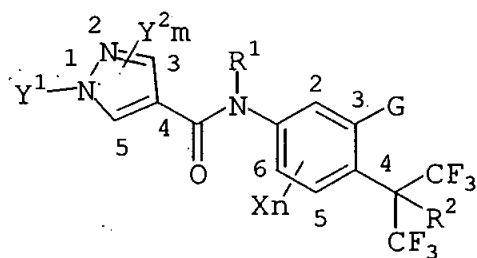
Reaction temperature may be in the range from -50°C to boiling temperature of an inert solvent to be used and reaction time may be in the range from several minutes to 24 hours, while depending on reaction scale and reaction temperature.

After completion of the reaction, desired compound may be isolated from the reaction mixture by a conventional method and the desired compound can be produced by purification using recrystallization or column chromatography, etc, if necessary.

Typical compounds of substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by the formula (I) are exemplified in Table 1 and Table 2, and typical compounds of substituted aniline derivatives represented by the formula (II) are
5 exemplified in Table 3, and a substituted pyrazolecarboxylic acid derivative represented by the formula (IV) is exemplified in Table 4, however, the present invention should not be construed as limiting to these.

In "property" column of Table 1 and Table 2, melting
10 point ($^{\circ}\text{C}$) or refractive index ($n_D(^{\circ}\text{C})$) is shown and for compounds described as amorphous or paste, $^1\text{H-NMR}$ data thereof were shown in Table 5. In the Tables, "n-" is normal, and "i-" is iso, "t-" is tertiary, "c-" is cyclo, "Me" is a methyl group, "Et" is an ethyl group, "Pr" is a propyl group, "Bu" is
15 a butyl group, "Pen" is a pentyl group, "Hex" is a hexyl group, "Ph" is a phenyl group, "Bn" is a benzyl group, "Ac" is an acetyl group and "Pyr" is a pyrazinyl group.

Formula (I-4)



(I-4)

Table 1 ($Xn=H$)

No.	G	Y^1	Y^2_m	R^1	R^2	Property
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)

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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)

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	
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	
1-95	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	83-85
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	
1-101	i-Bu	Me	3-Me	H	H	141-144
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	amorphous
1-107	i-Bu	Me	3-Me	CO (4-NO ₂ -Ph)	OMe	amorphous
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

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	amorphous
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	amorphous
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	H	143.1-148.8
1-127	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COPh	H	51.3-65.3
1-128	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃	H	1.4859 (22.0)
1-129	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OEt	H	1.4882 (23.8)
1-130	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O (CH ₂) ₇ Me	H	1.4854 (22.0)
1-131	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O (CH ₂) ₂ OMe	H	1.4889 (21.9)
1-132	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OBn	H	1.5212 (21.9)
1-133	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	H	121.1-124.8
1-134	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃	H	143.1-145.6
1-135	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO (CH ₂) ₂ CH ₂ Cl	H	117.1-121.4
1-136	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Bu	H	122.2-138.0
1-137	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-t-Bu	H	39.2
1-138	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO (CH ₂) ₂ OMe	H	1.4750 (23.5)
1-139	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO (CH ₂) ₁₅ Me	H	90.5-92.1

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	amorphous
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	paste
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	

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
1-169	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COO-i-Pr	OEt	
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	165-166
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)

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	
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	174-176
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	

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	158-160
1-261	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	
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	143-144
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	
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	67-70
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	
1-272	CH ₂ CHEt ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	152-153
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	166-167
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	152-153
1-281	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
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

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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)

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	amorphous
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

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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 COOEt	OMe	100-101
1-343	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=CH 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 OMe	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=CH 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)

Table 1 (continued)

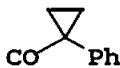
No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
1-364	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	108
1-365	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCMe ₂ Et	OMe	1.4983 (20.5)
1-366	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1.4958 (21.6)
1-367	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	1.4991 (21.8)
1-368	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1.4977 (30.5)
1-369	Et	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1.4934 (25.2)
1-370	Et	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OPh	OMe	amorphous
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

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	paste
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	paste
1-415	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	n-Pr	OMe	paste

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	paste
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	paste
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	paste
1-422	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	paste
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	paste
1-425	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O-s-Bu	OMe	paste
1-426	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	OMe	paste
1-427	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	OMe	paste
1-428	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me	OMe	paste
1-429	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	paste
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)

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	amorphous
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	amorphous
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	COCH ₂ Et 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 CF 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	CH ₂ CHMeEt	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4929 (20.1)
1-468	CH ₂ CHMeEt	Me	3, 5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1.4910 (20.0)

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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 CHMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	1.4960 (20.5)
1-473	CH ₂ CH ₂ CHMe 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	COCHMeCOEt	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

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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 CF ₃	3, 5-Me ₂	COEt	OMe	137-138
1-508	i-Bu	CH ₂ CF 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	paste
1-515	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	paste
1-516	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	COOMe	OMe	amorphous
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	paste
1-519	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	paste
1-520	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	H	178-183
1-521	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	COOMe	OMe	paste
1-522	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	OMe	amorphous

Table 1 (continued)

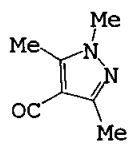
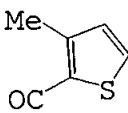
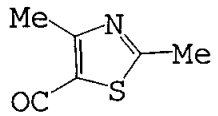
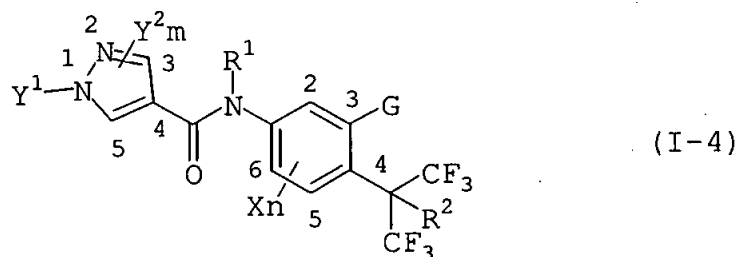
No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
1-523	i-Bu	Me	3-I-5-Me	COOMe	OMe	paste
1-524	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CO-i-Pr	OMe	paste
1-525	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ OEt	OMe	100-103
1-526	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	100-102
1-527	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CMe ₂	OMe	81-83
1-528	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-529	i-Bu	Me	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	paste
1-540	i-Bu	Me	3-Br	CO-i-Pr	OMe	paste
1-541	i-Bu	Me	3-Cl	CO-i-Pr	OMe	paste
1-542	i-Bu	Me	3-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	paste
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	amorphous
1-545	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂		F	amorphous

Table 1 (continued)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Property
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	

Formula (I-4)

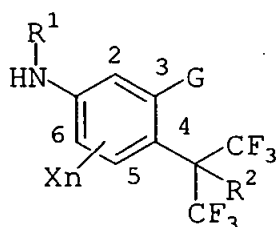
Table 2 ($Y^1=Me$)

No.	G	Xn	Y^2_m	R^1	R^2	Property
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	
2-15	n-Pr	6-Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	132-134
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

Table 2 (continued)

No.	G	Xn	Y _m ²	R ¹	R ²	Property
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	amorphous
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	COCH ₂ Et 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	amorphous
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	amorphous
2-41	n-Pr	6-Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	paste
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

Formula (II)



(II)

Table 3 (R¹=H)

No	G	Xn	R ²	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ value (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)

Table 5

No.	$^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ value (ppm)}]$
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)

Table 5 (continued)

No.	$^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ value (ppm)}]$
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), 2.94(d, 2H), 2.47(s, 3H), 2.14(m, 1H), 0.92(d, 6H)

Table 5 (continued)

No.	$^1\text{H-NMR}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}, \delta \text{ value (ppm)}]$
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)

Table 5 (continued)

No.	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, δ value (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)

The agrohorticultural agent, in particular, agrohorticultural insecticides or acaricides, containing a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) or salt of the present invention as an active ingredient, are suitable for controlling various insect pests such as agrohorticultural insect pests, stored grain insect pests, sanitary insect pests, nematodes, etc., which are injurious to paddy rice, fruit trees, vegetables, other crops, flowers and ornamental plants, etc. They have a marked insecticidal effect, for example, on LEPIDOPTERA including summer fruit tortrix (Adoxophes orana fasciata), smaller tea tortrix (Adoxophyes sp.), Manchurian fruit moth (Grapholita inopinata), oriental fruit moth (Grapholita molesta), soybean pod borer (Leguminivora glycinivorella), mulberry leafroller (Olethreutes mori), tea leafroller (Caloptilia theviva), Caloptilia sp. (Caloptilia zachrysa), apple leafminer (Phyllonorycter ringoniella), pear barkminer (Spulerrina astaurola), common white (Piers rapae crucivora), tobacco budworm (Heliothis sp.), codling moth (Laspey resia pomonella), diamondback moth (Plutella xylostella), apple fruit moth (Argyresthia conjugella), peach fruit moth (Carposina niponensis), rice stem borer (Chilo suppressalis), rice leafroller (Cnaphalocrocis medinalis), tobacco moth (Ephestia elutella), mulberry pyralid (Glyphodes pyloalis), yellow rice borer (Scirpophaga incertulas), rice skipper (Parnara guttata), rice armyworm (Pseudaletia separata), pink borer (Sesamia inferens), common cutworm (Spodoptera litura), beet armyworm (Spodoptera exigua), etc.;

- HEMIPTERA including aster leafhopper (Macrosteles fascifrons), green rice leafhopper (Nephotettix cincticeps), brown rice planthopper (Nilaparvata lugens), whitebacked rice planthopper (Sogatella furcifera), citrus psylla (Diaphorina citri), grape
- 5 whitefly (Aleurolibus taonabae), sweetpotato whitefly (Bemisia tabaci), greenhouse whitefly (Trialeurodes vaporariorum), turnup aphid (Lipaphis erysimi), green peach aphid (Myzus persicae), Indian wax scale (Ceroplastes ceriferus), cottony citrus scale (Pulvinaria aurantii), camphor scale
- 10 (Pseudaonidia duplex), san Jose scale (Comstockaspis perniciosus), arrowhead scale (Unaspis yanonensis), etc.;
- TYLENCHIDA including soybean beetle (Anomala rufocuprea), Japanese beetle (Popillia japonica), tobacco beetle (Lasioderma serricorne), powderpost beetle (Lyctus brunneus),
- 15 twenty-eight-spotted ladybird (Epilachna vigintiotopunctata), azuki bean weevil (Callosobruchus chinensis), vegetable weevil (Listroderes costirostris), maize weevil (Sitophilus zeamais), boll weevil (Anthonomus grandis grandis), rice water weevil (Lissorhoptrus oryzophilus), cucurbit leaf beetle (Aulacophora
- 20 femoralis), rice leaf beetle (Oulema oryzae), striped flea beetle (Phyllotreta striolata), pine shoot beetle (Tomicus piniperda), Colorado potato beetle (Leptinotarsa decemlineata), Mexican bean beetle (Epilachna varivestis), corn rootworm (Diabrotica sp.), etc.;
- 25 DIPTERA including melon fly (Dacus(Zeugodacus) cucurbitae), oriental fruit fly (Dacus(Bactrocera) dorsalis), rice leafminer (Agnomyza oryzae), onion maggot (Delia antiqua), seedcorn maggot (Delia platura), soybean pod gall midge (Asphondylia sp.), etc.;
- TYLENCHIDA including root-lesion
- 30 nematode (Pratylenchus sp.), potato cyst nematode (Globodera rostochiensis), root-knot nematode (Meloidogyne sp.), citrus nematode (Tylenchulus semipenetrans), Aphelenchus sp. (Aphelenchus avenae), chrysanthemum foliar (Aphelenchoides ritzemabosi), etc.;
- and ACARINA including citrus red mite
- 35 (Panonychus citri), fruit tree red spider mite (Panonychus ulmi), carmine spider mite (Tetranychus cinnabarinus), Kanzawa spider mite (Tetranychus Kanzawai Kishida), two-spotted spider mite (Tetranychus urticae Koch), pink tea rust mite (Acaphylla theae), pink citrus rust mite (Aculops pelekassi), purple tea

mice (Calacarus carinatus), pear rust mite (Epitrimerus pyri), etc.

A substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) or salts thereof of the present invention is used preferably as agrohorticultural insecticides or acaricides. However, the compound exhibits excellent control effect against various insect pests such as insect pests for forest and wood, insect pests for livestock farming, sanitary insect pests, etc. and can be used as pest control agents in various wide fields. Examples of insect pests include: Tabanidae such as Tabanus rufidens Bigot; Muscidae such as housefly (Musca domestica uicina MACQUART); Gasterophilidae such as horse bot fly (Gasterophilus intestinalis); Hypodermatidae such as cattle grub (Hypoderma bouis L.); Phoridae such as Megaselia spiracularis; Culicidae such as pale house mosquito (Culex pipiens pallens), Anopheles sinensis, one-striped mosquito (Aedes albopictus), and Aedes japonicus; Pulicidae such as cat flea (Ctenocephalides felis), dog flea (Ctenocephalides canis), human flea (Pulex irritans); Ixodidae such as Ixodes ovatus Neumann; Lymantriidae such as Euproctis similis; Rhynchophoridae such as rice weevil (Sitophilus zeamais); Vespidae such as Vespa simillima xanthoptera Cameron; Blattellidae such as German cockroach (Blattella germanica); Blattidae such as American cockroach (Periplaneta americana) and Periplaneta japonica; Pthiridae such as public-louse (Phthirus pubis); Termitidae such as Japanese termite (Reticulitermes speratus) and house termite (Coptotermes formosanus); and Ixodidae such as Ixodes persulcatus; and Macronyssidae such as tropical rat mite (Ornithonyssus bacoti).

The agrohorticultural agent, in particular, agrohorticultural insecticides or acaricides, containing a substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) or salt thereof of the present invention as an active ingredient has a marked controlling effect on the above-exemplified insect pests, which are injurious to paddy field crops, upland crops, fruit trees, vegetables and other crops, flowers and ornament plants, and the like. Therefore, the desired effect of the agrohorticultural insecticides of

the present invention can be exhibited by applying the agents to paddy field, field, fruit trees, vegetables, other crops, seeds of flowers and ornament plants, paddy field water, stalks and leaves, or soil at a season at which the insect
 5 pests are expected to appear, before their appearance or at the time when their appearance is confirmed.

Plants, for which an agrohorticultural agent of the present invention can be used, are not specifically limited and include, for example, plants shown hereinbelow:

10 Cereals (e.g. rice (Oryza sativa), barley (Hordeum vulgare), wheat (Triticum aestivum L.), rye (Secale cereale), oat (Avena), maize (Zea mays L.), kaoliang, etc.); legume (soybean, adzuki bean, fava bean, bean, peanut, etc.); fruit trees and fruits (apple, citrus fruits, pear, grapes, peach,
 15 plum, cherry, walnut, almond, banana, strawberry, etc.); vegetables (cabbage, tomato, spinach, broccoli, lettuce, onion, welsh onion, green pepper, etc.); root vegetables (carrot, potato, sweet potato, radish, lotus root, turnip, etc.); crop for processing (cotton, flax (Linum usitatissimum), paper
 20 mulberry (Broussonetia kasinoki SIEB), paperbush (Edgeworthia papyrifera), rape (Brassica napus L.), beet (Beta vulgaris), hop, sugar cane (Saccharatum officinarum), sugar beet (Beta vulgaris var. saccharifera), olive, rubber, coffee, tobacco, tea, etc.); gourd (pumpkin, cucumber, watermelon, melon,
 25 etc.); grass (orchard grass, sorghum, timothy, clover, alfalfa, etc.); grass (Korean lawn grass, bent grass, etc.); crop for spicery (lavender (Lavandula officinalis CHAIX), rosemary, thyme, parsley, pepper, ginger, etc.); and flowers (chrysanthemum, rose, orchid, etc.).

30 Recently, gene recombinant crop (herbicide resistant crop, insect pest resistant crop incorporated with insecticidal toxin generating gene, disease resistant crop incorporated with disease resistance inducer producing gene, taste improved crop, preservability improved crop, yield improved crop, etc.),
 35 insect sex pheromone (pheromone disrupting chemicals for leaf roller moths, cabbage armyworm, etc.), IPM (integrated pest management) technology using natural enemy insect have been progressed, and pesticide compositions of the present invention can be used in combination with or by

systematization with such technologies.

