



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 360 337**

51 Int. Cl.:
C07C 317/44 (2006.01)
C07C 323/60 (2006.01)
A01N 37/18 (2006.01)
A01N 41/10 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08792032 .8**
96 Fecha de presentación : **25.07.2008**
97 Número de publicación de la solicitud: **2170817**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **07.04.2010**

54 Título: **Compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor y composición plaguicida que lo contiene.**

30 Prioridad: **26.07.2007 JP 2007-194295**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
03.06.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
03.06.2011

73 Titular/es:
SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
27-1, Shinkawa 2-chome
Chuo-ku, Tokyo 104-8260, JP

72 Inventor/es: **Kumamoto, Koji y**
Miyazaki, Hiroyuki

74 Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 360 337 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor y composición plaguicida que lo contiene

Campo técnico

5 La presente invención se refiere a un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor y a una composición plaguicida que contiene dicho compuesto.

Antecedentes de la invención

10 Hasta el momento, se han desarrollado y utilizado en la práctica muchas composiciones plaguicidas para el control de plagas de artrópodos. Asimismo, en JP-A-2005-179321 se describe determinado compuesto de azufre orgánico con contenido en halógeno.

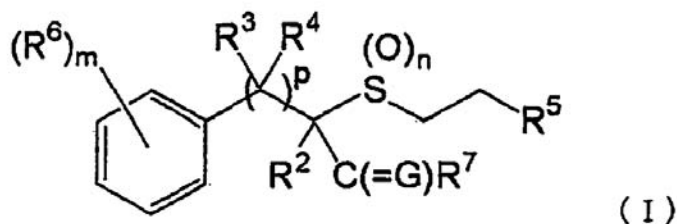
Descripción de la invención

15 Uno de los objetos de la presente invención consiste en proporcionar un nuevo compuesto que posee un excelente efecto de control sobre plagas de artrópodos, y su uso.

20 Los autores de la presente invención han realizado un exhaustivo estudio para encontrar un compuesto que presenta un excelente efecto de control sobre plagas de artrópodos. Como resultado, han observado que un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) que se presenta a continuación, posee un excelente efecto de control sobre plagas de artrópodos, como por ejemplo insectos dañinos y ácaros dañinos. En función de esto, se ha completado la presente invención.

25 Es decir, la presente invención proporciona:

(1) Un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I):



30 en la que G representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
R² representa un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, o un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno;

R³ y R⁴ representan cada uno de ellos independientemente un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 o un átomo de hidrógeno;

35 R⁵ representa un átomo de flúor; o un grupo haloalquilo de C1-C5 que contiene al menos un átomo de flúor;

R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo $-(G^1)_q-R^8$;

R⁷ representa un grupo amino, un grupo alquilamino de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo di(alquilo de C1-C4)amino que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno o un grupo amino cíclico de C2-C5;

40 R⁸ representa un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;

m representa un entero de 0 a 5; siempre y cuando los R⁶ sean opcionalmente iguales o diferentes entre sí cuando m sea de 2 a 5;

n representa un entero de 0 a 2;

p representa 0 ó 1;

45 q representa 0 ó 1; y

G¹ representa un átomo de oxígeno un átomo de azufre, un grupo $-SO-$ o un grupo $-SO_2$ (en adelante denominado "el compuesto de la presente invención").

(2) El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según el punto (1) anterior, en el que p es 0;

50 (3) El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según los puntos (1) o (2) anteriores, en el que G es un átomo de oxígeno,

(4) El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según los puntos (1) ó (2) anteriores en el que G es un átomo de oxígeno y R⁷ es un grupo amino;

(5) El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de los puntos (1) a (4) anteriores, en el que R² es un átomo de halógeno;

55 (6) El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de los puntos (1) a (5) anteriores, en el que n es 2;

- (7) Una composición plaguicida que comprende un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de los puntos (1) a (6) anteriores como ingrediente activo; y
 (8) Un método para el control de una plaga de artrópodos que comprende la aplicación de una cantidad efectiva del compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de los puntos (1) a (6) anteriores sobre una plaga de artrópodos o el lugar en el que habita la plaga de artrópodos.

Modo de realización ilustrativo para llevar a cabo la invención

La expresión "C1-C4" o similar, tal como se utiliza aquí se refiere al número total de átomos de carbono que constituyen cada grupo sustituyente.

Entre los ejemplos de "átomo de halógeno" se incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro y un átomo de bromo.

Entre los ejemplos de "grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno" se incluyen un grupo alquilo de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, como por ejemplo un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo 1-metiletilo (en adelante, denominado en ocasiones un grupo i-propilo), un grupo 1,1-dimetiletilo (en adelante, denominado en ocasiones un grupo t-butilo), un grupo clorometilo, un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, o un grupo 1,1,2,2,2-pentafluoroetilo, un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo vinilo, un grupo 2,2-difluorovinilo, un grupo 1,2,2-trifluorovinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-butenilo, o un grupo 2-butenilo, y un grupo alquino de C2-C4 que está sustituido opcionalmente por un átomo de halógeno, como por ejemplo un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo.

Entre los ejemplos de "grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4" se incluyen un grupo alquilo de C1-C4 como por ejemplo un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo 1-metil etilo (en adelante denominado a veces un grupo i-propilo) o un grupo 1,1-dimetiletilo (en adelante en ocasiones denominado un grupo t-butilo), un grupo alqueno de C2-C4, como por ejemplo un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-butenilo o un grupo 2-butenilo; un grupo alquino de C2-C4, como por ejemplo un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo o un grupo 3-butinilo.

Entre los ejemplos de "grupo haloalquilo de C1-C5 que contiene al menos un átomo de flúor" se incluyen un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 1,1-difluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 1,1,2,2,2-pentafluoroetilo, un grupo 1-fluoropropilo, un grupo 1,1-difluoropropilo, un grupo 2-fluoropropilo, un grupo 2,2-difluoropropilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3,3-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-(1-trifluorometil)etilo, un grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-trifluoro-(1-trifluorometil)etilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluoropropilo, un grupo 2-fluorobutilo, un grupo 1,1-difluoro butilo, un grupo 2-fluorobutilo, un grupo 2,2-difluorobutilo, un grupo 3-fluorobutilo, un grupo 3,3-difluorobutilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4,4-difluorobutilo, un grupo 4,4,4-trifluorobutilo, un grupo 3,3,4,4,4-pentafluorobutilo, un grupo 2,2,3,4,4-pentafluorobutilo, un grupo 2,2,3,3,4,4,4-heptafluorobutilo, un grupo 1-fluoropentilo, un grupo 1,1-difluoropentilo, un grupo 2-fluoropentilo, un grupo 2,2-difluoropentilo, un grupo 3-fluoropentilo, un grupo 3,3-difluoropentilo, un grupo 4-fluoropentilo, un grupo 4,4-difluoropentilo, un grupo 5-fluoropentilo, un grupo 5,5-difluoropentilo, un grupo 5,5,5-trifluoropentilo, un grupo 4,4,5,5,5-pentafluoropentilo, un grupo 3,3,4,4,5,5,5-heptafluoropentilo, un grupo 2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentilo y un grupo 2,2,3,3,4,4,5,5,5-nonafluoropentilo.