The agrohorticultural agent of the present invention is generally prepared into conveniently usable forms according to an ordinary manner for formulation of agrochemicals.

5 That is, the substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I) or salt of the present invention and, optionally, an adjuvant are blended with a suitable inert carrier in a proper proportion and prepared into a suitable formulation form such as a suspension,
10 emulsifiable concentrate, soluble concentrate, wettable powder, water dispersible granule, granules, dust, tablets, pack or the like through dissolution, dispersion, suspension, mixing, impregnation, adsorption or sticking.

The inert carrier usable in the present invention may be
15 either solid or liquid. As a material usable as the solid carrier, there can be exemplified soybean flour, cereal flour, wood flour, bark flour, saw dust, powdered tobacco stalks, powdered walnut shells, bran, powdered cellulose, extraction residue of vegetables, resins such as powdered synthetic
20 polymers and the like, clays (e.g. kaolin, bentonite, and acid clay), talcs (e.g. talc and pyrophyllite), silica powders or flakes (e.g. diatomaceous earth, silica sand, mica and white carbon [synthetic, high-dispersion silicic acid, also called finely divided hydrated silica or hydrated silicic acid, some
25 of commercially available products contain calcium silicate as the major component]), inorganic or mineral powders such as activated carbon, powdered sulfur, pumice, calcined diatomaceous earth, ground brick, fly ash, sand, calcium carbonate, calcium phosphate and the like, plastic carriers
30 such as polyethylene, polypropylene, poly(vinylidene chloride) and the like, chemical fertilizers (e.g. ammonium sulfate, ammonium phosphate, ammonium nitrate, urea and ammonium chloride), and compost. These carriers may be used alone or as a mixture of two or more kinds thereof.

35 A material usable as the liquid carrier is selected from materials that have solubility in themselves or which, even without such solubility, are capable of dispersing an active ingredient with the aid of an adjuvant. The following are typical examples of the liquid carrier and can be used alone

or as a mixture of two or more kinds thereof: water, alcohols (e.g. methanol, ethanol, isopropanol, butanol and ethylene glycol), ketones (e.g. acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone, diisobutyl ketone and cyclohexanone), ethers (e.g. ethyl ether, dioxane, Cellosolve, dipropyl ether and tetrahydrofuran), aliphatic hydrocarbons (e.g. kerosene and mineral oils), aromatic hydrocarbons (e.g. benzene, toluene, xylene, solvent naphtha and alkylnaphthalenes), halogenated hydrocarbons (e.g. dichloroethane, chloroform, carbon tetrachloride and chlorobenzene), esters (e.g. ethyl acetate, diisopropyl phthalate, dibutyl phthalate and dioctyl phthalate), amides (e.g. dimethylformamide, diethylformamide and dimethylacetamide), nitriles (e.g. acetonitrile), and dimethyl sulfoxide.

15 The following are typical examples of the adjuvant, which are used depending upon purposes and used alone or in combination of two or more kinds, or in some cases, need not be used at all.

To emulsify, disperse, dissolve and/or wet a compound as active ingredient, a surfactant is used. As the surfactant, there can be exemplified polyoxyethylene alkyl ethers, polyoxyethylene alkylaryl ethers, polyoxyethylene higher fatty acid esters, polyoxyethylene resonates, polyoxyethylene sorbitan monolaurate, polyoxyethylene sorbitan monooleate, alkylarylsulfonates, naphthalene sulfonic acid condensation products, ligninsulfonates and higher alcohol sulfate esters.

Further, to stabilize the dispersion of a compound as active ingredient, tackify it and/or bind it, the adjuvants exemplified below may also be used, namely, there may also be used adjuvants such as casein, gelatin, starch, methyl cellulose, carboxymethyl cellulose, gum arabic, poly(vinyl alcohol)s, turpentine, bran oil, bentonite and ligninsulfonates.

To improve the flowability of a solid product, the following adjuvants may also be used, namely, there may be used adjuvants such as waxes, stearates, alkyl phosphates, etc.

Adjuvants such as naphthalenesulfonic acid condensation products and polycondensates of phosphates may be used as a peptizer for dispersible products

Adjuvants such as silicone oils may also be used as a defoaming agent.

Adjuvants such as 1,2-benzisothiazoline-3-one, p-chloro-m-xyleneol, butyl p-hydroxybenzoate may also be added as a
5 preservative.

Further, if necessary, functional spreading agents, active enhancers such as metabolic decomposition inhibitor like piperonyl butoxide, anti-freezing agents such as propylene glycol, antioxidants such as BHT, ultraviolet
10 absorbers, and the other additives may also be added.

The content of the compound as active ingredient may be varied as required, and the compound as active ingredient may be used in a proportion properly chosen in the range of 0.01 to 90 parts by weight per 100 parts of the agrohorticultural
15 agents. For example, in dusts or granules, the suitable content of the compound as active ingredient is from 0.01 to 50 % by weight. In emulsifiable concentrate or wettable powders, it is also from 0.01 to 50 % by weight.

The agrohorticultural agent of the present invention is
20 used to control a variety of insect pests in the following manner: it is applied to a crop on which the insect pests are expected to appear, or a site where appearance or growth of the insect pests is undesirable, as it is or after being properly diluted with or suspended in water or the like, in an
25 amount effective for control of the insect pests.

The applying dosage of the agrohorticultural agent of the present invention is varied depending upon various factors such as a purpose, insect pests to be controlled, a growth state of a plant, tendency of insect pests appearance, weather,
30 environmental conditions, a formulation form, an application method, an application site and application time. It may be properly chosen in the range of 0.001 g to 10 kg, preferably 0.01 g to 1 kg, (in terms of the compound as active ingredient) per 10 ares depending upon purposes.

35 The agrohorticultural agent of the present invention may be used in admixture with other agrohorticultural insecticides, acaricides, nematocides, fungicides, biotic pesticides or the like in order to expand both spectrum of controllable insect pest species and the period of time when effective application

are possible or to reduce the dosage. Furthermore, the agrohorticultural insecticide of the present invention may be used in admixture with herbicides, plant growth regulators, fertilizers or the like, depending upon application situations.

5 As the other agrohorticultural insecticides, acaricides and nematocides, which are used for the above purpose, there can be exemplified agrohorticultural insecticides, acaricides and nematocides, such as Ethion, Trichlorfon, Metamidophos, Acephate, Dichlorvos, Mevinphos, Monocrotophos, Malathion,
 10 Dimethoate, Formothion, Mecarbam, Vamidothion, Thiometon, Disulfoton, Oxydeprofos, Naled, Methylparathion, Fenitrothion, Cyanophos, Propaphos, Fenthion, Prothiofos, Profenofos, Isofenphos, Temephos, Phenthoate, Dimethylvinphos, Chlorfenvinphos, Tetrachlorvinphos, Phoxim, Isoxathion,
 15 Pyraclofos, Methidathion, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-methyl, Pyridaphenthion, Diazinon, Pirimiphosmethyl, Phosalone, Phosmet, Dioxabenzophos, Quinalphos, Terbuphos, Ethoprophos, Cadusafos, Mesulfenfos, Spirodiclofen, Metaflumizone, Flubendiamide, DPS (NK-0795), Phosphocarb, Fenamiphos,
 20 Isoamidophos, Fosthiazate, Isazophos, Ethoprophos, Fenthion, Fostietane, Dichlofenthion, Thionazin, Sulprofos, Fensulfothion, Diamidafos, Pyrethrin, Allethrin, Prallethrin, Resmethrin, Permethrin, Tefluthrin, Bifenthrin, Fenpropathrin, Cypermethrin, α -Cypermethrin, Cyhalothrin, λ -Cyhalothrin,
 25 Deltamethrin, Acrinathrin, Fenvalerate, Esfenvalerate, Cycloprothrin, Ethofenprox, Halfenprox, Silafluofen, Flucythrinate, Fluvalinate, Methomyl, Oxamyl, Thiodicarb, Aldicarb, Alanycarb, Cartap, Metolcarb, Xylylcarb, Propoxur, Phenoxycarb, Fenobucarb, Ethiophencarb, Fenothiocarb,
 30 Bifenazate, BPMC, Carbaryl, Pirimicarb, Carbofuran, Carbosulfan, Furathiocarb, Benfuracarb, Aldoxycarb, Diafenthion, Diflubenzuron, Teflubenzuron, Hexaflumuron, Novaluron, Lufenuron, Flufenoxuron, Chlorfluazuron, Fenbutatin oxide, Tricyclohexyltin hydroxide, Sodium oleate, Potassium
 35 oleate, Methoprene, Hydroprene, Binapacryl, Amitraz, Dicofol, Kersen, Chlorobenzilate, Bromopropylate, Tetradifon, Bensultap, Benzoximate, Tebufenozide, Methoxyfenozide, Pyridalyl, Chromafenozide, Propargite, Acequinosyl, Endosulfan, Diofenolan, Chlorfenapyl, Fenpyroximate, Tolfenpyrad, Fipronil,

Tebufenpyrad, Triazamate, Etoxazole, Hexythiazox, Nicotine sulfate, Nitenpyram, Acetamiprid, Thiacloprid, Imidacloprid, Thiamethoxam, Clothianidin, Dinotefuran, Fluazinam, Pyriproxyfen, Hydramethylnon, Pyrimidifen, Pyridaben,
 5 Cyromazine, TPIC (tripropyl isocyanurate), Pymetrozin, Clofentezin, Buprofedine, Thiocyclam, Fenazaquin, Chinomethionate, Indoxacarb, Polynactin complexes, Milbemectin, Abamectin, Emamectin-benzoate, Spinosad, BT (Bacillus
thuringiensis), Azadirachtin, Rotenone, Hydroxypropyl starch,
 10 Levamisole hydrochloride, Metam-sodium, Morantel tartrate, Dazomet, Trichlamide, Pasteuria penetrans, Monacrosporium-phymatophagum, etc.

As the agrohorticultural fungicides used for the same purpose as above, there can be exemplified agrohorticultural
 15 fungicides such as Sulfur, Lime sulfur, Copper sulfate basic, Iprobenfos, Edifenfos, Tolclofos-methyl, Thiram, Polycarbamate, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Thiophanate, Thiophanate methyl, Benomyl, Iminoctadin acetate, Iminocutadin albexylate, Mepronil, Flutolanil, Pencycuron, Furametpyl, Thifluzamide,
 20 Metalaxyl, Oxadixyl, Carpropamid, Dichlofluanid, Flusulfamide, Chlorothalonil, Kresoxim-methyl, Fenoxanil, Himexazol, Etridiazol, Fluoroimide, Procymidone, Vinclozolin, Iprodione, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizole, Iaconazole, Fluconazole, Propiconazole, Diphenconazole, Myclobutanil, Tetraconazole,
 25 Hexaconazole, Tebuconazole, Thiadinil, Imibenconazole, Prochloraz, Pefurazoate, Cyproconazole, Isoprothiolane, Fenarimol, Pyrimetanil, Mepanipyrim, Pyrifenoxy, Fluazinam, Triforine, Diclomezine, Azoxystrobin, Thiadiazin, Captan, Probenazole, Acibenzolar-S-methyl, Fthalide, Tricyclazole,
 30 Pyroquilon, Chinomethionat, Oxolinic acid, Dithianon, Kasugamycin, Validamycin, Polyoxin, Blastidol, Streptomycin, etc.

Similarly, as the herbicides, there can be exemplified herbicides such as Glyphosate, Sulfosate, Glyphosate,
 35 Bialaphos, Butamifos, Esprocarb, Prosulcarb, Benthiocarb, Pyributycarb, Asulam, Linuron, Dymron, Isouron, Bensulfuron methyl, Cyclosulfamuron, Cinosulfuron, Pyrazosulfuron ethyl, Azimsulfuron, Imazosulfuron, Tenylchlor, Alachlor, Pretilachlor, Clomeprop, Etobenzanid, Mefenacet, Pendimethalin,

Bifenox, Acifluorfen, Lactfen, Cyhalofop-butyl, Ioxynil, Bromobutide, Alloxymid, Setoxydim, Napropamide, Indanofan, Pyrazolate, Benzofenap, Pyraflufen-ethyl, Imazapyl, Sulfentrazone, Cafenstrole, Bentoxazon, Oxadiazon, Paraquat, 5 Diquat, Pyriminobac, Simazine, Atrazine, Dimethametryn, Triazyflam, Benflesate, Flutiacet-methyl, Quizalofop-ethyl, Bentazon, Calcium peroxide, etc.

As to the biotic pesticides, the same effect as above can be expected by using the agrohorticultural agent of the 10 present invention in admixture with, for example, viral formulations obtained from nuclear polyhedrosis virus (NPV), granulosis virus (GV), cytoplasmic polyhedrosis virus (CPV), entomopox virus (EPV), etc.; microbial pesticides utilized as insecticides or nematocides, such as Monacrosporium 15 phymatophagum, Steinernema carpocapsae, Steinernema kushidai, Pasteuria penetrans, etc.; microbial pesticides utilized as fungicides, such as Trichoderma lignorum, Agrobacterium radiobactor, nonpathogenic Erwinia carotovora, Bacillus subtilis, etc.; and biotic pesticides utilized as herbicides, 20 such as Xanthomonas campestris, etc.

In addition, the agrohorticultural agent of the present invention can be used in combination with biotic pesticides including natural enemies such as Parasitic wasp (Encarsia formosa), Parasitic wasp (Aphidius colemani), Gall-mildge 25 (Aphidoletes aphidimyza), Parasitic wasp (Diglyphus isaea), Parasitic mite (Dacnusa sibirica), Predatory mite (Phytoseiulus persimilis), Predatory mite (Amblyseius cucumeris), Predatory bug (Orius sauteri), etc.; microbial pesticides such as Beauveria brongniartii, etc.; and 30 pheromones such as (Z)-10-tetradecenyl acetate, (E,Z)-4,10-tetradecadienyl acetate, (Z)-8-dodecenyl acetate, (Z)-11-tetradecenyl acetate, (Z)-13-icosen-10-one, (Z)-8-dodecenyl acetate, (Z)-11-tetradecenyl acetate, (Z)-13-icosen-10-one, 14-methyl-1-octadecene, etc.

35

Examples

The substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by the formula (I), and substituted aniline derivative represented by the formula (II) and substituted pyrazolecarboxylic acid represented by the formula (IV), which

are intermediates therefore, of the present invention, are explained in the following by referring to Examples, which are not to be construed as limitative.

Example 1 Production of 1,3-dimethyl-5-

5 trifluoromethylpyrazole-4-carboxylic acid (compound No. 4-1)

4-Iodo-1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole (8.7 g, 30 mmol) was dissolved in tetrahydrofuran (87 ml), and a solution (1.6 M, 28 ml) of n-butyl lithium in hexane was slowly added under an argon atmosphere with cooling with dryice-acetone (not higher than -60°C). After stirring at -70°C for 30 min, the mixture was gradually warmed to room temperature while blowing in carbon dioxide. The reaction mixture was poured into water, the organic layer was removed, and the aqueous layer was acidified with hydrochloric acid. The aqueous layer was extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure. The obtained crude crystals were washed with hexane to give the desired compound (4.67 g) as crystals.

20 yield 74%

Property: melting point 124 - 125.5°C

Example 2 Production of N-{3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-1,5-dimethyl-3-trifluoromethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-211)

25 1,5-Dimethyl-3-trifluoromethylpyrazole-4-carboxylic acid (2.09 g, 10 mmol) was dissolved in thionyl chloride, and the mixture was heated under reflux for 3 hr. The mixture was concentrated under reduced pressure to give 1,5-dimethyl-3-trifluoromethylpyrazole-4-carbonyl chloride. This was added to a solution of 3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (3.29 g, 10 mmol) and triethylamine (3.03 g, 30 mmol) in tetrahydrofuran (30 ml), and the mixture was heated under reflux for 2 hr. The reaction mixture was diluted with ethyl acetate, washed with water, and dried over magnesium sulfate. After concentration under reduced pressure, the obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:1) to give the desired compound (3.64 g) as crystals.

35 yield 70%

Property: melting point 138-139°C

Example 3 Production of N-methoxymethyl-N-{3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-1,5-dimethyl-3-trifluoromethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-222)

Sodium hydride (32 mg, 60%, 0.8 mmol) was suspended in tetrahydrofuran (10 ml), and a solution of N-(3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl)-1,5-dimethyl-3-trifluoromethylpyrazole-4-carboxamide (250 mg, 0.48 mmol) in tetrahydrofuran (5 ml) was added dropwise. After stirring at room temperature for 30 min, a solution of chloromethyl methyl ether (64 mg, 0.8 mmol) in tetrahydrofuran (2 ml) was added and the mixture was stirred for 5 hr. The reaction mixture was poured into diluted hydrochloric acid and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate, and concentrated under reduced pressure, and the obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=2:1) to give the desired compound (238 mg).

yield: 88%

Property: n_D^{20} 1.4669 (22.4°C)

Example 4 Production of 2-methyl-5-n-propyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (compound No. 3-1)

5-n-Propyl-2-methylaniline (14.9 g, 0.1 mol) was diluted in a mixed solvent (300 ml) of tert-butyl methyl ether-water (1:1), and heptafluoroisopropyl iodide (29.6 g, 0.1 mol), tetrabutylammonium hydrogen sulfate (3.4 g, 0.01 mol), sodium hydrogen carbonate (8.4 g, 0.1 mol) and sodium dithionite (17 g, 0.1 mol) were successively added. The mixture was stirred overnight at room temperature. The reaction mixture was diluted in hexane, washed twice with 3N hydrochloric acid, and washed with aqueous sodium hydrogen carbonate and saturated brine. The organic layer was dried over magnesium sulfate, and concentrated under reduced pressure. The residue was purified by silica gel chromatography (hexane:ethyl acetate 5:1) to give the desired compound (28.5 g).

yield: 90%

Property: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ value (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)

Example 5 Production of 4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]-2-methyl-5-n-propylaniline (compound

No. 3-3)

2-Methyl-5-n-propyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (1.6 g, 5 mmol) was dissolved in a 28% solution (9.6 g) of sodium methoxide in methanol, and the mixture was heated under reflux for 3 hr. After allowing
10 to cool, the reaction mixture was poured into ice water and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure. The obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=5:1) to
15 give the desired compound (1.31 g).

yield: 79%

Property: ¹H-NMR[CDCl₃/TMS, δ value (ppm)] 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)

20 Example 6 Production of 2-methyl-5-n-propyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (compound No. 3-2)

2-Methyl-5-n-propyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (1.6 g, 5 mmol) was dissolved in dimethyl sulfoxide (20 ml), sodium borohydride (378 mg, 10
25 mmol) was added by small portions, and the mixture was stirred at 60°C for 5 hr. Ice was added to the reaction mixture by small portions, and then acetic acid was added dropwise. The reaction mixture was diluted with ethyl acetate, and the organic layer was washed 4 times with water, dried over
30 magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure to give the desired compound (1.47 g).

yield: 99%

Property: ¹H-NMR[CDCl₃/TMS, δ value (ppm)] 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),
35 1.57(m, 2H), 0.98(t, 3H)

Example 7 Production of N-{4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]-2-methyl-5-n-propylphenyl}-1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 2-15)

1,3,5-Trimethylpyrazole-4-carbonyl chloride (172 mg, 1

mmol), 4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]-2-methyl-5-n-propylaniline (329 mg, 1 mmol) and triethylamine (303 mg, 3 mmol) were dissolved in tetrahydrofuran (10 ml), and the mixture was heated under reflux for 3 hr. The reaction mixture was diluted with ethyl acetate, and washed with water. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure. The obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:2) to give the desired compound (360 mg).

yield: 77%

Property: melting point 132-134°C

Example 8 Production of N-acetyl-N-{4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]-2-methyl-5-n-propylphenyl}-1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 2-16)

Sodium hydride (32 mg, 60%, 0.8 mmol) was suspended in tetrahydrofuran (10 ml), and a solution of N-{4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]-2-methyl-5-n-propylphenyl}-1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (250 mg, 0.53 mmol) in tetrahydrofuran (5 ml) was added dropwise. After stirring at room temperature for 30 min, a solution of acetic anhydride (80 mg, 0.78 mmol) in tetrahydrofuran (2 ml) was added, and the mixture was stirred for one day. The reaction mixture was poured into diluted hydrochloric acid, and the mixture was extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure, and the obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:3) to give the desired compound (139 mg).

yield: 52%

Property: n_D^{25} 1.4905 (25.9°C)

Example 9 Production of N-{2-methyl-5-n-propyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-2-methyl-5-n-propylphenyl}-1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 2-13)

In the same manner as in Example 7 except that 2-methyl-5-n-propyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline was used instead of 4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]-2-methyl-5-n-propylaniline, the

reaction is carried out for 3 hr to give the desired compound.

yield: 66%

Property: melting point 128-131°C

Example 10 Production of N-{3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-

5 trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-1,3,5-

trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-155)

1,3,5-trimethylpyrazole-4-carbonyl chloride (3.93 g, 22.8 mmol), 3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (5.0 g, 15.2 mmol), and
10 triethylamine (3.07 g, 30.4 mmol) were dissolved in tetrahydrofuran (100 ml), and the mixture was heated under reflux for 5 hr. The reaction mixture was diluted with ethyl acetate, and washed with water. The organic layer was dried
15 over anhydrous magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure. The obtained crude crystals were washed with ether to give the desired compound (5.62 g).

yield: 80%

Property: melting point 189-190°C

Example 11 Production of N-ethoxymethyl-N-{3-isobutyl-4-[1-

20 methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-

1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-145)

Sodium hydride (29 mg, 60%, 0.73 mmol) was suspended in tetrahydrofuran (10 ml), and a solution of N-{3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-
25 1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (260 mg, 0.48 mmol) in tetrahydrofuran (5 ml) was added dropwise. After stirring at room temperature for 30 min, a solution of chloromethyl ethyl ether (70 mg, 0.73 mmol) in tetrahydrofuran (2 ml) was added, and the mixture was stirred for one day. The reaction mixture
30 was poured into diluted hydrochloric acid, and the mixture was extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure, and the obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:3)
35 to give the desired compound (200 mg).

yield: 69%

Property: n_D^{22} 1.4892 (22.4°C)

Example 12 Production of N-isobutyloxycarbonyl-N-{3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-

1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-152)

Sodium hydride (29 mg, 60%, 0.73 mmol) was suspended in tetrahydrofuran (10 ml), and a solution of N-{3-isobutyl-4-[1-methoxy-2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-
5 1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (260 mg, 0.48 mmol) in tetrahydrofuran (5 ml) was added dropwise. After stirring at room temperature for 30 min, a solution of isobutyl chlorocarbonate (100 mg, 0.73 mmol) in tetrahydrofuran (2 ml) was added, and the mixture was stirred for one day. The
10 reaction mixture was poured into diluted hydrochloric acid and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure, and the obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:1)
15 to give the desired compound (280 mg).

yield: 91%

Property: n_D^{20} 1.4829 (22.3°C)

Example 13 Production of N-{3-isobutyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-123)

1,3,5-Trimethylpyrazole-4-carbonyl chloride (2.09 g, 10.0 mmol), 3-isobutyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]aniline (2.0 g, 6.69 mmol), and triethylamine (1.35 g, 13.4 mmol) were dissolved in
25 tetrahydrofuran (60 ml), and the mixture was heated under reflux for 5 hr. The reaction mixture was diluted with ethyl acetate, and washed with water. The organic layer was dried over anhydrous magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure, and the obtained residue was purified by
30 silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:3) to give the desired compound (2.41 g).

yield: 77%

Property: melting point 148-151°C

Example 14 Production of N-acetyl-N-{3-isobutyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-1,3,5-trimethylpyrazole-4-carboxamide (compound No. 1-125)

Sodium hydride (38 mg, 60%, 0.96 mmol) was suspended in tetrahydrofuran (10 ml), and a solution of N-{3-isobutyl-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl}-1,3,5-

trimethylpyrazole-4-carboxamide (300 mg, 0.64 mmol) in tetrahydrofuran (5 ml) was added dropwise. After stirring at room temperature for 30 min, a solution of acetyl chloride (75 mg, 0.96 mmol) in tetrahydrofuran (2 ml) was added, and the mixture was stirred for one day. The reaction mixture was poured into diluted hydrochloric acid and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with water, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure, and the obtained residue was purified by silica gel column chromatography (hexane:ethyl acetate=1:3) to give the desired compound (90 mg).

yield: 28%

Property: n_D^{20} 1.5021 (22.5°C)

Reference Example Production of 1 4-iodo-1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole

Iodine (30 g) was dissolved in 60% sulfuric acid (fuming, 80 g), and 1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole (13.12 g, 80 mmol) was slowly added under ice-cooling. The mixture was stirred at 0°C for 2 hr. The reaction mixture was poured into ice water and extracted with ethyl acetate. The organic layer was washed with aqueous sodium thiosulfate and saturated brine, dried over magnesium sulfate and concentrated under reduced pressure. The obtained crude crystals were washed with hexane to give the desired compound (20 g) as crystals.

yield 86%

Property: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ value (ppm)] 3.98(s, 3H), 2.26(s, 3H)

Typical formulation examples and test example of the present invention are described below but they should not be construed as limiting the scope of the invention.

As used in the examples, the terms "part" and "parts" are by weight.

Formulation Example 1

Each compound listed in Table 1 or Table 2	10 parts
Xylene	70 parts
N-methylpyrrolidone	10 parts
Mixture of polyoxyethylene nonylphenyl ether and calcium alkylbenzenesulfonate	10 parts

An emulsifiable concentrate was prepared by mixing

uniformly the above ingredients to effect dissolution.

Formulation Example 2

	Each compound listed in Table 1 or Table 2	3 parts
	Clay powder	82 parts
5	Diatomaceous earth powder	15 parts

A dust was prepared by mixing uniformly and grinding the above ingredients.

Formulation Example 3

	Each compound listed in Table 1 or Table 2	5 parts
10	Mixed powder of bentonite and clay	90 parts
	Calcium ligninsulfonate	5 parts

Granules were prepared by mixing the above ingredients uniformly, and kneading the resulting mixture together with a suitable amount of water, followed by granulation and drying.

15 Formulation Example 4

	Each compound listed in Table 1 or Table 2	20 parts
	Mixture of kaolin and synthetic high-dispersion silicic acid	75 parts
	Mixture of polyoxyethylene nonylphenyl ether and calcium alkylbenzenesulfonate	5 parts
20		

A wettable powder was prepared by mixing uniformly and grinding the above ingredients.

Test Example 1: Acaricidal action on two-spotted spider mite (Tetranychus urticae)

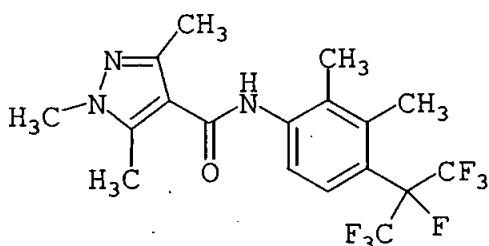
25 Kidney bean leaf disk with a diameter of 2 cm was placed on the wetted filter paper. Ten adult females of two-spotted spider mite were inoculated on each leaf disk, and were sprayed with 50 ml of test solution, prepared by diluting a formulation containing each compound listed in Table 1 or
30 Table 2 as an active ingredient to adjust each of the concentrations to 500 ppm, 50 ppm and 5 ppm.. Two days after the treatment, the survived mites were counted. The corrected mortality was calculated by the following equation and the acaricidal activity was judged according to the criterion
35 shown below. The experiment was carried out with two replicates under the condition at 25°C.

$$\text{Corrected mortality (\%)} = \frac{\text{Number of survived mites in untreated group} - \text{Number of survived mites in treated group}}{\text{Number of survived mites in untreated group}} \times 100$$

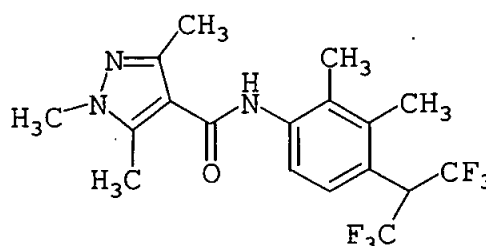
Criterion:

- A --- Corrected mortality 100%
- B --- Corrected mortality 99%-90%
- C --- Corrected mortality 89%-80%
- 5 D --- Corrected mortality 79%-50%

As comparative compounds, compound Nos. 1-163 and 1-164 disclosed in JP-A-2003-48878 were used.



(1-163)



(1-164)

10 As a result of the above-mentioned test, the compound Nos. 1-1, 1-3, 1-4, 1-6, 1-8, 1-10, 1-12, 1-13, 1-15, 1-16, 1-25 to 1-28, 1-31, 1-34 to 1-37, 1-45, 1-47 to 1-49, 1-51 to 54, 1-56, 1-57, 1-59, 1-67, 1-69 to 1-72, 1-74 to 1-76, 1-89, 1-101 to 1-114, 1-120 to 1-160, 1-176 to 1-225, 1-228, 1-234, 1-246, 1-258, 1-260, 1-266, 1-270, 1-282, 1-285, 1-294, 1-306 to 1-325, 1-327 to 1-332, 1-335 to 1-337, 1-339 to 1-342, 1-344 to 1-358, 1-361 to 1-373, 1-375 to 1-380, 1-382 to 1-384, 1-386 to 1-389, 1-391 to 1-394, 1-396, 1-399 to 1-406, 1-412 to 416, 1-420 to 1-423, 1-425 to 1-427, 1-429 to 1-433, 1-435 to 1-439, 1-441 15 to 1-445, 1-448, 1-450 to 1-452, 1-454 to 1-463, 1-467 to 1-470, 1-473, 1-477, 1-478, 1-482 to 1-487, 1-489 to 1-493, 1-496 to 1-502, 1-510, 1-514, 1-515, 1-518, 1-519, 1-523 to 1-527, 1-531, 1-539 to 1-541, 1-546 to 1-549, 2-13, 2-15 to 2-17, 2-21 to 2-23, 2-25, 2-34, 2-36 to 39, 2-41 to 43 and 2-45 of

the present invention showed A activity at any concentration of 500 ppm, 50 ppm and 5 ppm, and the compound Nos. 1-23, 1-32, 1-78, 1-173, 1-284, 1-326, 1-334, 1-338, 1-343, 1-385, 1-397 to 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 to 1-506, 1-509, 1-521, 1-529, 1-530, 1-533, 1-542, 2-26 to 2-33, 2-40 and 2-46 showed A activity at any concentration of 500 ppm and 50 ppm. In contrast, the both control compounds did not show an acaricide activity even at the concentration of 500 ppm.

10

Industrial Applicability

According to the present invention, agrohorticultural agents, particularly insecticides and acaricides, having superior properties as compared to conventional techniques can be provided.

15

This application is based on patent application Nos. 234405/2005, 322531/2005 and 114937/2006 filed in Japan, the contents of which are hereby incorporated by reference.

20

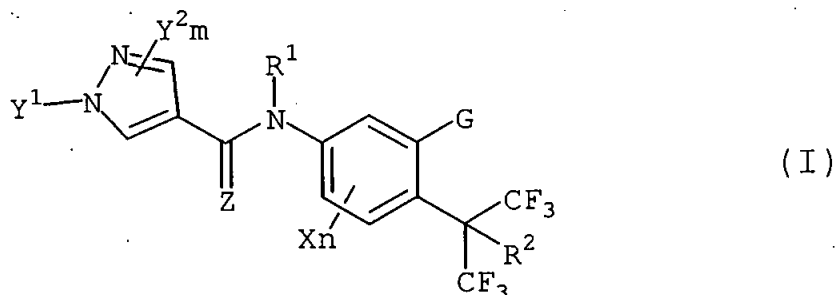
While this invention has been shown and described with references to preferred embodiments thereof, it will be understood by those skilled in the art that various changes in form and details may be made therein without departing from the scope of the invention encompassed by the appended claims.