Entre los ejemplos de "grupo $-(G^1)q-R^8$ en el que q es 0 se incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo 1-metiletilo, un grupo 1-etiletilo, un grupo 1,1-dimetiletilo, un grupo propilo, un grupo 1-metilpropilo, un grupo butilo, un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo yodometilo, un grupo difluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo pdiclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo 1-cloroetilo, un grupo 1-bromoetilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-cloroetilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 1-fluoro-1-metiletilo, un grupo 1-cloro-1-metiletilo, un grupo 2-cloro-1,1-dimetiletilo, un grupo 2-fluoro-1,1-dimetiletilo, un grupo heptafluoropropilo, un grupo 1,1,2,2,3,3-hexafluoropropilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo vinilo, un grupo 1-metilvinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 1-metil-1-propenilo, un grupo 2-metil-1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 2,2-difluorovinilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 2-bromo-2-propenilo, un grupo 3,3-dibromo-2-propenilo, un grupo 2-fluoro-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-propinilo.

Entre los ejemplos de "grupo $-(G^1)q-R^8$ en el que q es 1 y G^1 es un átomo de oxígeno se incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo bromodifluorometoxi, un grupo difluorometoxi,

un grupo clorodifluorometoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, y un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi.

5 Entre los ejemplos de "grupo $-(G^1)q-R^8$ " en el que q es 1 y G^1 es un átomo de azufre se incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo trifluorometiltio, un grupo clorodifluorometiltio, un grupo bromodifluorometiltio, un grupo dibromodifluorometiltio, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetiltio, y un grupo pentafluoroetiltio.

10 Entre los ejemplos de "grupo $-(G^1)q-R^8$ " en el que q es 1 y G^1 es un grupo $-SO-$ se incluyen un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, y un grupo trifluorometilsulfinilo.

Entre los ejemplos de "grupo $-(G^1)q-R^8$ " en el que q es 1 y G^1 es un grupo $-SO_2-$ se incluyen un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, y un grupo trifluorometilsulfonilo.

15 Entre los ejemplos de "grupo alquilamino de C1-C4" que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno" se incluye un grupo N-metilamino, un grupo N-etilamino, un grupo N-propilamino, un grupo N-(1-metiletil)amino y un grupo N-2,2-trifluoroetil)amino.

20 Entre los ejemplos de "grupo di(alquilo de C1-C4)amino que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno" se incluyen un grupo N,N-dimetilamino, un grupo N-etil-N-metilamino, un grupo N,N-dietilamino, un grupo N-metil-N-propilamino, un grupo N-etil-N-propilamino, un grupo N,N-dipropilamino, un grupo N-metil-N-(1-metiletil)amino, un grupo N-etil-N-(1-metiletil)amino, un grupo N,N-di(1-metiletil)amino, un grupo N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)amino, un grupo N-etil-N-(2,2,2-trifluoroetil)amino.

25 Entre los ejemplos de "grupo amino cíclico de C2-C5" se incluyen un grupo 1-aziridino, un grupo 1-azetidino, un grupo 1-pirrolidino, un grupo 1-piperidino, un grupo 1-morfolino.

Entre los ejemplos específicos del compuesto de la presente invención se incluyen:

30 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno;

35 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno y R^7 es un grupo alquilamino de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno o un grupo di(alquilo de C1-C4)amino que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;

un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno y R^7 es un grupo amino;

40 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre;

45 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre y R^7 es un grupo alquilamino de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno o un grupo di(alquilo de C1-C4)amino que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;

un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre y R^7 es un grupo amino;

50 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un grupo alquilo de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente por un átomo de halógeno, un grupo alquino de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un átomo de halógeno o un grupo hidrógeno;

55 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que en el que R^2 es un átomo de hidrógeno

un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un átomo de halógeno;

60 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un átomo de flúor o cloro,

65 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;

- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un grupo alquilo de C1-C4 que está sustituido opcionalmente por un átomo de halógeno;
- 5 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que en el que R^2 es un grupo metilo;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que en el que R^2 es un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno,
- 10 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que en el que R^3 y R^4 son independientemente un grupo alquilo de C1-C4 o un átomo de hidrógeno;
- 15 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^3 y R^4 son átomos de hidrógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^3 y R^4 son grupos hidrocarburo de cadena de C1-C4;
- 20 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^3 y R^4 son grupos alquilo de C1-C4;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un grupo alquilo de C1-C4 y R^4 es un átomo de hidrógeno;
- 25 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un grupo metilo y R^4 es un átomo de hidrógeno;
- 30 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^5 es un átomo de flúor;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^5 es un grupo haloalquilo de C1-C5 que contiene al menos un átomo de flúor;
- 35 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^5 es un grupo fluorometilo;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^5 es un grupo trifluorometilo;
- 40 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^5 es un grupo 1,1,2,2,2-pentafluoroetilo;
- 45 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^5 es un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropilo;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que R^6 es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitrilo, un grupo alquilo de C1-C4 que está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente por un átomo de halógeno, un grupo alcoxi de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo alquiltio de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo alquilsulfinilo de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo alquilsulfonilo de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;
- 55 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0;
- 60 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 1;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1;
- 65 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1 y R^6 es un átomo de cloro como sustituyente en la posición 4-;

- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1 y R^6 es un átomo de halógeno como sustituyente en la posición 4-;
- 5 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1 y R^6 es un grupo trifluorometilo como sustituyente en la posición 4-;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1 y R^6 es un grupo etinilo como sustituyente en la posición 4-;
- 10 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1 y R^6 es un grupo nitro como sustituyente en la posición 4-;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 1 y R^6 es un grupo ciano como sustituyente en la posición 4-;
- 15 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 2;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 2 y uno de los R^6 es un átomo de halógeno como sustituyente en la posición 4-;
- 20 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 3;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 3 y uno de los R^6 es un átomo de halógeno como sustituyente en la posición 4-;
- 25 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 3 y todos los R^6 son átomos de halógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 4;
- 30 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que m es 5;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que n es 0;
- 35 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que n es 1;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que n es 2;
- 40 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno, R^7 es un grupo amino y R^2 es un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno, R^7 es un grupo amino y R^2 es un grupo metilo;
- 45 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno, R^7 es un grupo amino y R^2 es un átomo de halógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de oxígeno, R^7 es un grupo amino y R^2 es un átomo de flúor o cloro;
- 50 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre, R^7 es un grupo amino y R^2 es un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre, R^7 es un grupo amino y R^2 es un grupo metilo;
- 55 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre, R^7 es un grupo amino y R^2 es un átomo de halógeno;
- un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que G es un átomo de azufre, R^7 es un grupo amino y R^2 es un átomo de flúor o cloro;
- 60 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de oxígeno, R^7 es un grupo amino, y R^2 es un átomo de hidrógeno;
- 65

un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de oxígeno, R⁷ es un grupo amino y R² es un grupo metilo;