25

All patents, patent publications and other publications identified or referenced herein are incorporated by reference in their entirety.

Claims

1. A substituted pyrazolecarboxanilide derivative represented by the formula (I):



wherein

R¹ is 1a) a hydrogen atom, 2a) a C₁-C₈ alkyl group, 3a) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a halo C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 6a) a C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 7a) a halo C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 8a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkyl group, 9a) a C₃-C₆ cycloalkyl group, 10a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 11a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 12a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 13a) a C₂-C₆ alkenyl group, 14a) a halo C₂-C₆ alkenyl group, 15a) a C₂-C₆ alkynyl group, 16a) a halo C₂-C₆ alkynyl group, 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 19a) a C₂-C₆ alkenyloxy C₁-C₆ alkyl group, 20a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 21a) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 22a) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 23a) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 24a) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 25a) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 26a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 27a) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group, 28a) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 29a) a phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo

C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 31a) a C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 32a) a C_1-C_6 alkoxy C_1-C_6
 5 alkoxycarbonyl group, 33a) a halo C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 34a) a C_2-C_6 alkenyloxycarbonyl group, 35a) a C_1-C_6 alkylthiocarbonyl group, 36a) a mono C_1-C_6 alkylaminocarbonyl group, 37a) a di C_1-C_6 alkylaminocarbonyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 38a) a C_1-C_6
 10 alkoxycarbonyl C_1-C_6 alkyl group, 39a) a C_1-C_6 alkylsulfonyl group, 40a) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, 41a) a cyano C_1-C_6 alkyl group, 42a) a phenyl C_1-C_6 alkyl group, 43a) a substituted phenyl C_1-C_6 alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a
 15 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl
 20 group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 44a) a phenylcarbonyl group, 45a) a substituted phenylcarbonyl group having, on the ring, one or
 25 more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group, i) a halo C_1-C_6 alkylthio group, j) a C_1-C_6 alkylsulfinyl group, k) a halo C_1-C_6 alkylsulfinyl group, l) a C_1-C_6 alkylsulfonyl
 30 group, m) a halo C_1-C_6 alkylsulfonyl group, n) a mono C_1-C_6 alkylamino group, o) a di C_1-C_6 alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C_1-C_6 alkoxycarbonyl group, 46a) a heterocyclylcarbonyl group, 47a) a substituted heterocyclylcarbonyl group having, on the ring,
 35 one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C_1-C_6 alkyl group, e) a halo C_1-C_6 alkyl group, f) a C_1-C_6 alkoxy group, g) a halo C_1-C_6 alkoxy group, h) a C_1-C_6 alkylthio group,

i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 5 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 alkoxy carbonyl group, 48a) a phenoxycarbonyl group, 49a) a
 substituted phenoxycarbonyl group having, on the ring, one or
 more, the same or different substituents selected from a) a
 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 10 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 15 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
 alkoxy carbonyl group, 50a) a phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group,
 51a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on
 the ring, one or more, the same or different substituents
 20 selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro
 group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a
 C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆
 alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆
 alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a
 25 C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group,
 n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group
 wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a
 C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 52a) a phenylsulfonyl group, 53a) a
 substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or
 30 more, the same or different substituents selected from a) a
 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆
 alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy
 group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,
 i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,
 35 k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆
 alkoxy carbonyl group, 54a) a di C₁-C₆ alkylphosphono group

wherein the alkyl groups are the same or different, 55a) a di C₁-C₆ alkylphosphonothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 56a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxy-carbonylaminothio group, 57a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxy-carbonyl C₁-C₆ alkylaminothio group, 58a) a di C₁-C₆ alkylaminothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 59a) a C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 60a) a halo C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 61a) a C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 62a) a halo C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 63a) a phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 64a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy-carbonyl group, 65a) a phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 66a) a substituted phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy-carbonyl group, 67a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 68a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 69a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 70a) a phenoxy C₁-C₆ alkoxy-carbonyl group, 71a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkoxy-carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆

alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 72a) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 73a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, or 74a) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group;

R² is 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen atom, 3b) a C₁-C₆ alkyl group, 4b) a halo C₁-C₆ alkyl group, 5b) a cyano group, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group, 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy group, 9b) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 10b) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 11b) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 12b) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 13b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 14b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 15b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 16b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 17b) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group, 18b) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group wherein the alkyl groups are the same or different, 19b) a C₁-C₆ alkylthio group, 20b) a halo C₁-C₆ alkylthio group, 21b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 22b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 23b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 24b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 25b) an amino group, 26b) a mono C₁-C₆ alkylamino group, 27b) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, 28b) a phenoxy group, 29b) a substituted phenoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 30b) a phenylthio group, 31b) a substituted phenylthio group having,

on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 32b) a phenylsulfinyl group, 33b) a substituted phenylsulfinyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 34b) a phenylsulfonyl group, 35b) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 36b) a phenyl C₁-C₆ alkoxy group, or 37b) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl

group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group;

5 G is 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group, 2c) a halo C₂-C₁₀ alkyl group, 3c) a C₃-C₁₀ alkenyl group, 4c) a halo C₃-C₁₀ alkenyl group, 5c) a C₃-C₁₀ alkynyl group, 6c) a halo C₃-C₁₀ alkynyl group, 7c) a C₃-C₁₀ cycloalkyl group, 8c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkyl group having, on the ring, one or more, the same or different

10 substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 9c) a C₃-C₁₀ cycloalkenyl group, 10c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkenyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl

15 group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 11c) a C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, or 12c) a halo C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group;

Z is an oxygen atom or a sulfur atom;

X may be the same or different and is 1d) a hydrogen atom, 2d)

20 a halogen atom, 3d) a cyano group, 4d) a nitro group, 5d) a C₁-C₆ alkyl group, or 6d) a halo C₁-C₆ alkyl group;

Y¹ is 1e) a hydrogen atom, 2e) a C₁-C₆ alkyl group, 3e) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4e) a C₂-C₆ alkenyl group, 5e) a halo C₂-C₆ alkenyl group, 6e) a C₂-C₆ alkynyl group, 7e) a halo C₂-C₆

25 alkynyl group, 8e) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 9e) a hydroxy C₁-C₆ alkyl group, 10e) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 11e) a C₃-C₆ cycloalkyl group, 12e) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 13e) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 14e) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 15e) a C₁-C₆

30 alkylsulfonyl group, 16e) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 17e) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 18e) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 19e) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 20e) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 21e) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 22e) a halo C₁-C₆

35 alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 23e) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group, 24e) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 25e) a phenyl group, 26e) a substituted phenyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected

- from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group;
- 10 Y² may be the same or different and is 1f) a hydrogen atom, 2f) a halogen atom, 3f) a cyano group, 4f) a nitro group, 5f) a hydroxyl group, 6f) a mercapto group, 7f) an amino group, 8f) a carboxyl group, 9f) a C₁-C₆ alkyl group, 10f) a halo C₁-C₆ alkyl group, 11f) a C₂-C₆ alkenyl group, 12f) a halo C₂-C₆ alkenyl group, 13f) a C₂-C₆ alkynyl group, 14f) a halo C₂-C₆ alkynyl group, 15f) a tri C₁-C₆ alkylsilyl C₂-C₆ alkynyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 16f) a phenyl C₂-C₆ alkynyl group, 17f) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18f) a hydroxy C₁-C₆ alkyl group, 19f) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 20f) a C₃-C₆ cycloalkyl group, 21f) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 22f) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 23f) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 24f) a C₁-C₆ alkoxy group, 25f) a halo C₁-C₆ alkoxy group, 26f) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy group, 27f) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy group, 28f) a phenyl C₁-C₆ alkoxy group, 29f) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30f) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 31f) a C₁-C₆ alkylthio group, 32f) a halo C₁-C₆ alkylthio group, 33f) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 34f) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 35f) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 36f) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 37f) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 38f) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 39f) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 40f) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 41f) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 42f) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 43f) a mono C₁-C₆ alkylamino group, 44f) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, 45f) a phenylamino group, 46f) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group, 47f) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 48f) a phenyl group,

49f) a substituted phenyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 50f) a phenoxy group, 51f) a substituted phenoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 52f) a heterocyclic group, or 53f) a substituted heterocyclic group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group; m is 1 or 2; and n is an integer of 1-3, or a salt thereof.

2. The substituted pyrazolecarboxanilide derivative of claim 1, wherein R¹ is 1a) a hydrogen atom, 2a) a C₁-C₆ alkyl group, 3a) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a

halo C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 6a) a C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 13a) a C₂-C₆ alkenyl group, 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 19a) a C₂-C₆ alkenyloxy C₁-C₆ alkyl group, 20a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 29a) a phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 31a) a C₁-C₁₆ alkoxy carbonyl group, 32a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 33a) a halo C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 34a) a C₂-C₆ alkenyloxy carbonyl group, 35a) a C₁-C₆ alkylthiocarbonyl group, 42a) a phenyl C₁-C₆ alkyl group, 43a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 44a) a phenyl carbonyl group, 45a) a substituted phenyl carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆

alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 46a) a heterocyclylcarbonyl group, 47a) a substituted heterocyclylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 48a) a phenoxycarbonyl group, 49a) a substituted phenoxycarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 50a) a phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 51a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 52a) a phenylsulfonyl group, 53a) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl

group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 58a) a di C₁-C₆ alkylaminothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 59a) a C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 61a) a C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 63a) a phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 64a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 65a) a phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 66a) a substituted phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 68a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 73a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, or 74a) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, or a salt thereof.

3. The substituted pyrazolecarboxanilide derivative of claim 1 or claim 2, wherein R² is 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen

atom, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group, or 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy group, or a salt thereof.

- 5 4. The substituted pyrazolecarboxanilide derivative of any one of claims 1 to 3, wherein G is 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group, 3c) a C₃-C₁₀ alkenyl group, or 11c) a C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, or a salt thereof.

10

5. The substituted pyrazolecarboxanilide derivative of any one of claims 1 to 4, wherein X is 1d) a hydrogen atom, 2d) a halogen atom, or 5d) a C₁-C₆ alkyl group, or a salt thereof.

15

6. The substituted pyrazolecarboxanilide derivative of any one of claims 1 to 5, wherein Z is an oxygen atom; Y¹ is 2e) a C₁-C₆ alkyl group, 3e) a halo C₁-C₆ alkyl group, or 4e) a C₂-C₆ alkenyl group; and

- 20 Y² is 1f) a hydrogen atom, 2f) a halogen atom, 9f) a C₁-C₆ alkyl group, 10f) a halo C₁-C₆ alkyl group, or 31f) a C₁-C₆ alkylthio group, or a salt thereof.

- 25 7. The substituted pyrazolecarboxanilide derivative of claim 1, wherein R¹ is 1a) a hydrogen atom, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a halo C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a C₁-C₁₆ alkoxycarbonyl group, 32a) a halo C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, or 64a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group;

R² is 1b) a hydrogen atom, or 7b) a C₁-C₆ alkoxy group;

G is 1c) a C₂-C₈ alkyl group;

Z is an oxygen atom;

- 35 X is 1d) a hydrogen atom;

Y¹ is 2e) a C₁-C₆ alkyl group; and

Y² may be the same or different and is 1f) a hydrogen atom, 2f) a halogen atom, 9f) a C₁-C₆ alkyl group, or 10f) a halo C₁-C₆ alkyl group,

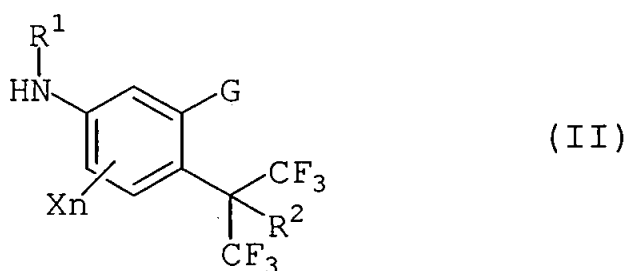
or a salt thereof.

8. An agrohorticultural agent comprising a substituted pyrazolecarboxanilide derivative of any one of claims 1 to 7 or a salt thereof as an active ingredient.

9. The agrohorticultural agent of claim 8, which is an agrohorticultural insecticide or acaricide.

10 10. A method of using an agrohorticultural agent, which comprises treating a target plant or soil with an effective amount of an agrohorticultural agent of claim 8 or 9 so as to control noxious organisms from useful plants.

15 11. A substituted aniline derivative represented by the formula (II):



wherein

R¹ is 1a) a hydrogen atom, 2a) a C₁-C₈ alkyl group, 3a) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a halo C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 6a) a C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 7a) a halo C₂-C₆ alkenylcarbonyl group, 8a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkyl group, 9a) a C₃-C₆ cycloalkyl group, 10a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl group, 11a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 12a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, 13a) a C₂-C₆ alkenyl group, 14a) a halo C₂-C₆ alkenyl group, 15a) a C₂-C₆ alkynyl group, 16a) a halo C₂-C₆ alkynyl group, 17a) a C₁-C₁₀ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 19a) a C₂-C₆ alkenyloxy C₁-C₆ alkyl group, 20a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 21a) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 22a) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₆ alkyl group, 23a) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 24a) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₆ alkyl group, 25a) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₆ alkyl group, 26a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl

C₁-C₆ alkyl group, 27a) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group, 28a) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₆ alkyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 29a) a phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 31a) a C₁-C₁₆ alkoxy carbonyl group, 32a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 33a) a halo C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 34a) a C₂-C₆ alkenyloxy carbonyl group, 35a) a C₁-C₆ alkylthiocarbonyl group, 36a) a mono C₁-C₆ alkylaminocarbonyl group, 37a) a di C₁-C₆ alkylaminocarbonyl group wherein the alkyl groups are the same or different, 38a) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl C₁-C₆ alkyl group, 39a) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 40a) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 41a) a cyano C₁-C₆ alkyl group, 42a) a phenyl C₁-C₆ alkyl group, 43a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 44a) a phenyl carbonyl group, 45a) a substituted phenyl carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group,

i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the
5 alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 46a) a heterocyclylcarbonyl group, 47a) a substituted heterocyclylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-
10 C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆
15 alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 48a) a phenoxycarbonyl group, 49a) a substituted phenoxycarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a
20 halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl
25 group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 50a) a phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 51a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on
30 the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆
35 alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 52a) a phenylsulfonyl group, 53a) a

substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 54a) a di C₁-C₆ alkylphosphono group wherein the alkyl groups are the same or different, 55a) a di C₁-C₆ alkylphosphonothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 56a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxy carbonylaminothio group, 57a) a N-C₁-C₆ alkyl-N-C₁-C₆ alkoxy carbonyl C₁-C₆ alkylaminothio group, 58a) a di C₁-C₆ alkylaminothio group wherein the alkyl groups are the same or different, 59a) a C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 60a) a halo C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 61a) a C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 62a) a halo C₁-C₆ alkyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 63a) a phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 64a) a substituted phenyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 65a) a phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group, 66a) a substituted phenyl C₃-C₆ cycloalkylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group,

k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 67a) a C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 68a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 69a) a halo C₃-C₆ cycloalkyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 70a) a phenoxy C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 71a) a substituted phenoxy C₁-C₆ alkoxy carbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl group, 72a) a C₁-C₆ alkylcarbonyloxy C₁-C₆ alkyl group, 73a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group, or 74a) a C₁-C₆ alkoxy carbonyl C₁-C₆ alkylcarbonyl group; R² is 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen atom, 3b) a C₁-C₆ alkyl group, 4b) a halo C₁-C₆ alkyl group, 5b) a cyano group, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group, 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy group, 9b) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 10b) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₃ alkoxy group, 11b) a C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 12b) a halo C₁-C₆ alkylthio C₁-C₃ alkoxy group, 13b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 14b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl C₁-C₃ alkoxy group, 15b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 16b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl C₁-C₃ alkoxy group, 17b) a mono C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group, 18b) a di C₁-C₆ alkylamino C₁-C₃ alkoxy group wherein the alkyl groups are the same or different, 19b) a C₁-C₆ alkylthio group, 20b) a halo C₁-C₆ alkylthio group, 21b) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 22b) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, 23b) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 24b) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, 25b) an amino group, 26b) a mono C₁-C₆ alkylamino group, 27b) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, 28b) a phenoxy group, 29b) a substituted phenoxy

group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 30b) a phenylthio group, 31b) a substituted phenylthio group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 32b) a phenylsulfinyl group, 33b) a substituted phenylsulfinyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 34b) a phenylsulfonyl group, 35b) a substituted phenylsulfonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl

group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 36b) a phenyl C₁-C₆ alkoxy group, or 37b) a substituted phenyl C₁-C₆ alkoxy group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group;

G is 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group, 2c) a halo C₂-C₁₀ alkyl group, 3c) a C₃-C₁₀ alkenyl group, 4c) a halo C₃-C₁₀ alkenyl group, 5c) a C₃-C₁₀ alkynyl group, 6c) a halo C₃-C₁₀ alkynyl group, 7c) a C₃-C₁₀ cycloalkyl group, 8c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 9c) a C₃-C₁₀ cycloalkenyl group, 10c) a substituted C₃-C₁₀ cycloalkenyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, b) a C₁-C₆ alkyl group, and c) a halo C₁-C₆ alkyl group, 11c) a C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group, or 12c) a halo C₃-C₈ cycloalkyl C₁-C₆ alkyl group;

X may be the same or different and is 1d) a hydrogen atom, 2d) a halogen atom, 3d) a cyano group, 4d) a nitro group, 5d) a C₁-C₆ alkyl group, or 6d) a halo C₁-C₆ alkyl group; and n is an integer of 1-3, or a salt thereof.

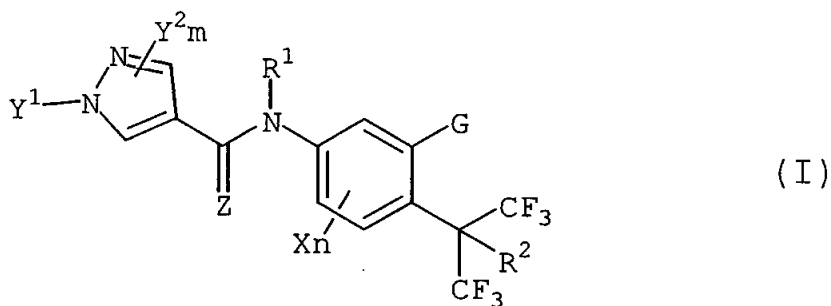
12. The substituted aniline derivative of claim 11, wherein R¹ is 1a) a hydrogen atom, 2a) a C₁-C₆ alkyl group, 3a) a halo C₁-C₆ alkyl group, 4a) a C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 5a) a halo C₁-C₆ alkylcarbonyl group, 17a) a C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 18a) a halo C₁-C₆ alkoxy C₁-C₆ alkyl group, 30a) a C₁-C₆

alkoxycarbonyl group, 32a) a halo C₁-C₆ alkoxycarbonyl group, 43a) a phenylcarbonyl group, or 44a) a substituted phenylcarbonyl group having, on the ring, one or more, the same or different substituents selected from a) a halogen atom, 5 b) a cyano group, c) a nitro group, d) a C₁-C₆ alkyl group, e) a halo C₁-C₆ alkyl group, f) a C₁-C₆ alkoxy group, g) a halo C₁-C₆ alkoxy group, h) a C₁-C₆ alkylthio group, i) a halo C₁-C₆ alkylthio group, j) a C₁-C₆ alkylsulfinyl group, k) a halo C₁-C₆ alkylsulfinyl group, l) a C₁-C₆ alkylsulfonyl group, m) a halo 10 C₁-C₆ alkylsulfonyl group, n) a mono C₁-C₆ alkylamino group, o) a di C₁-C₆ alkylamino group wherein the alkyl groups are the same or different, and p) a C₁-C₆ alkoxycarbonyl group; R² is 1b) a hydrogen atom, 2b) a halogen atom, 6b) a hydroxy group, 7b) a C₁-C₆ alkoxy group, or 8b) a halo C₁-C₆ alkoxy 15 group; G is 1c) a C₂-C₁₀ alkyl group; and X is 1d) a hydrogen atom, or 5d) a C₁-C₆ alkyl group, or a salt thereof.

20 13. 1,3-Dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole-4-carboxylic acid or a salt thereof.

Abstract

The substituted pyrazolecarboxanilide derivatives represented by of the formula (I)



- 5 wherein R¹ is H, alkyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, cycloalkyl, phenylalkyl, phenylcarbonyl and the like; R² is H, halogen, alkyl, CN, OH, alkoxy, phenoxy, phenylthio, phenylsulfonyl and the like; G is alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, C₃-C₁₀ cycloalkenyl and the like; Z is O or S; X is
- 10 H, halogen, CN, NO₂, alkyl and the like; Y¹ is H, alkyl, alkenyl, phenyl, alkoxyalkyl and the like; Y² is H, halogen, CN, NO₂, OH, mercapto, amino, carboxyl, C₁-C₆ alkyl, phenyl, phenoxy, heterocycle and the like, m is 1 or 2; and n is 1-3, and salts
- 15 thereof exhibit a superior effect as agrohorticultural insecticides or acaricides.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/316198

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C07D231/14(2006.01)i, A01N43/56(2006.01)i, A01N43/78(2006.01)i, A01P7/02(2006.01)i, A01P7/04(2006.01)i, C07C211/52(2006.01)i, C07C217/76(2006.01)i, C07D231/16(2006.01)i According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) C07D231/14, A01N43/56, A01N43/78, A01P7/02, A01P7/04, C07C211/52, C07C217/76, C07D231/16 Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched Jitsuyo Shinan Koho 1922-1996 Jitsuyo Shinan Toroku Koho 1996-2006 Kokai Jitsuyo Shinan Koho 1971-2006 Toroku Jitsuyo Shinan Koho 1994-2006 Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) CAPLUS (STN), REGISTRY (STN)		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	WO 2005/115994 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 08 December, 2005 (08.12.05), Claim 8; Par. No. [0006] & JP 2006-8675 A	11, 12
X A	JP 2003-48878 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 21 February, 2003 (21.02.03), Full text & US 2004/0116744 A1 & EP 1400516 A1 & WO 2002/096882 A1	1-6, 8-13 7
X	WO 2005/021488 A1 (Mitsui Chemicals, Inc.), 10 March, 2005 (10.03.05), Claim 16; table 6 & CA 2537124 A	11, 12
☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 06 November, 2006 (06.11.06)		Date of mailing of the international search report 14 November, 2006 (14.11.06)
Name and mailing address of the ISA/ Japanese Patent Office		Authorized officer
Facsimile No.		Telephone No.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/316198

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2001/056962 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 09 August, 2001 (09.08.01), Claims & JP 2001-288129 A & US 2005/0113567 A1 & US 2003/0187233 A1 & EP 1253128 A1 & AU 3056501 A & HU 204389 A & CN 1398249 A	11,12
X	JP 2002-539155 A (Tularik Inc.), 19 November, 2002 (19.11.02), Claims & WO 2000/054759 A2 & US 6316503 B1 & EP 1161233 A & AU 3627300 A & CA 2367595 A	11,12
X	JP 2001-122836 A (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 08 May, 2001 (08.05.01), Claims & US 2002/0198399 A1 & US 2003/0204104 A1 & EP 1006102 A2 & EP 1380568 A2 & HU 9904445 A & CN 1257861 A	11,12
X	JP 2003-518110 A (ICOS Corp.), 03 June, 2003 (03.06.03), Claims & US 2003/0236412 A1 & WO 2001/046172 A1 & AU 2299901 A & CA 2395113 A & CN 1434817 A	13

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP2006/316198

Box No. II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box No. III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

There is no common chemical structure which can be considered as a special technical feature among the substituted pyrazolecarboxylic acid anilide derivative represented by the general formula (I), the substituted aniline derivative represented by the general formula (II), and 1,3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole-4-carboxylic acid.

Consequently, this international application contains two or more inventions.

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

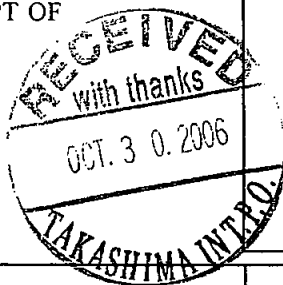
Remark on Protest
the

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest and, where applicable, payment of a protest fee..
- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest but the applicable protest fee was not paid within the time limit specified in the invitation.
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF RECEIPT OF
RECORD COPY

(PCT Rule 24.2(a))



To:

TAKASHIMA, Hajime
Meiji Yasuda Seimei Osaka Midosuji Bldg., 1-1,
Fushimimachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka
5410044
JAPON

Date of mailing (day/month/year) 20 October 2006 (20.10.2006)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference 09933	International application No. PCT/JP2006/316198

The applicant is hereby **notified** that the International Bureau has received the record copy of the international application as detailed below.

Name(s) of the applicant(s) and State(s) for which they are applicants:

NIHON NOHYAKU CO., LTD. (for all designated States except US)
FURUYA, Takashi et al (for US)

International filing date: 11 August 2006 (11.08.2006) ✓
Priority date(s) claimed: 12 August 2005 (12.08.2005) ✓
07 November 2005 (07.11.2005) ✓
18 April 2006 (18.04.2006) ✓
Date of receipt of the record copy by the International Bureau: 31 August 2006 (31.08.2006)

List of designated Offices:

AP: BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW
EA: AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM
EP: AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR
OA: BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG
National: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

ATTENTION: The applicant should carefully check the data appearing in this notification. In case of any discrepancy between these data and the indications in the international application, the applicant should immediately inform the International Bureau. In addition, the applicant's attention is drawn to the information contained in the Annex, relating to:

- time limits for entry into the national phase - see updated important information (as of April 2002)
- requirements regarding priority documents (if applicable)

A copy of this notification is being sent to the receiving Office and to the International Searching Authority.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 82 70	Authorized officer Hennequin Francoise Facsimile No. +41 22 338 70 10 Telephone No. +41 22 338 99 35
---	---

INFORMATION ON ENTERING THE NATIONAL PHASE

The applicant is reminded that the "national phase" must be entered before each of the designated Offices indicated on the cover sheet of this notification by paying national fees and furnishing translations, as prescribed by Articles 22 and 39 and the applicable national laws. In addition, the applicant may also have to comply with other special requirements applicable in certain Offices. It is the applicant's responsibility to ensure that the necessary steps to enter the national phase are taken in a timely fashion. Most Offices do not issue reminders to applicants in connection with the entry into the national phase.

The applicable time limit for entering the national phase will, subject to what is said in the following paragraph, be 30 MONTHS from the priority date, not only in respect of any elected Office if a demand for international preliminary examination is filed before the expiration of 19 months from the priority date (see Article 39(1)), but also in respect of any designated Office, in the absence of filing of such demand, where Article 22(1) as modified with effect from 1 April 2002 applies in respect of that designated Office. For further details, see *PCT Gazette* No. 44/2001 of 1 November 2001, pages 19926, 19932 and 19934, as well as the *PCT Newsletter*, October and November 2001 and February 2002 issues.

In practice, time limits other than the 30-month time limit will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain designated or elected Offices. For regular updates on the applicable time limits (20, 21, 30 or 31 months, or other time limit), Office by Office, refer to the *PCT Gazette* ("Section IV" part published on a weekly basis), to the *PCT Newsletter* (on a monthly basis) and to the relevant National Chapters in Volume II of the *PCT Applicant's Guide* (the paper version of which is updated usually twice a year and the Internet version of which is updated usually on a weekly basis). Finally, a cumulative table of all applicable time limits for entering the national phase is available from WIPO's Internet site, via links from various pages of the site, including those of the *Gazette*, *Newsletter* and *Guide*, at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>.

Information about the requirements for filing a demand for international preliminary examination is set out in the *PCT Applicant's Guide*, Volume I/A, Chapter IX. Note that only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination (at present, all PCT Contracting States are bound by Chapter II).

REQUIREMENTS REGARDING PRIORITY DOCUMENTS

For applicants who have not yet complied with the requirements regarding priority documents, the following is recalled.

Where the priority of an earlier national, regional or international application is claimed, the applicant must submit a copy of the said earlier application, certified by the authority with which it was filed ("the priority document") to the receiving Office (which will transmit it to the International Bureau) or directly to the International Bureau, before the expiration of 16 months from the priority date, provided that any such priority document may still be submitted to the International Bureau before the date of international publication of the international application, in which case that document will be considered to have been received by the International Bureau on the last day of the 16-month time limit (Rule 17.1(a)).

Where the priority document is issued by the receiving Office, the applicant may, instead of submitting the priority document, request the receiving Office to prepare and transmit the priority document to the International Bureau. Such request must be made before the expiration of the 16-month time limit and may be subjected by the receiving Office to the payment of a fee (Rule 17.1(b)).

If the priority document concerned is not submitted to the International Bureau and if the request to the receiving Office to prepare and transmit the priority document has not been made (and the corresponding fee, if any, paid) within the applicable time limit indicated under the preceding paragraphs, any designated State may disregard the priority claim, provided that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances (Rule 17.1(c)).

Where several priorities are claimed, the priority date to be considered for the purposes of computing the 16-month time limit (and all other PCT time limits) is the filing date of the earliest application whose priority is claimed (Article 2(xi)(b)).



PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

TAKASHIMA, Hajime
Meiji Yasuda Seimei Osaka Midotsuji Bldg., 1-1,
Fushimimachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka
5410044
JAPON

Date of mailing (day/month/year) 23 October 2006 (23.10.2006)		IMPORTANT NOTIFICATION	
Applicant's or agent's file reference 09933			
International application No. PCT/JP2006/316198		International filing date (day/month/year) 11 August 2006 (11.08.2006)	
International publication date (day/month/year) Not yet published		Priority date (day/month/year) 12 August 2005 (12.08.2005)	
Applicant NIHON NOHYAKU CO., LTD. et al			

- By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- (If applicable) The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- (If applicable) An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
12 August 2005 (12.08.2005) /	2005-234405 /	JP /	14 September 2006 (14.09.2006) /
07 November 2005 (07.11.2005) /	2005-322531 /	JP /	14 September 2006 (14.09.2006) /
18 April 2006 (18.04.2006) /	2006-114937 /	JP /	14 September 2006 (14.09.2006) /

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Masashi Honda

Facsimile No. +41 22 338 82 70

Facsimile No. +41 22 338 70 10

Telephone No. +41 22 338 82 54

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

FIRST NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF
THE COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL
APPLICATION (TO DESIGNATED OFFICES WHICH
DO NOT APPLY THE 30 MONTH TIME LIMIT
UNDER ARTICLE 22(1))

(PCT Rule 47.1(c))

To:

TAKASHIMA, Hajime
Meiji Yasuda Seimei Osaka Midotsuji Bldg., 1-1, Fushimimachi
4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka
5410044
JAPON



IMPORTANT NOTICE

Date of mailing (day/month/year) 15 March 2007 (15.03.2007)		
Applicant's or agent's file reference 09933		
International application No. PCT/JP2006/316198	International filing date (day/month/year) 11 August 2006 (11.08.2006)	Priority date (day/month/year) 12 August 2005 (12.08.2005)
Applicant NIHON NOHYAKU CO., LTD. et al		

1. **ATTENTION:** For any designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002 (30 months from the priority date), **does apply**, please see Form PCT/IB/308(Second and Supplementary Notice) (to be issued promptly after the expiration of 28 months from the priority date).

2. Notice is hereby given that the following designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does not apply**, has/have requested that the communication of the international application, as provided for in Article 20, be effected under Rule 93bis.1. The International Bureau has effected that communication on the date indicated below:
22 February 2007 (22.02.2007)

CH

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(i), those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

3. The following designated Offices, for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does not apply**, have not requested, as at the time of mailing of the present notice, that the communication of the international application be effected under Rule 93bis.1:

LU, SE, TZ, UG

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(ii), those Offices accept the present notice as conclusive evidence that the Contracting State for which that Office acts as a designated Office does not require the furnishing, under Article 22, by the applicant of a copy of the international application.