5 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de oxígeno, R⁷ es un grupo amino, y R² es un átomo de halógeno;

un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de oxígeno, R⁷ es un grupo amino, y R² es un átomo de flúor o cloro;

10 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de azufre, R⁷ es un grupo amino, y R² es un átomo de hidrógeno;

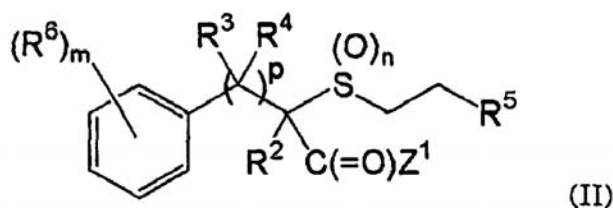
un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de azufre, R⁷ es un grupo amino, y R² es un grupo metilo;

15 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de azufre, R⁷ es un grupo amino y R² es un átomo de halógeno y

20 un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I) en el que p es 0, G es un átomo de azufre, R⁷ es un grupo amino y R² es un átomo de flúor o cloro.

Asimismo, la presente invención proporciona un compuesto intermedio para producir el compuesto de la presente invención (en adelante denominado compuesto intermedio de la presente invención) que es útil en un proceso para producir el compuesto de la presente invención tal como se describe más adelante en el método descrito a continuación, y que está representado por la siguiente fórmula (II):

25



en la que Z¹ representa un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo o un grupo alcoxi de C1-C5;

30 R² representa un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno;

R³ y R⁴ representan independientemente un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 o un átomo de hidrógeno;

R⁵ representa un grupo haloalquilo de C1-C5 que contiene al menos un átomo de flúor, o un átomo de flúor;

R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo -(G¹)_q-R⁸;

35 R⁸ representa un átomo de hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;

m representa un entero de 0 a 5; siempre y cuando los R⁶ sean iguales o diferentes entre sí distintos cuando m sea 2 a 5;

n representa un entero de 0 a 2;

p representa 0 ó 1;

40 q representa 0 ó 1; y

G¹ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo -SO- o un grupo -SO₂.

Entre los ejemplos específicos del compuesto intermedio de la presente invención se incluyen:

45 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que Z¹ es un átomo de halógeno;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que Z¹ es un grupo hidroxilo;

50 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que Z¹ es un grupo alcoxi de C1-C5;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que Z¹ es un grupo metoxi;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R² es un átomo de hidrógeno;

55 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R² es un átomo de halógeno;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R² es un átomo de flúor o cloro;

- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^2 es un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;
- 5 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^2 es un grupo alquilo de C1-C4 que está sustituido opcionalmente por un átomo de halógeno;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^2 es un grupo metilo;
- 10 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^2 es un grupo alqueno de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno,
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^2 es un grupo alquino de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;
- 15 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^3 y R^4 son átomos de hidrógeno;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^3 y R^4 son grupos hidrocarburo de cadena de C1-C4;
- 20 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^3 y R^4 son grupos alquilo de C1-C4;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^3 es un grupo alquilo y R^4 es un átomo de hidrógeno;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^3 es un grupo metilo, y R^4 es un átomo de hidrógeno;
- 25 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^5 es un átomo de flúor;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^5 es un grupo haloalcoxi de C1-C5 que contiene al menos un átomo de flúor;
- 30 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^5 es un grupo fluorometilo;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^5 es un grupo trifluorometilo;
- 35 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^5 es un grupo 1,1,2,2,2-pentafluoroetilo;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R^5 es un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropilo;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que p es 0;
- 40 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que p es 1;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1;
- 45 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1, y R^6 es un átomo de cloro como sustituyente en la posición 4-;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1, y R^6 es un átomo de halógeno como sustituyente en la posición 4-;
- 50 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1 y R^6 es un grupo trifluorometilo como sustituyente en la posición 4-;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1, y R^6 es un grupo etinilo como sustituyente en la posición 4-;
- 55 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1, y R^6 es un grupo nitro como sustituyente en la posición 4-;
- 60 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 1, y R^6 es un grupo ciano como sustituyente en la posición 4-;
- un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 2;
- 65 un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 2 y uno de los R^6 es un átomo de halógeno como sustituyente en la posición 4-;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 3;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 3, y uno de los R^6 es un átomo de halógeno como sustituyente en la posición 4-;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 3, y todos los R^6 son átomos de halógeno,

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 4;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que m es 5;

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que n es 0;

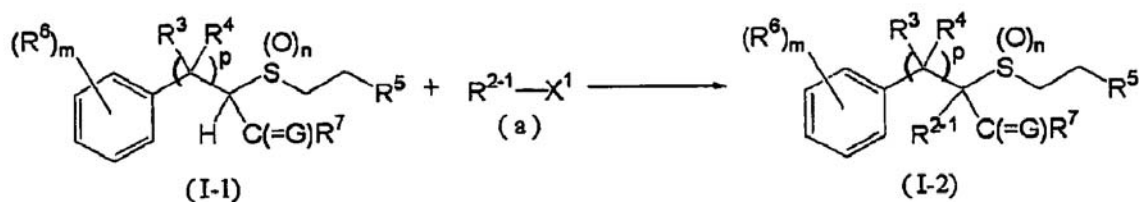
un compuesto representado por la fórmula (II) en el que n es 1; y

un compuesto representado por la fórmula (II) en el que n es 2.

A continuación, se explica el proceso para producir el compuesto de la presente invención.

Proceso de producción 1

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (I-2) (en adelante denominado compuesto (I-2) que es el compuesto de la presente invención en el que R^2 es un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (I-1) (en adelante denominado compuesto (I-1)) con un compuesto representado por la fórmula (a) (en adelante denominado compuesto (a)) tal como se muestra a continuación:



donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G, p, m y n son como se han definido antes, R^{2-1} representa un grupo alquilo de C1-C4, un grupo alquenilo de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, o un grupo alquinilo de C2-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, y X^1 representa un grupo saliente, como por ejemplo un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metanosulfonilo, un grupo p-toluensulfonilo o un grupo trifluorometanosulfonilo.

La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de una base en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano o dimetoxietano, amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos alifáticos como hexano o heptano, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, hidrocarburos halogenados como 1,2-dicloroetano o clorobenceno, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino, como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de la base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada mol del compuesto (I-1).