4. TIME LIMITS for entry into the national phase

For the designated Office(s) listed above, and unless a demand for international preliminary examination has been filed before the expiration of **19 months** from the priority date (see Article 39(1)), the applicable time limit for entering the national phase will, **subject to what is said in the following paragraph**, be **20 MONTHS** from the priority date.

In practice, **time limits other than the 20-month time limit** will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain of the designated Offices listed above. For **regular updates on the applicable time limits** (20 or 21 months, or other time limit), Office by Office, refer to the *PCT Gazette*, the *PCT Newsletter* and the *PCT Applicant's Guide*, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>.

It is the applicant's **sole responsibility** to monitor all these time limits.

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Masashi Honda

Facsimile No. +41 22 338 82 70

e-mail: pt08.pct@wipo.int

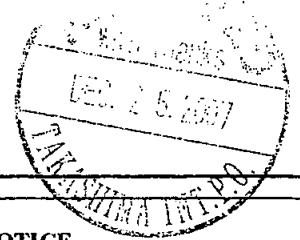
From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

SECOND AND SUPPLEMENTARY NOTICE
INFORMING THE APPLICANT OF THE
COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL
APPLICATION (TO DESIGNATED OFFICES
WHICH APPLY THE 30 MONTH TIME
LIMIT UNDER ARTICLE 22(1))

(PCT Rule 47.1(c))

Date of mailing (day/month/year) 13 December 2007 (13.12.2007)		To: TAKASHIMA, Hajime Meiji Yasuda Seimei Osaka Midosuji Bldg., 1-1, Fushimimachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 5410044 JAPON	
Applicant's or agent's file reference 09933			
International application No. PCT/JP2006/316198		International filing date (day/month/year) 11 August 2006 (11.08.2006)	Priority date (day/month/year) 12 August 2005 (12.08.2005)
Applicant NIHON NOHYAKU CO., LTD. et al			

**IMPORTANT NOTICE**

1. **ATTENTION:** For any designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002 (30 months from the priority date), **does not apply**, please see Form PCT/IB/308(First Notice) issued previously.

2. Notice is hereby given that the following designated Office(s), for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does apply**, has/have requested that the communication of the international application, as provided for in Article 20, be effected under Rule 93bis.1. The International Bureau has effected that communication on the date indicated below:
22 February 2007 (22.02.2007)

AU, AZ, BY, CN, CO, DZ, EP, HU, KG, KP, KR, MD, MK, MZ, NA, NG, PG, RU, SY, TM, US

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(i), those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

3. The following designated Offices, for which the time limit under Article 22(1), as in force from 1 April 2002, **does apply**, have not requested, as at the time of mailing of the present notice, that the communication of the international application be effected under Rule 93bis.1:

AE, AG, AL, AM, AP, AT, BA, BB, BG, BR, BW, BZ, CA, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EA, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KM, KN, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LV, LY, MA, MG, MN, MW, MX, NI, NO, NZ, OA, OM, PH, PL, PT, RO, RS, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, TJ, TN, TR, TT, UA, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

In accordance with Rule 47.1(c-bis)(ii), those Offices accept the present notice as conclusive evidence that the Contracting State for which that Office acts as a designated Office does not require the furnishing, under Article 22, by the applicant of a copy of the international application.

4. TIME LIMITS for entry into the national phase

For the designated or elected Office(s) listed above, the applicable time limit for entering the national phase will, **subject to what is said in the following paragraph**, be **30 MONTHS** from the priority date.

In practice, **time limits other than the 30-month time limit** will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain of the designated or elected Office(s) listed above. For **regular updates on the applicable time limits** (30 or 31 months, or other time limit), Office by Office, refer to the *PCT Gazette*, the *PCT Newsletter* and the *PCT Applicant's Guide*, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>.

It is the applicant's **sole responsibility** to monitor all these time limits.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. +41 22 338 82 70	Authorized officer Masashi Honda e-mail: pt08.pct@wipo.int
---	--

PCT REQUEST

0	For receiving Office use only	
0-1	International Application No.	
0-2	International Filing Date	
0-3	Name of receiving Office and "PCT International Application"	
0-4	Form PCT/RO/101 PCT Request	
0-4-1	Prepared Using	PCT-SAFE [EASY mode] Version 3.51.022.197 MT/FOP 20070701/0.20.5.10
0-5	Petition The undersigned requests that the present international application be processed according to the Patent Cooperation Treaty	
0-6	Receiving Office (specified by the applicant)	Japan Patent Office (RO/JP)
0-7	Applicant's or agent's file reference	09933e
I	Title of Invention	SUBSTITUTED PYRAZOLECARBOXYLIC ACID ANILIDE DERIVATIVE OR SALT THEREOF, INTERMEDIATE THEREOF, AGENT FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE, AND USE THEREOF
II	Applicant	
II-1	This person is	applicant only
II-2	Applicant for	all designated States except US
II-4	Name	NIHON NOHYAKU CO., LTD.
II-5	Address	2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1038236 Japan
II-6	State of nationality	JP
II-7	State of residence	JP
II-8	Telephone No.	0721-56-9000
II-9	Facsimile No.	0721-56-9090
II-11	Applicant's registration No. with the Office	000232623

PCT REQUEST

III-1	Applicant and/or inventor	
III-1-1	This person is	applicant and inventor
III-1-2	Applicant for	US only
III-1-4	Name (LAST, First)	FURUYA, Takashi ✓
III-1-5	Address	c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD. Research Center, 345 Oyamada-cho, Kawachinagano- shi, Osaka 5860094 Japan
III-1-6	State of nationality	JP
III-1-7	State of residence	JP
III-2	Applicant and/or inventor	
III-2-1	This person is	applicant and inventor
III-2-2	Applicant for	US only
III-2-4	Name (LAST, First)	KANNO, Hideo ✓
III-2-5	Address	c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD. Research Center, 345 Oyamada-cho, Kawachinagano- shi, Osaka 5860094 Japan
III-2-6	State of nationality	JP
III-2-7	State of residence	JP
III-3	Applicant and/or inventor	
III-3-1	This person is	applicant and inventor
III-3-2	Applicant for	US only
III-3-4	Name (LAST, First)	MACHIYA, Kozo ✓
III-3-5	Address	10-6, Tamagawagakuen 7-chome, Machida- shi, Tokyo 1940041 Japan
III-3-6	State of nationality	JP
III-3-7	State of residence	JP

PCT REQUEST

III-4	Applicant and/or inventor	
III-4-1	This person is	applicant and inventor
III-4-2	Applicant for	US only
III-4-4	Name (LAST, First)	SUWA, Akiyuki ✓
III-4-5	Address	c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD. Research Center, 345 Oyamada-cho, Kawachinagano- shi, Osaka 5860094 Japan
III-4-6	State of nationality	JP
III-4-7	State of residence	JP
III-5	Applicant and/or inventor	
III-5-1	This person is	applicant and inventor
III-5-2	Applicant for	US only
III-5-4	Name (LAST, First)	YASOKAWA, Noriaki
III-5-5	Address	c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD. Research Center, 345 Oyamada-cho, Kawachinagano- shi, Osaka 5860094 Japan
III-5-6	State of nationality	JP
III-5-7	State of residence	JP
III-6	Applicant and/or inventor	
III-6-1	This person is	applicant and inventor
III-6-2	Applicant for	US only
III-6-4	Name (LAST, First)	FUJIOKA, Shinsuke
III-6-5	Address	c/o NIHON NOHYAKU CO., LTD. Research Center, 345 Oyamada-cho, Kawachinagano- shi, Osaka 5860094 Japan
III-6-6	State of nationality	JP
III-6-7	State of residence	JP

PCT REQUEST

IV-1	Agent or common representative; or address for correspondence The person identified below is hereby/ has been appointed to act on behalf of the applicant(s) before the competent International Authorities as:	agent
IV-1-1	Name (LAST, First)	TAKASHIMA, Hajime
IV-1-2	Address	Meiji Yasuda Seimei Osaka Midosuji Bldg., 1-1, Fushimimachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 5410044 Japan
IV-1-3	Telephone No.	06-6227-1156
IV-1-4	Facsimile No.	06-6227-0260
IV-1-5	e-mail	takatony@nifty.com
IV-1-6	Agent's registration No.	100080791
V	DESIGNATIONS	
V-1	The filing of this request constitutes under Rule 4.9(a), the designation of all Contracting States bound by the PCT on the international filing date, for the grant of every kind of protection available and, where applicable, for the grant of both regional and national patents.	
VI-1	Priority claim of earlier national application	
VI-1-1	Filing date	12 August 2005 (12.08.2005)
VI-1-2	Number	2005-234405
VI-1-3	Country	JP
VI-2	Priority claim of earlier national application	
VI-2-1	Filing date	07 November 2005 (07.11.2005)
VI-2-2	Number	2005-322531
VI-2-3	Country	JP
VI-3	Priority claim of earlier national application	
VI-3-1	Filing date	18 April 2006 (18.04.2006)
VI-3-2	Number	2006-114937
VI-3-3	Country	JP
VI-4	Priority document request The receiving Office is requested to prepare and transmit to the International Bureau a certified copy of the earlier application(s) identified above as item(s):	VI-1, VI-2, VI-3

PCT REQUEST

VI-5	Incorporation by reference : where an element of the international application referred to in Article 11(1)(iii)(d) or (e) or a part of the description, claims or drawings referred to in Rule 20.5(a) is not otherwise contained in this international application but is completely contained in an earlier application whose priority is claimed on the date on which one or more elements referred to in Article 11(1)(iii) were first received by the receiving Office, that element or part is, subject to confirmation under Rule 20.6, incorporated by reference in this international application for the purposes of Rule 20.6.		
VII-1	International Searching Authority Chosen	Japan Patent Office (ISA/JP)	
VIII	Declarations	Number of declarations	
VIII-1	Declaration as to the identity of the inventor	-	
VIII-2	Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and be granted a patent	-	
VIII-3	Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to claim the priority of the earlier application	-	
VIII-4	Declaration of inventorship (only for the purposes of the designation of the United States of America)	-	
VIII-5	Declaration as to non-prejudicial disclosures or exceptions to lack of novelty	-	
IX	Check list	number of sheets	electronic file(s) attached
IX-1	Request (including declaration sheets)	6	✓
IX-2	Description	86	-
IX-3	Claims	23	-
IX-4	Abstract	1	✓
IX-5	Drawings	0	-
IX-7	TOTAL	116	
	Accompanying Items	paper document(s) attached	electronic file(s) attached
IX-8	Fee calculation sheet	✓	-
IX-9	Original separate power of attorney	✓	-
IX-17	PCT-SAFE physical media	-	✓
IX-19	Figure of the drawings which should accompany the abstract		
IX-20	Language of filing of the international application	Japanese	

PCT REQUEST

X-1	Signature of applicant, agent or common representative	
X-1-1	Name (LAST, First)	TAKASHIMA, Hajime (seal)
X-1-2	Name of signatory	
X-1-3	Capacity	

FOR RECEIVING OFFICE USE ONLY

10-1	Date of actual receipt of the purported international application	
10-2	Drawings:	
10-2-1	Received	
10-2-2	Not received	
10-3	Corrected date of actual receipt due to later but timely received papers or drawings completing the purported international application	
10-4	Date of timely receipt of the required corrections under PCT Article 11(2)	
10-5	International Searching Authority	ISA/JP
10-6	Transmittal of search copy delayed until search fee is paid	

FOR INTERNATIONAL BUREAU USE ONLY

11-1	Date of receipt of the record copy by the International Bureau	
------	--	--

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 INVENCION

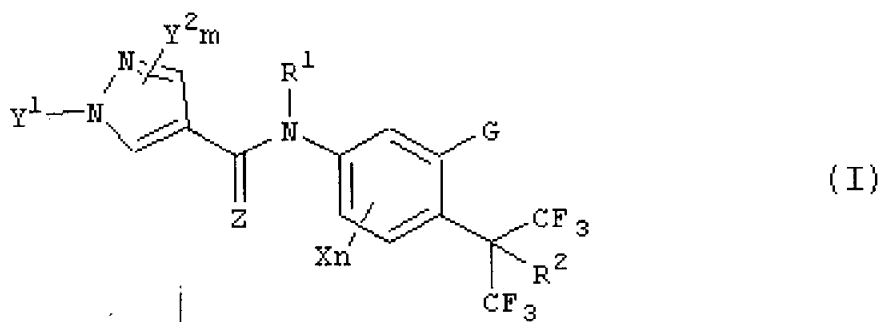
Convencionalmente, los derivados de pirazolcarboxamida sustituidos similares a la presente invención son conocidos por ser útiles como insecticidas agrohortícolas, fungicidas o acaricidas (por ejemplo, JP-A-2003-48878, JP-A-2004-189738 y JP-A-2004-269515). En JP-A-2003-48878, se describen los derivados 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 alcóxido, 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.

BREVE DESCRIPCION DE LA INVENCION

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 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-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 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 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 alcóxido de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxido 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 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

- alcoxicarbonilo de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 39a) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 40a) un grupo haloalquilsulfonilo de C_1-C_6 , 41a) un grupo cianoalquilo de C_1-C_6 , 42a) un grupo fenilalquilo de C_1-C_6 , 43a) un grupo fenilalquilo 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)
- 5 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
- 10 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 , 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 alcóxido de C_1-C_6 , g) un
- 15 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 alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 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 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)
- 25 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 , 48a) un grupo fenoxycarbonilo, 49a) un grupo fenoxycarbonilo 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 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 haloalquiltio de C_1-C_6

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 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 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 , 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 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-alcóxicarbonil de C_1-C_6 aminotio 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

- 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
- 5 dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) grupo un 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)
- 10 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
- 15 alcóxicarbonilo 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 fenoxialcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 71a) un grupo fenoxialcóxicarbonilo 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 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
- 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 , 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 alcóxicarbonil 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
- 30 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
- 5 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-
- 10 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)
- 15 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 , 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que posee,
- 20 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
- 25 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 , 32b) un grupo fenilsulfinilo, 33b) un grupo fenilsulfinilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a)
- 30 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 , 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 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 , 36b) un grupo fenilalcóxilo de C_1-C_6 , o 37b) un grupo fenilalcóxilo 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 alcóxicarbonilo de C_1-C_6 ;

- G es 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} , 2c) un grupo haloalquilo de C_2-C_{10} , 3c) un grupo alqueno de C_3-C_{10} , 4c) un grupo haloalqueno de C_3-C_{10} , 5c) un grupo alquino de C_3-C_{10} , 6c) un grupo haloalquino de C_3-C_{10} , 7c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} , 8c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 9c) un cicloalqueno de C_3-C_{10} , 10c) un grupo cicloalqueno de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 11c) un grupo cicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 , o 12c) un grupo halocicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 ;

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, 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 hidroalquilo 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 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;

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 C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 18f) un grupo hidroxialquilo de C₁-C₆, 19f) un grupo alquilcarboniloxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20f) un grupo cicloalquilo de C₃-C₆, 21f) un grupo halocicloalquilo de C₃-C₆, 22f) un grupo cicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-C₆, 23f) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-C₆, 24f) un grupo alcóxido de C₁-C₆, 25f) un
- 5 grupo haloalcoxido de C₁-C₆, 26f) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcóxido de C₁-C₆, 27f) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alcóxido de C₁-C₆, 28f) un grupo fenilalcóxido de C₁-C₆, 29f) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30f) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 31f) un grupo alquiltio de C₁-C₆, 32f) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, 33f) un grupo alquilsulfínido de C₁-C₆, 34f) un grupo haloalquilsulfínido de C₁-C₆, 35f) un grupo
- 10 alquilsulfonilo de C₁-C₆, 36f) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 37f) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 38f) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 39f) un grupo alquilsulfínido de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 40f) un grupo haloalquilsulfínido de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 41f) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 42f) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 43f) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, 44f)
- 15 un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 45f) un grupo fenilamino, 46f) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 47f) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ 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
- 20 grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcóxido de C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxido 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
- 25 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 50f) un grupo fenóxido, 51f) un grupo fenóxido 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 haloalcoxido 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,
- 30

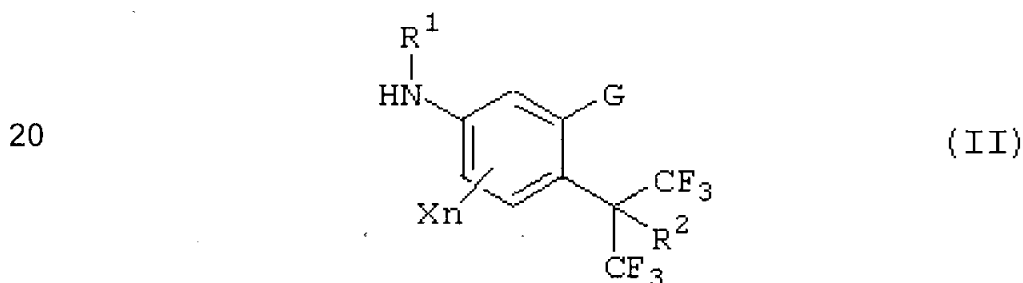
- o) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y
 p) un grupo alcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 52f) un grupo heterocíclico, o 53f) un grupo
 heterocíclico sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o
 diferentes seleccionados de a) un 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
 10 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo 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_8 , 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 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 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 alcoxicarbonilo 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 alcoxicarbonilo de C_1-C_6 , 48a) un grupo fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo 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 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 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 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 , 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 fenoxi de C_1-C_6 alcóxicarbonilo de C_1-C_6 , 71a) un grupo fenoxi de C_1-C_6 alcóxicarbonilo 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 alquilsulfínico de C_1-C_6 , k) un grupo haloalquilsulfínico 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 , 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 alcóxicarbonil 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 alcóxilo de C_1-C_6 , 8b) un grupo haloalcóxilo de C_1-C_6 , 9b) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 10b) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 11b) un grupo alquiltio de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 12b) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 13b) un grupo alquilsulfínico de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 14b) un grupo haloalquilsulfínico de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 15b) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 17b) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 alcóxilo de C_1-C_3 , 18b) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alcóxilo 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 alquilsulfínico de C_1-C_6 , 22b) un grupo haloalquilsulfínico 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 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 alcóxicarbonilo 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 alcóxicarbonilo 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 alcóxicarbonilo 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 alcóxicarbonilo 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 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 ;

G es 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} , 2c) un grupo haloalquilo de C_2-C_{10} , 3c) un grupo alquenilo de C_3-C_{10} , 4c) un haloalquenilo de C_3-C_{10} , 5c) un grupo alquinilo de C_3-C_{10} , 6c) un grupo haloalquinilo de C_3-C_{10} , 7c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} , 8c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 9c) un grupo cicloalquenilo de C_3-C_{10} , 10c) un grupo cicloalquenilo de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 11c) un grupo cicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 , o 12c) un grupo halocicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 ;

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 ;

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.

25

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 C_1-C_6 ", "alcoxilo de C_1-C_6 ", "alquenilo de C_2-C_6 ", "alquinilo de C_2-C_6 " 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 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 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) 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 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
- 5 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
- 10 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 , 68a) un grupo alcóxi de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 73a) un grupo alquilcarbonil de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , o 74a) un grupo alcóxicarbonil de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 , y más preferentemente 1a) un átomo de hidrógeno, 4a) un grupo alquilcarbonilo de C_1-C_6 , 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C_1-C_6 , 17a) un grupo alcóxi de C_1-C_{10} alquilo de C_1-C_6 , 18a)
- 20 un grupo haloalcóxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 31a) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_{16} , 33a) un grupo haloalcóxicarbonilo de C_1-C_6 o 68a) un grupo alcóxi de C_1-C_6 alquilcarbonilo de C_1-C_6 ;

- R^2 es preferentemente 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 o 8b) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 , y más preferentemente 1b) un átomo de hidrógeno o 7b) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 ;
- 25

G es preferentemente 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} , 3c) un grupo alquenilo de C_3-C_{10} , o 11c) un grupo cicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 , y más preferentemente 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} .

- X es preferentemente 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, o 5d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y más preferentemente 1d) un átomo de hidrógeno.
- 30

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 alquenilo de C_2-C_6 , y más preferentemente 2e) un grupo alquilo de C_1-C_6 ;

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 alquiltio 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.

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.

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.).

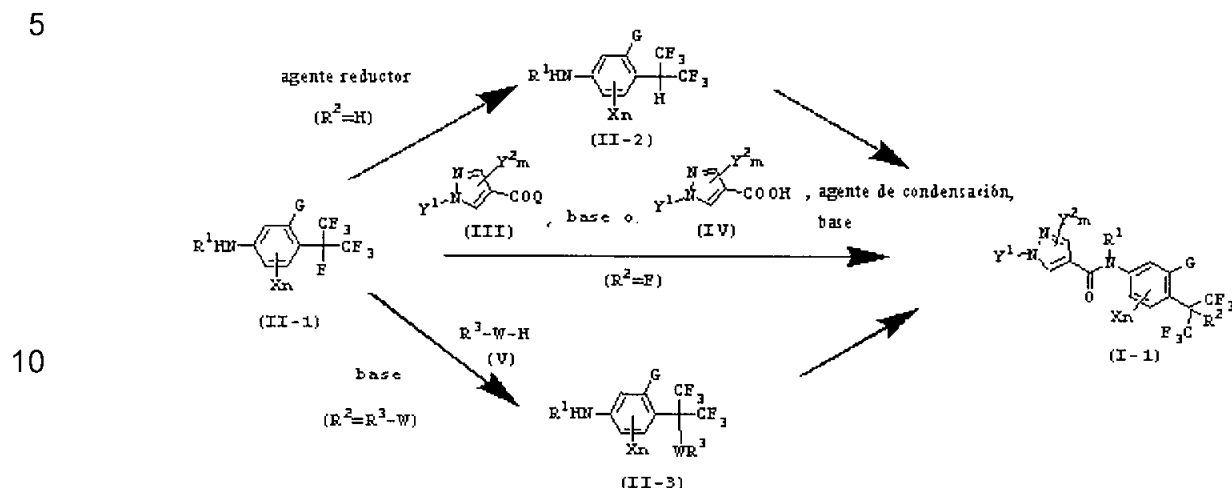
Un derivado de pirazolcarboxanilida sustituido representado por la fórmula (I) o un compuesto intermedio del mismo, es decir un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula (II), de la presente invención pueden contener uno o una pluralidad de centros asimétricos en la fórmula estructural, 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.

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.

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



(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).

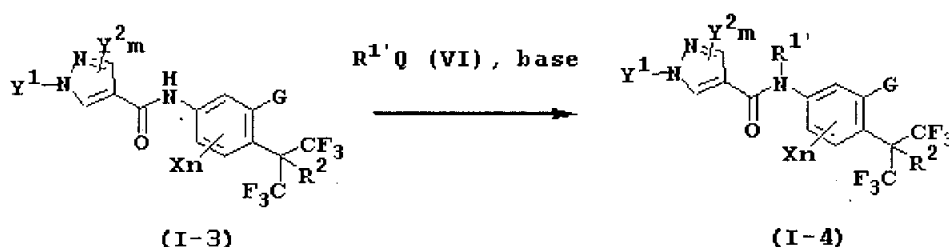
Método de Producción 2



(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)).

Método de Producción 3



(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

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

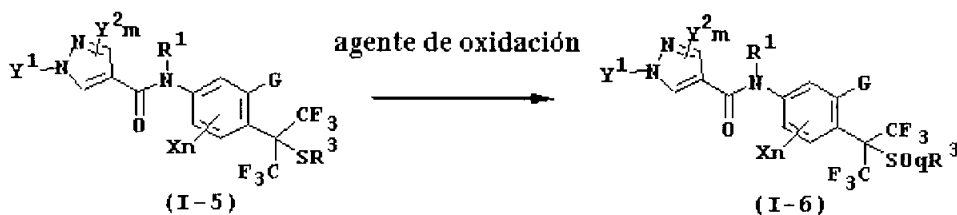
Como un ejemplo de una base a ser usada en la presente reacción se incluyen los hidróxidos de metal tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio y lo similar; los carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato ácido de sodio y lo similar; hidruros de metal tales como 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, 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-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.

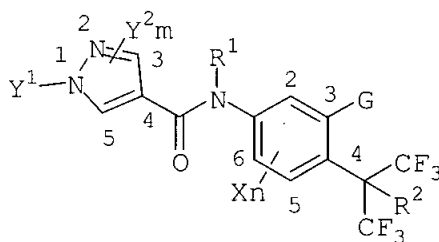
25 Después de la realización de la reacción, el compuesto deseado puede ser aislado de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado puede ser producido por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., si fuera necesario.

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)



(I-4)

CUADRO I

(Xn=H)

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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	
10	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
15	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
20	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)

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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)
10	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	
15	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	
20	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
5	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
10	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	
15	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
20	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
5	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	
10	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	
	1-95	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	83-85
	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	
15	1-100	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
	1-101	i-Bu	Me	3-Me	H	H	141-144
	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)
20	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

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

5

10

15

20

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	

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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	
10	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
15	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)
20	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)

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	

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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	
	1-231	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OMe	
10	1-232	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OEt	130-132
	1-233	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OEt	
	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	
15	1-237	(CH ₂) ₄ Me	Me	3, 5-Me ₂	Ac	OMe	128-130
	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	
20	1-242	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	174-176
	1-243	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	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	174-176
	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	

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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	
10	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	
15	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	
20	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	
	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	

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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	
10	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	
15	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
20	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

5

10

15

20

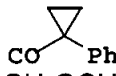
Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-337	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1.4939(26.5)
1-338	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	54
1-339	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH ₂ Ph	OMe	
1-340	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CMe ₂	OMe	1.5091(26.5)
1-341	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH=CHMe	OMe	1.5082(26.5)
1-342	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	COCH 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	COCH ₂ Et 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	COCH ₂ Et 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

	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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)
10	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)
15	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
20	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
5	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
10	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
15	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
20	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)
20	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
5	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)
10	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
15	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
20	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	COCH ₂ Et 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

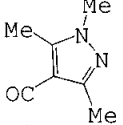
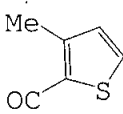
	Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	1-496	n-Pr	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	61.6-62.9
	1-497	n-Pr	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1.4960(22.2)
	1-498	n-Pr	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1.4991(22.1)
	1-499	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1.4864(22.8)
	1-500	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1.4863(22.4)
10	1-501	n-Pr	Me	3, 5-Me ₂	CO-n-Pr	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)
15	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	H ₂ CF 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
20	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
20	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

5

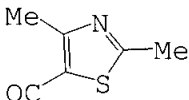
10

15

20

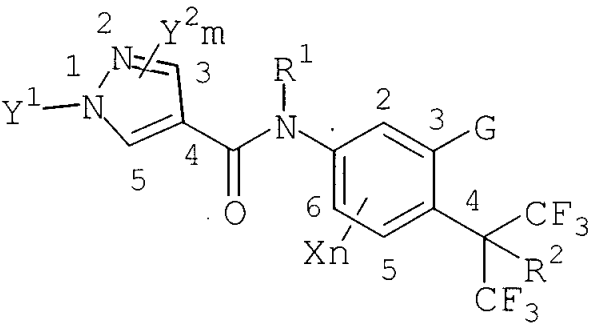
Nro.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
1-523	i-Bu	Me	3-I-5-Me	COOMe	OMe	pasta
1-524	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-525	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ OEt	OMe	100-103
1-526	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	100-102
1-527	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CMe ₂	OMe	81-83
1-528	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-529	i-Bu	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

5

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	

10

Fórmula (I-4)



(I-4)

15

20

CUADRO 2

(Y¹=Me)

5

10

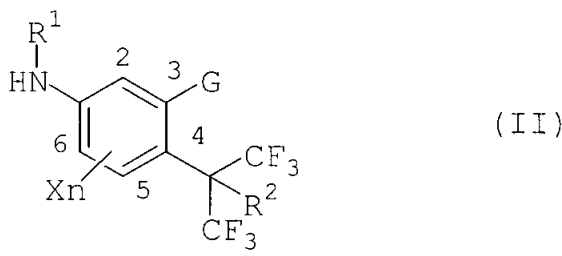
15

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	

20

	Nro.	G	Xn	Y ² _m	R ¹	R ²	Propiedad
5	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
10	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)
15	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)
20	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)



5

CUADRO 3

(R¹=H)

10

15

20

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)

CUADRO 5

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
5	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)
10	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)
15	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)
20	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		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)
	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); 3.40(s; 3H); 2.94(d; 2H); 2.47(s; 3H); 2.14(m; 1H); 0.92(d; 6H)

Nro.	¹ H-RMN[CDCl ₃ /TMS; valor δ (ppm)]
5	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)
10	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)
15	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)
20	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 LEPIDOPTEROS incluyendo tortrix de fruta de verano (Adoxophes orana fasciata), tortrix

10 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 thevivor), Caloptilia sp. (Caloptilia zachrysa), minador de hoja de manzano (Phyllonorycter ringoniella), minador de corteza de peral (Spulerina 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 (Aleuolobus 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 (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 similis; 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 público (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 apariencia 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 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

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 diluido 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, Fenitrotrion, Cianofos, Propafos, Fention, Protiofos, Profenofos, Isofenfos, Temefos, Phentoato, Dimetilvinfos, Clorfenvinfos, Tetraclorvinfos, Foxim, Isoxation, Piraclofos, Metidation, Clorpirifos,

- Clorpirifos-metilo, Piridafention, Diazinon, Pirimifosmetil, Fosadona, Fosmet, Dioxabenzofos, Quinalfos, Terbufos, Etoprofos, Cadusafos, Mesulfenfos, Spiroclufen, 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, Bifénazato, 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, Tiacloprid, Imidacloprid, 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, 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 diluida 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 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=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: $^1\text{H-RMN}[\text{CDCl}_3/\text{TMS}]$ 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-

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 diluida 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).

25

EJEMPLO 7

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

30

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-propilanilina (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 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. El residuo obtenido fue purificado por 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.

10

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)

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; 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 compuesto deseado (139 mg).

25

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)

30

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-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilanilina, la reacción fue realizada durante 3 hr para dar el compuesto deseado.

- 5 Rendimiento: 66%
- Propiedad: punto de fusión 128-131°C.

EJEMPLO 10

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 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%
- 20 Propiedad: punto de fusión 189-190°C.

EJEMPLO 11

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
- 30

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 compuesto deseado (200 mg).

Rendimiento: 69%

Propiedad: n_D 1.4892 (22.4°C).

EJEMPLO 12

10 **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).

Rendimiento: 91%

25 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)

30 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 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, 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 (2.41 g).

Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 148-151°C.

10

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)

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 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 (90 mg).

25

Rendimiento: 28%.

Propiedad: n_D 1.5021 (22.5°C).

PRODUCCION DE EJEMPLO DE REFERENCIA 1

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

30

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 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

15	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
20	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.
25	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

30	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
- 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

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)

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 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.

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%

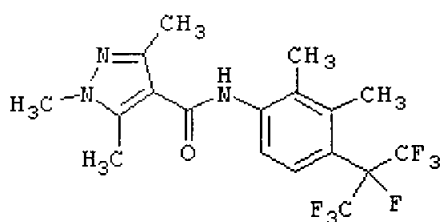
5 B --- Mortalidad corregida 99%-90%

C --- Mortalidad corregida 89%-80%

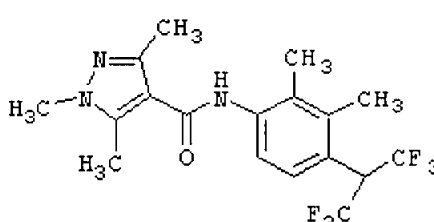
D --- Mortalidad corregida 79%-50%.

Como compuestos comparativos, fueron utilizados los compuestos Nros. 1-163 y 1-164 descritos en JP-A-2003-48878.

10



(1-163)



(1-164)

15

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, 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 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-

25

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

30

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

Según la presente invención, se pueden proveer agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas y acaricidas, que poseen propiedades superiores en
5 comparación a las técnicas convencionales.