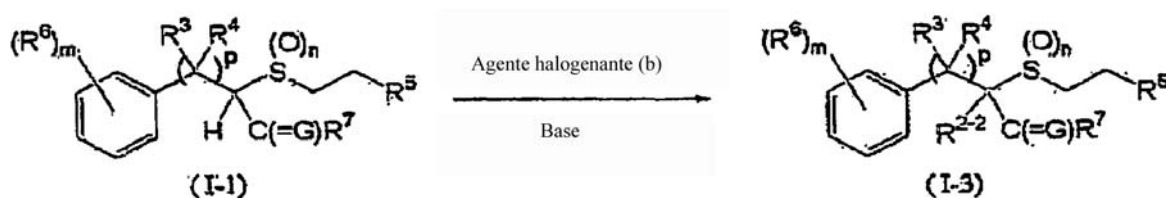
La cantidad del compuesto (a) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (I-1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente en el intervalo de -50 a 100°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-2), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-2) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 2

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (I-3) (en adelante denominado compuesto (I-3) que es el compuesto de la presente invención en el que R^2 es un átomo de halógeno, haciendo reaccionar el compuesto (I-1) con un agente halogenante (b) en presencia de una base tal como se muestra a continuación:



en la que R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G, p, m y n son como se han definido antes, y R^{2-2} representa un átomo de halógeno.

La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de una base en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano o dimetoxietano, amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos alifáticos como hexano o heptano, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, hidrocarburos halogenados como 1,2-dicloroetano o clorobenceno, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino, como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (I-1).

Entre los ejemplos de agente halogenante (b) utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como tetracloruro de carbono o hexacloroetano, halógenos como flúor, cloro, bromo o yodo, succinimida N-halogenada como N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, o N-yodosuccinimida, sales de N-fluoropiridinio como sulfonato de 1-fluoro-2,4,6-trimetilpiridinio trifluorometano, o bistetrafluoroborato de 1,1'-difluoro-2,2'-bipiridinio y sales inorgánicas como cloruro de cobre (II) o bromuro de cobre (II).

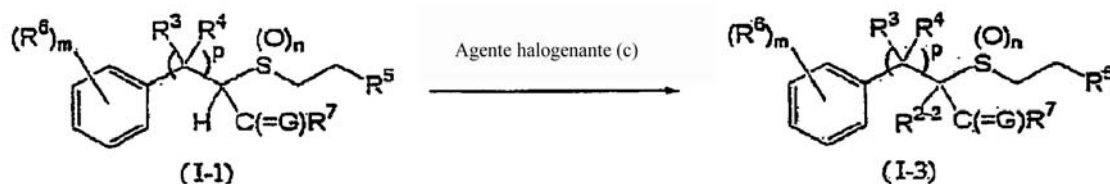
La cantidad de agente halogenante (b) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (I-1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente en el intervalo de -100 a 100°C , y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-3), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-3) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 3

Se puede producir el compuesto (I-3) haciendo reaccionar el compuesto (I-1) con un agente halogenante (c) tal como se muestra a continuación:



donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{2-2} , G, p, m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente sin disolvente o en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, diclorometano o diclorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, nitrilos alifáticos como acetonitrilo o propionitrilo, ácidos carboxílicos alifáticos como ácido acético, sulfuro de carbono, agua, y una mezcla de los mismos.

Entre los ejemplos de agente halogenante (c) utilizados en la reacción se incluyen halógenos como flúor, cloro, bromo, o yodo, haluro de hidrógeno como fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno o yoduro de hidrógeno, compuestos de haluro de azufre, como cloruro de tionilo, bromuro de tionilo o cloruro de sulfonilo y compuestos de haluro de fósforo como tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo, pentacloruro de fósforo o oxiclorigenato de fósforo.

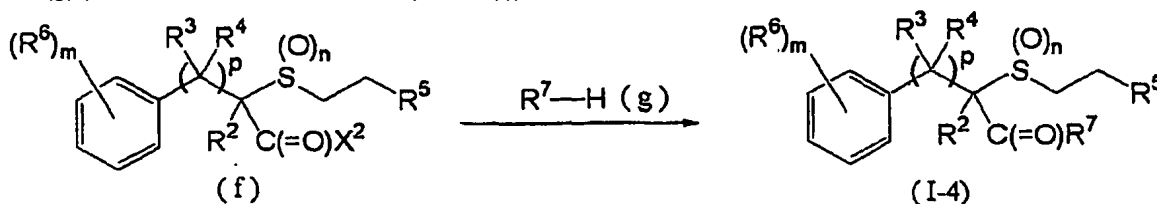
La cantidad de agente halogenante (c) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada mol del compuesto (I-1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -100 a 200°C y el tiempo de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-3), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-3) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 4

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (I-4) (en adelante denominado compuesto (I-4)) que es el compuesto de la presente invención en el que G es un átomo de oxígeno, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (f) (en adelante denominado compuesto (f)) con un compuesto representado por la fórmula (g) (en adelante, denominado compuesto (g)) tal como se muestra a continuación:



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , p , m y n son como se han definido antes, y X^2 representa un átomo de halógeno.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente, en presencia de una base.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico o tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (f).

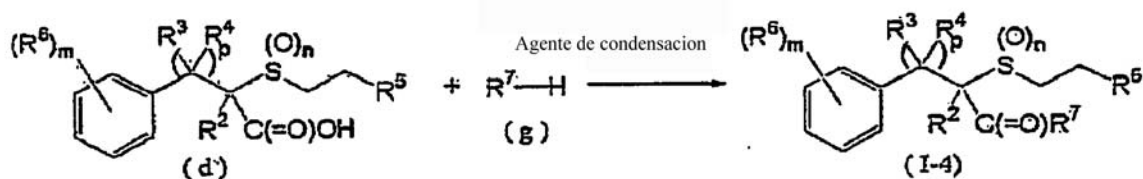
La cantidad de compuesto (g) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (f).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 a 100°C , y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-4), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-4) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 5

Se puede producir el compuesto (I-4) haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (d) (en adelante denominado compuesto (d)) con el compuesto (g) tal como se muestra a continuación:



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , p , m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de un agente de condensación en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico o tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno e hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno.

Entre los ejemplos de agentes de condensación utilizados en la reacción se incluyen dicitohexilcarbodiimida, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida y carbonildimidazol.

La cantidad del agente de condensación utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (d).