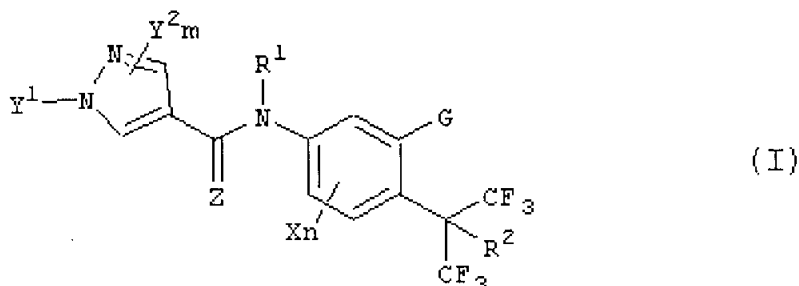
Esta solicitud está basada en las solicitudes de patente Nos. 234405/2005, 322531/2005 y 114937/2006 presentadas en Japón, cuyos contenidos son incorporados a la presente por referencia.

Mientras esta invención se ha ilustrado y se ha descrito con referencia a las
10 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.

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

NOVEDAD DE LA INVENCIONREIVINDICACIONES

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



en donde R¹ es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C₁-C₈, 3a) un 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 alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ grupo, 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-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 halo alquinilo 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 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 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
- 5 p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 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
- 10 alcoxycarbonil 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) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo de C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de
- 15 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
- 20 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 alcóxilo de C₁-C₆, g) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-
- 25 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 heterociclilcarbonilo, 47a) un grupo heterociclilcarbonilo sustituido que posee, en el anillo,
- 30 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
- 5 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 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 C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, f) un grupo alcoxilo de C₁-C₆, g) un
- 10 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, 50a) un grupo
- 15 fenoxialquilcarbonilo de C₁-C₆, 51a) un grupo fenoxialquilcarbonilo sustituido de C₁-C₆ 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
- 20 p) un grupo alcóxicarbonilo de C₁-C₆, 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)
- 25 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, 54a) un grupo
- 30

dialquilfosfono de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 55a) un dialquilfosfonotio de C₁-C₆ grupo en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 56a) un grupo N-alquil de C₁-C₆-N-alcoxycarbonilaminotio de C₁-C₆, 57a) un grupo N-alquil de C₁-C₆-N-alcoxycarbonil de C₁-C₆ alquilaminotio de C₁-C₆, 58a) un grupo dialquilaminotio de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 60a) un grupo halocicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 61a) un grupo alquil de C₁-C₆ cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 62a) un grupo haloalquil de C₁-C₆ cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C₁-C₆, 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo 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, 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, 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 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
- 5 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo 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 alcoxicarbonil 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
- 10 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 C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 12b) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 13b) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 14b) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 15b) un grupo
- 15 alquilsulfonil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 17b) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 18b) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alcoxilo 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
- 20 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
- 25 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
- 30 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo 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 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, 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 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, 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 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, 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 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 C_1-C_6 en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcóxicarbonilo de C_1-C_6 ; G es 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} , 2c) un grupo haloalquilo de C_2-C_{10} , 3c) un grupo alquénilo de C_3-C_{10} , 4c) un grupo haloalquénilo de C_3-C_{10} , 5c) un grupo alquinilo de C_3-C_{10} , 6c) un grupo haloalquinilo de C_3-C_{10} , 7c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} , 8c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 9c) un cicloalquénilo de C_3-C_{10} , 10c) un grupo cicloalquénilo de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 11c) un grupo cicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 , o 12c) un grupo halocicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 ; 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 alquénilo de C_2-C_6 , 5e) un grupo halo alquénilo 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 alcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 9e) un grupo hidroxialquilo de C_1-C_6 , 10e) un grupo alquilcarboniloxi de C_1-C_6 alquilo 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 alquilo de C_1-C_6 , 14e) un grupo halocicloalquil de C_3-C_6 alquilo de C_1-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 alquilo de C_1-C_6 , 18e) un grupo haloalquiltio de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 19e) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 20e) un grupo haloalquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 21e) un grupo alquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 22e) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 23e) un grupo monoalquilamino de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 24e) un grupo dialquilamino de C_1-C_6 alquilo 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 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 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 igual o
- 5 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 del 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 halo alquinilo de C₂-C₆, 15f) un grupo trialquilsilil de C₁-C₆ alquinilo de C₂-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 16f) un grupo fenilalquinilo de C₂-C₆, 17f) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 18f) un grupo hidroxialquilo de C₁-C₆, 19f) un grupo alquilcarboniloxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 20f) un grupo cicloalquilo de C₃-C₆, 21f) un grupo halocicloalquilo de C₃-C₆, 22f) un grupo cicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-C₆, 23f) un grupo halocicloalquil de C₃-C₆ alquilo de C₁-
- 15 C₆, 24f) un grupo alcóxilo de C₁-C₆, 25f) un grupo haloalcóxilo de C₁-C₆, 26f) un grupo alcóxi de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₆, 27f) un grupo haloalcóxi de C₁-C₆ alcóxilo de C₁-C₆, 28f) un grupo fenilalcóxilo de C₁-C₆, 29f) un grupo alcóxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 30f) un grupo haloalcóxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 31f) un grupo alquiltio de C₁-C₆, 32f) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, 33f) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, 34f) un grupo haloalquilsulfinilo de C₁-C₆, 35f) un grupo alquilsulfonilo de C₁-C₆, 36f) un grupo haloalquilsulfonilo de C₁-C₆, 37f) un grupo alquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 38f) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 39f) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 40f) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 41f) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 42f) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alquilo de
- 25 C₁-C₆, 43f) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆, 44f) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 45f) un grupo fenilamino, 46f) un grupo monoalquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 47f) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆ 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
- 30 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 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 , 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 alcoxycarbonilo 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) 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 ; 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 además porque R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 3a) un 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 , 13a) un grupo alquenilo 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 , 29a) un grupo fenilalcoxi 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 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-C_6 , 34a) un grupo alqueniloxycarbonilo de C_2-C_6 , 35a) un grupo alquiltiocarbonilo de C_1-C_6 , 42a) un grupo fenilalquilo de C_1-C_6 , 43a) un grupo fenilalquilo 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 , 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 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 haloalquilsulfonil 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, 48a) un grupo
- 5 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 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 haloalquiltio de C₁-C₆ grupo, j) un grupo alquilsulfinilo de C₁-C₆, k) un grupo
- 10 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, 50a) un grupo fenoxi alquilcarbonilo de C₁-C₆, 51a) un grupo fenoxi alquilcarbonilo sustituido de C₁-C₆ que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes
- 15 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
- 20 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, 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
- 25 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
- 30 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo de C₁-C₆, 58a) un grupo dialquilaminotio de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un

grupo cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 61a) un grupo alquil de C₁-C₆ cicloalquilcarbonilo de C₃-C₆, 63a) un grupo fenilalquilcarbonilo de C₁-C₆, 64a) un grupo fenilalquilcarbonilo 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 alcoxicarbonilo 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 alcoxicarbonilo 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 alcoxicarbonilo de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆, o una sal del mismo.

3.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con la reivindicación 1 o reivindicación 2, caracterizado además porque R² es 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, o una sal del mismo.

4.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado además porque G es 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, o una sal del mismo.

5.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con

cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado además porque X es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, o 5d) un grupo alquilo de C₁-C₆, o una sal del mismo.

6.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado además porque Z es un átomo de oxígeno; Y¹ es 2e) un grupo alquilo de C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o 4e) un grupo alquenilo de C₂-C₆; y Y² es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 9f) un grupo alquilo de C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o 31f) un grupo alquiltio de C₁-C₆, o una sal del mismo.

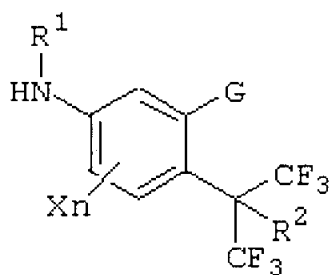
7.- El derivado de pirazolcarboxanilida sustituido de conformidad con la reivindicación 1, caracterizado además porque R¹ es 1a) un átomo de hidrógeno, 4a) un grupo alquilcarbonilo de C₁-C₆, 5a) un grupo haloalquilcarbonilo de C₁-C₆, 17a) un grupo alcoxi de C₁-C₁₀ alquilo de C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₁₆, 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C₁-C₆, o 68a) un grupo alcoxi de C₁-C₆ alquilcarbonilo de C₁-C₆; R² es 1b) un átomo de hidrógeno, o 7b) un grupo alcóxido de C₁-C₆; G es 1c) un grupo alquilo de C₂-C₁₀; Z es un átomo de oxígeno; X es 1d) un átomo de hidrógeno; Y¹ es 2e) un grupo alquilo de C₁-C₆; e Y² puede ser igual o diferente y es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo halógeno, 9f) un grupo alquilo de C₁-C₆, o 10f) un grupo haloalquilo de C₁-C₆, o una sal del mismo.

8.- Un agente agrohortícola que comprende un derivado pirazolcarboxanilida sustituido de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 o una sal del mismo como un ingrediente activo.

9.- El agente agrohortícola de conformidad con la reivindicación 8, caracterizado además porque es un insecticida o acaricida agrohortícola.

10.- Un método de utilización de un agente agrohortícola, que comprende tratar una planta objetivo o suelo con una cantidad eficaz de agente agrohortícola de la reivindicación 8 o 9 para controlar los organismos nocivos de las plantas útiles.

11.- Un derivado de anilina sustituido representado por la fórmula (II):



(II)

- en donde R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C_1-C_8 , 3a) un 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)
- 5 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-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
- 10 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 C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 23a) un grupo alquilsulfinil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 24a) un grupo haloalquilsulfinil 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
- 15 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 fenilalcoxi 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
- 20 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
- 25 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-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
- 30 alcoxycarbonil de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 39a) un grupo alquilsulfonilo de C_1-C_6 , 40a) un grupo haloalquilsulfonil de C_1-C_6 , 41a) un grupo cianoalquilo de C_1-C_6 , 42a) un grupo

- fenilalquilo de C_1-C_6 , 43a) un grupo fenilalquilo 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 , 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 fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo 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
- 5 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
- 10 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 , 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)
- 15 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
- 20 son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxycarbonilo 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
- 25 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
- 30 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) un grupo alcoxicarbonilo 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 alcoxicarbonilo 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 alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 71a) un grupo fenoxi de C₁-C₆ alcoxicarbonilo de C₁-C₆ sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un
- 20 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
- 25 dialquilamino de C₁-C₆ en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, y p) un grupo alcoxicarbonilo de C₁-C₆, 72a) un grupo alquilcarboniloxi de C₁-C₆ alquilo de C₁-C₆, 73a) un grupo alquilcarbonil de C₁-C₆ alquilcarbonilo C₁-C₆, o 74a) un grupo alcoxicarbonil 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
- 30 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 C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 12b) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 13b) un grupo alquilsulfinil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 14b) un grupo haloalquilsulfinil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 15b) un grupo alquilsulfonil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 16b) un grupo haloalquilsulfonil de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 17b) un grupo
- 5 monoalquilamino de C₁-C₆ alcoxilo de C₁-C₃, 18b) un grupo dialquilamino de C₁-C₆ alcoxilo 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-
- 10 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)
- 15 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, 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que posee,
- 20 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
- 25 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, 32b) un grupo fenilsulfinilo, 33b) un grupo fenilsulfinilo sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a)
- 30 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 C₁-C₆, h) un grupo alquiltio de C₁-C₆, i) un grupo haloalquiltio de C₁-C₆, 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 , 34b) un grupo fenilsulfonilo, 35b) un grupo
- 5 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 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
- 10 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 , 36b) un grupo fenilalcóxido de C_1-C_6 , o 37b) un grupo fenilalcóxido de C_1-C_6 sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo
- 15 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
- 20 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 ; G es 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} , 2c) un grupo haloalquilo de C_2-C_{10} , 3c) un grupo alqueno de C_3-C_{10} , 4c) un grupo haloalqueno de C_3-C_{10} , 5c) un grupo alquino de C_3-C_{10} , 6c) un grupo haloalquino de C_3-C_{10} , 7c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} , 8c) un grupo cicloalquilo de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o
- 25 más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 9c) un grupo cicloalqueno de C_3-C_{10} , 10c) un grupo cicloalqueno de C_3-C_{10} sustituido que posee, en el anillo, uno o más sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo halógeno, b) un grupo alquilo de C_1-C_6 , y c) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 , 11c) un grupo cicloalquil de C_3-
- 30 C_8 alquilo de C_1-C_6 , o 12c) un grupo halocicloalquil de C_3-C_8 alquilo de C_1-C_6 ; X puede ser igual o diferente y es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo halógeno, 3d) un grupo

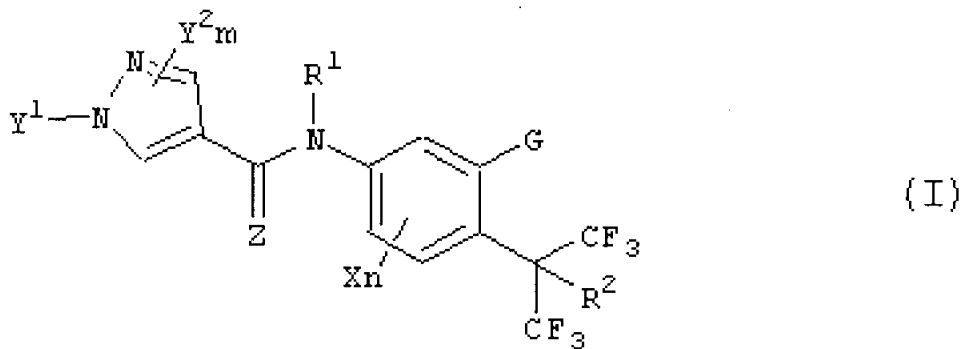
ciano, 4d) un grupo nitro, 5d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , o 6d) un grupo haloalquilo de C_1-C_6 ; n es un entero de valor 1-3, o una sal del mismo.

12.- El derivado de anilina sustituida de conformidad con la reivindicación 11, caracterizado además porque R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo de C_1-C_6 , 3a) un 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 , 17a) un grupo alcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 18a) un grupo haloalcoxi de C_1-C_6 alquilo de C_1-C_6 , 31a) un grupo alcoxicarbonilo de C_1-C_{16} , 33a) un grupo haloalcoxycarbonilo de C_1-C_6 , 44a) un grupo fenilcarbonilo, o 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 alcoxicarbonilo de C_1-C_6 ; R^2 es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo halógeno, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxilo de C_1-C_6 , o 8b) un grupo haloalcoxilo de C_1-C_6 ; G es 1c) un grupo alquilo de C_2-C_{10} ; y X es 1d) un átomo de hidrógeno, o 5d) un grupo alquilo de C_1-C_6 , o una sal del mismo.

13.- Acido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico o una sal del mismo.

RESUMEN DE LA INVENCION

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



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).

20 41B

P08/85F



No. 08-023840- -00000-0000

Fecha: 2008-03-06 13:03:10 Dep. 2020 NUECREACIONE
 Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
 Act. 411 PRESENTACIÓN Folios: 175



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

176

Delegatura de Propiedad Industrial
 División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRÁMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION (X) MODELO DE UTILIDAD ()	(X)	(✓)
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente	(X)	(✓)
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	(X)	(✓)
- Descripción de la invención	(X)	(✓)
- Dibujos de ser estos pertinentes	()	(✓)
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	(X)	(✓)

COMPLETA (X) INCOMPLETA ()

DISEÑO INDUSTRIAL ()

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	()	()
- Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()

COMPLETA () INCOMPLETA ()

EZQUEMA DE TRAZADO ()

- Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud	()	()
- Representación gráfica del Esquema de Trazado	()	()
- Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()

COMPLETA () INCOMPLETA ()

Firma responsable:

Claudia M Nova Cortes

Fecha:

177

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA

REFERENCIA	Radicación No.	8 23840
	Solicitud internacional	PCT/JP2006/316198
	Fecha inicio fase nacional	12/03/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	4209

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

2. La solicitud no contiene el poder debidamente otorgado, con el lleno de los requisitos exigidos por los artículos 63 y subsiguientes del Código de Procedimiento Civil. Adicionalmente, deberá presentar el documento que acredita la existencia y representación legal de la sociedad solicitante, cuando ésta fuere persona jurídica.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 29 MAR. 2008
jfernand