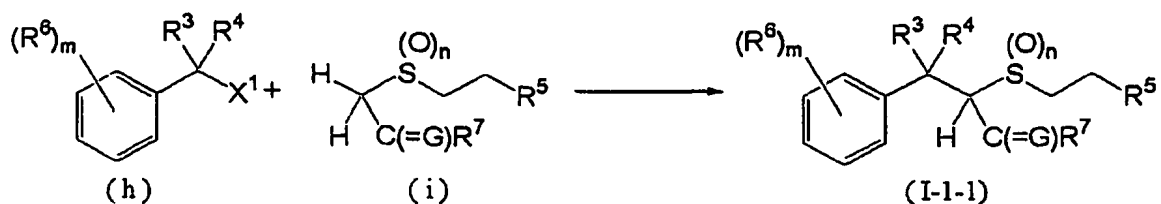
La cantidad del compuesto (g) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (d).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 y 100°C , y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-4), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-4) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Ejemplo de producción 6

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (I-1-1) (en adelante denominado compuesto (I-1-1)) que es el compuesto de la presente invención en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y p es 1, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (h) (en adelante denominado compuesto (h)) con un compuesto representado por la fórmula (i) (en adelante, denominado compuesto (i)) tal como se muestra a continuación:



donde R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G , X^1 , m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de una base en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, agua y una mezcla de los mismos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino, como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, amidas de metal alcalino como diisopropilamida de litio, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (i).

5 La cantidad del compuesto (h) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (i).

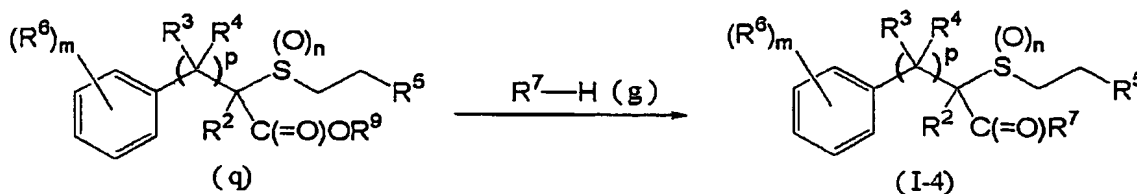
La temperatura de reacción está comprendida normalmente en el intervalo de -100 a 100°C , y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

10 Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-1), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-1) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

15 **Proceso de producción 7**

Se puede producir el compuesto (I-4) por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (q) (en adelante denominado compuesto (q)) con un compuesto (g) tal como se muestra a continuación:

20



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , p , m y n son como se han definido antes, y R^9 representa un grupo alquilo de C1-C5.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente.

25 Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, y alcoholes como metanol o etanol.

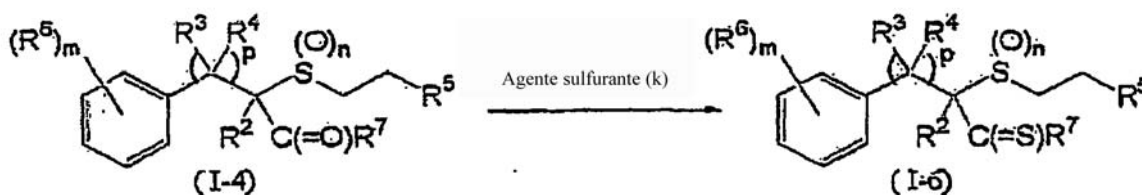
30 La cantidad del compuesto (g) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q).

35 La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 a 100°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

40 Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-4), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-4) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 8

45 Se puede producir el compuesto representado por la fórmula (I-6) (en adelante denominado compuesto (I-6)) que es el compuesto de la presente invención en el que G es un átomo de azufre, haciendo reaccionar el compuesto (I-4) con un agente sulfurante (k) tal como se muestra a continuación:



50 donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , p , m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, e hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno.

Entre los ejemplos de agentes sulfurantes (k) utilizados en la reacción se incluyen compuestos de azufre inorgánicos como sulfuro de hidrógeno o pentasulfuro de difósforo, y compuestos de azufre orgánicos como 2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano.

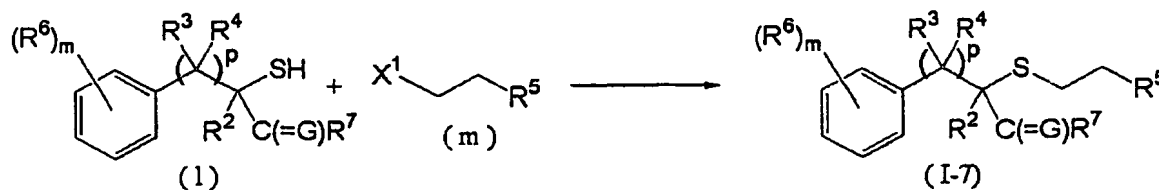
La cantidad de agente sulfurante (k) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 0,5 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (I-4).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente en el intervalo de 0 a 250°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 72 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-6), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-6) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 9

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (1-7) (en adelante denominado compuesto (1-7)), que es el compuesto de la presente invención en el que n es 0, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (1) (en adelante denominado compuesto (1)) con un compuesto representado por la fórmula (m) (en adelante denominado compuesto (m)) tal como se muestra a continuación:



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G , X^1 , p y m son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de una base en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, alcoholes como metanol o etanol, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino, como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, amidas de metal alcalino como diisopropilamida de litio y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (1).

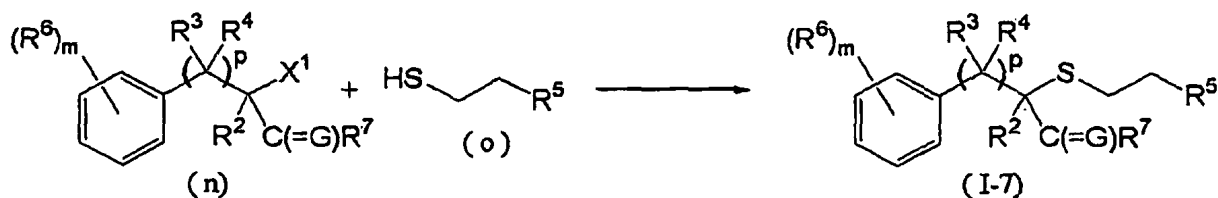
La cantidad del compuesto (m) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente entre -20 y 100°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-7), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-7) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 10

Se puede producir el compuesto (1-7) haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (n) (en adelante denominado compuesto (n)) con un compuesto representado por la fórmula (o) (en adelante denominado como compuesto (o)) tal como se muestra a continuación:



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G , X^3 , p y m son como se han definido antes.

10 La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de una base en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolventes utilizados en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo y diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, alcoholes como metanol o etanol, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino, como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, amidas de metal alcalino como diisopropiolamida de litio y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (n).

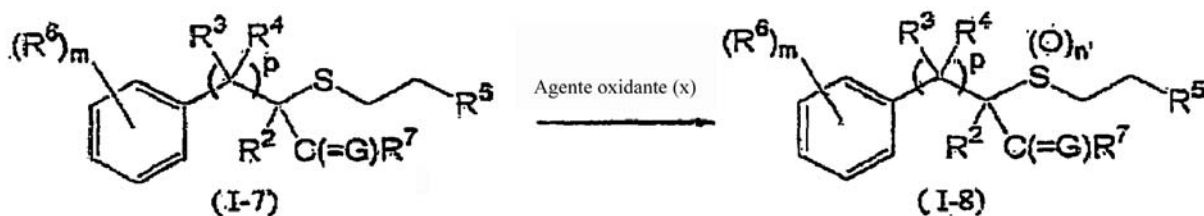
25 La cantidad del compuesto (o) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (n).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 a 100°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-7), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-7) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de producción 11

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (I-8) (en adelante denominado compuesto (I-8) que es el compuesto de la presente invención en el que n es 1 ó 2, haciendo reaccionar el compuesto (I-7) con un agente oxidante (x) tal como se muestra a continuación:



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G , p y m son como se han definido antes y n' representa 1 ó 2.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolvente utilizados en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, ácidos carboxílicos alifáticos como ácido acético y ácido trifluoroacético, alcoholes como metanol o etanol, agua y una mezcla de ellos.

5 Entre los ejemplos de agentes oxidantes (x) utilizados en la reacción se incluyen peróxidos orgánicos como ácido peracético, ácido trifluoroperacético o ácido m-cloroperbenzoico, halógenos como cloro o bromo, imidas con contenido en halógeno como N-clorosuccinimida, haluros como ácido perclórico (o una sal del mismo) o ácido peryódico (o una sal del mismo).

La cantidad de agente oxidante (x) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (I-7).

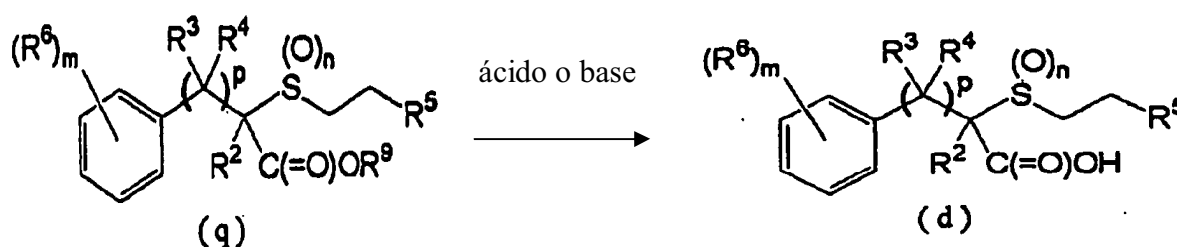
10 La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -50 a 200°C y el período de reacción es normalmente de 1 a 72 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (I-8), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. 15 Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (I-8) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

A continuación, se explican procesos de referencia para producir el compuesto intermedio del compuesto de la presente invención. 20

Proceso de referencia 1

Se puede producir el compuesto (d) por hidrólisis del compuesto (q) tal como se muestra a continuación:



25 donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , p , m y n son como se han definido antes.

30 La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente orgánico en presencia de un ácido o una base, y agua.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas, éteres como éter dietílico o tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, hidrocarburos alifáticos como ácido acético o ácido fórmico, alcoholes como metanol o etanol, y una mezcla de ellos. 35

Entre los ejemplos de base utilizada en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidróxido sódico o hidróxido potásico.

Entre los ejemplos de ácido utilizado en la reacción se incluyen ácidos inorgánicos como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico. 40

La cantidad de ácido o base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q).

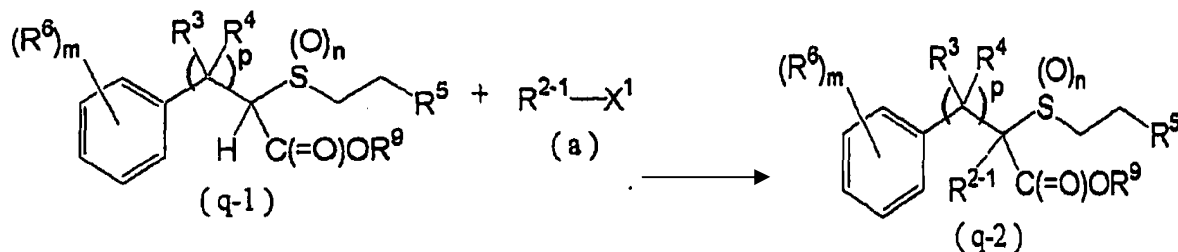
45 La temperatura de reacción está comprendida normalmente en el intervalo de -20 y 100°C , y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (d), por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, a continuación, si es necesario, añadiendo agua y/o un ácido a la mezcla de reacción, seguido de concentración. Posteriormente, se puede purificar el compuesto aislado (d) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario. 50

Proceso de referencia 2

55 Se puede producir el compuesto representado por la fórmula (q-2) (en adelante denominado compuesto (q-2)) que es el compuesto (q) en el que R^2 es un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente

con un átomo de halógeno, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (q-1) (en adelante denominado compuesto (q-1)) que es el compuesto (q) en el que R^2 es un átomo de hidrógeno, con el compuesto (a) tal como se muestra a continuación:



10 en la que R^{2-1} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , X^1 , p, m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en presencia de una base en un disolvente.

15 Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano o dimetoxietano, amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos alifáticos, como hexano o heptano, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, hidrocarburos halogenados como 1,2-dicloroetano o clorobenceno, agua y una mezcla de ellos.

20 Entre los ejemplos de base utilizada en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino, como metóxido sódico o terc-butóxido potásico y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q-1).

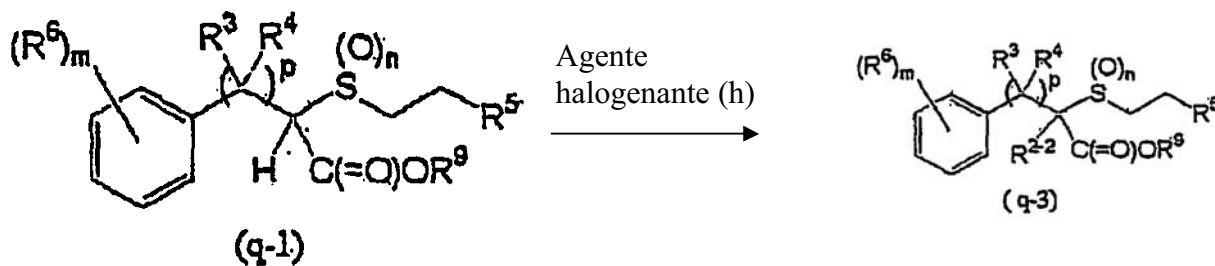
25 La cantidad de compuesto (a) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q-1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -50 a 100°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

30 Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-2), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-2) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

35 Proceso de referencia 3

40 Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (q-3) (en adelante denominado compuesto (q-3), que es el compuesto (q), en el que R^2 es un átomo de halógeno, haciendo reaccionar el compuesto (q-1) con un agente halogenante (b) en presencia de una base tal como se muestra a continuación:



45 en la que R^{2-2} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , p, m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen éteres como éter dietílico, tetrahidrofurano o dimetoxietano, amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos alifáticos como hexano o heptano, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, hidrocarburos halogenados como 1,2-dicloroetano o clorobenceno, agua y una mezcla de los mismos.

Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidróxido sódico, hidróxido potásico o carbonato potásico, alcóxidos de metal alcalino como metóxido sódico o terc-butoxido potásico, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo-[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q-1).

Entre los ejemplos de agente halogenante (b) utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como tetracloruro de carbono hexacloroetano, halógenos como flúor, cloro, bromo o yodo, succinimida N-halogenada como N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida o N-yodosuccinimida, sales de N-fluoropiridinio como trifluorometano sulfonato de 1-fluoro-2,4,6-trimetilpiridinio o bistetrafluoroborato de 1,1'-difluoro-2,2'-bipiridinio y sales inorgánicas como cloruro de cobre (II) o bromuro de cobre (II).

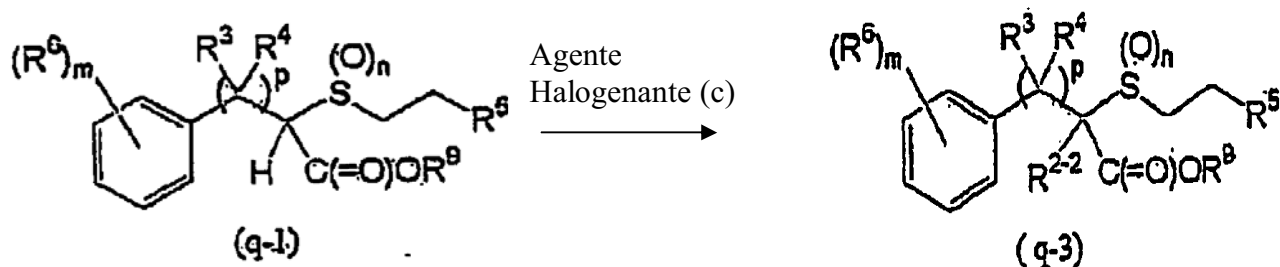
La cantidad de agente halogenante (b) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q-1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -100 a 100°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-3), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-3) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

Proceso de referencia 4

Se puede producir el compuesto (q-3) haciendo reaccionar el compuesto (q-1) con el agente halogenante (c) tal como se muestra a continuación:



en la que R^{2-2} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , p, m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente con o sin disolvente.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, nitrilos alifáticos como acetonitrilo o propionilo, ácidos carboxílicos alifáticos como ácido acético, disulfuro de carbono, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de agente halogenante (c) utilizado en la reacción se incluyen halógenos como flúor, cloro, bromo, o yodo, haluro de hidrógeno como fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno o yoduro de hidrógeno, compuestos de haluro de azufre como cloruro de tionilo, bromuro de tionilo o cloruro de sulfurilo, y compuestos de haluro de fósforo como tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo, pentacloruro de fósforo u oxiclururo de fósforo.

La cantidad de agente halogenante (c) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q-1).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -100 a 200°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

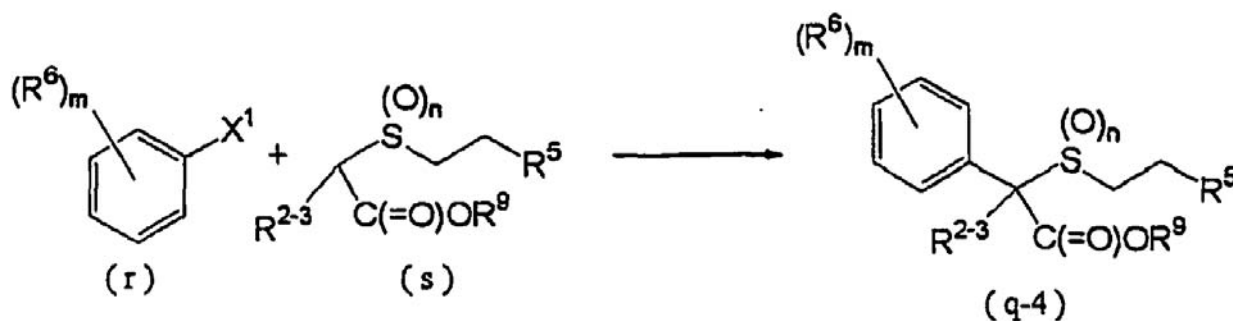
Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-3), por ejemplo, por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-3) posteriormente por cromatografía, recristalización o similar, si es necesario.

5

Proceso de referencia 5.

10

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (q-4) (en adelante denominado compuesto (q-4)) que es el compuesto (q) en el que R^2 es un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 o un átomo de hidrógeno y p es 0, haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (r) (en adelante denominado compuesto (r)) con un compuesto representado por la fórmula (s) (en adelante denominado compuesto (s)) tal como se muestra a continuación:



15

en la que R^5 , R^6 , R^9 , X^1 , m, n y X son como se han definido antes, y R^{2-3} representa un grupo hidrocarburo de cadena de C1-c4 o un átomo de hidrógeno.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente orgánico en presencia de una base.

20

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, 1,4-dioxano o tetrahydrofurano, y sulfuros orgánicos como sulfoxido de dimetilo o sulfolano.

25

Entre los ejemplos de base utilizada en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato potásico o carbonato de cesio, alcóxidos de metal alcalino como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, y amidas de metal alcalino como diisopropilamida de litio.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

30

La cantidad del compuesto (r) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

35

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 a 200°C , y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

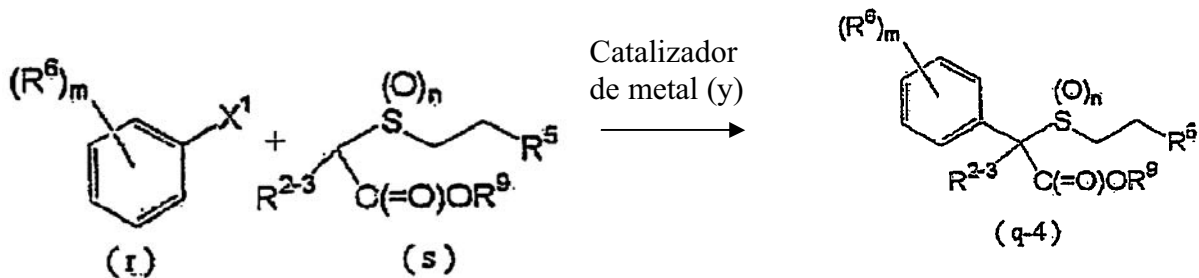
40

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-4) por ejemplo por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-4) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario.

Proceso de referencia 6

45

Se puede producir el compuesto (q-4) haciendo reaccionar el compuesto (r) con el compuesto (s) en presencia de un catalizador de metal (y) tal como se muestra a continuación:



donde R^{2-3} , R^5 , R^6 , R^9 , X^1 , m y n son como se han definido antes.

5 La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente orgánico en presencia de una base y un catalizador.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, 1,4-dioxano o tetrahidrofurano, y azufres orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano.

10 Entre los ejemplos de base utilizada en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sodico, hidróxido potásico, carbonato potásico o carbonato de cesio, alcóxidos de metal alcalino como metóxido sódico o terc-butóxido potásico y amidas de metal alcalino como diisopropilamida de litio.

15 La cantidad de la base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

La cantidad del compuesto (r) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

20 Entre los ejemplos de catalizador de metal (y) utilizado en la reacción se incluyen complejos de paladio como tetraquis(trifenilfosfina)paladio(0) o complejo de tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0)cloroformo., y haluros de cobre (I) como bromuro de cobre (I) o yoduro de cobre (I).

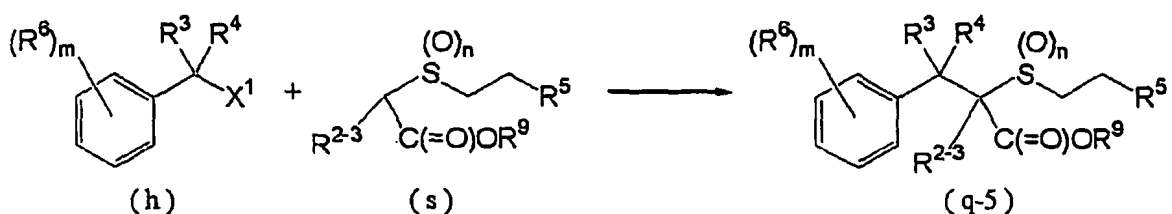
25 La cantidad de catalizador de metal (y) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 0,001 y 0,5 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 a 200°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

30 Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-4) por ejemplo por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-4) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario.

35 Proceso de producción 7

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (q-5) (en adelante denominado compuesto (q-5)) que es el compuesto (q) en el que R^2 es un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 o un átomo de hidrógeno y p es 1, haciendo reaccionar el compuesto (s) con el compuesto (h) tal como se muestra a continuación:



40 en la que R^{2-3} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , X^1 , m y n son como se han definido antes.

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

45 Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, 1,4-dioxano o tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano,

hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, alcoholes como metanol o etanol, agua y una mezcla de los mismos.

Entre los ejemplos de base utilizada en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato potásico o carbonato de cesio, alcóxidos de metal alcalino, como trióxido sódico o terc-butóxido potásico, amidas de metal alcalino como diisopropilamida de litio y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

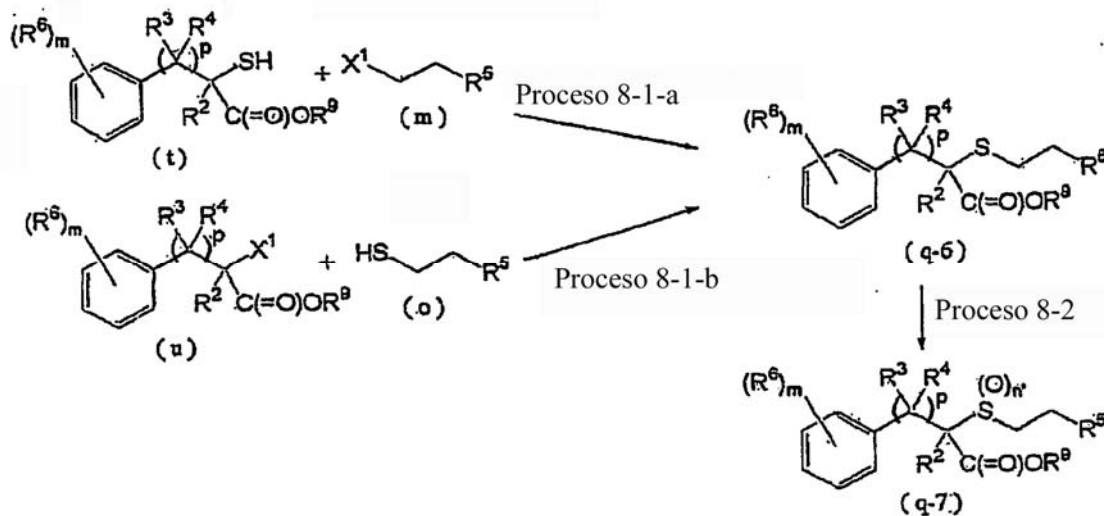
La cantidad del compuesto (h) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (s).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -100 a 150°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-5) por ejemplo por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-5) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario.

Proceso de referencia 8

Se puede producir un compuesto representado por la fórmula (q-6) (en adelante denominado compuesto (q-6)) que es el compuesto (q) en el que n es 0 y un compuesto representado por la fórmula (q-7) (en adelante denominado compuesto (q-7)), que es el compuesto (q) en el que n es 1 ó 2 a través del siguiente método:



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^9 , G , X^1 , p , m y n son como se han definido antes.

Proceso 8-1a:

Se puede producir el compuesto (q-6) haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (t) en adelante denominado compuesto (t) con el compuesto (m).

La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, 1,4-dioxano, o tetrahidrofurano, sulfuros orgánicos como sulfoxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno, alcoholes como metanol o etanol, agua y una mezcla de ellos.

Entre los ejemplos de base utilizada en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato potásico, o carbonato de cesio, alcóxidos de metal alcalino como metóxido sódico o terc-butóxido potásico, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.

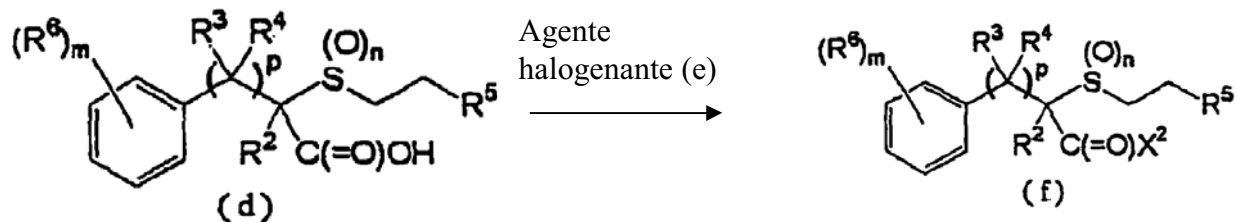
- La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (t).
- 5 La cantidad del compuesto (m) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (t).
- La temperatura de reacción está comprendida normalmente en el intervalo de -20 a 150°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.
- 10 Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-6) por ejemplo por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-6) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario.
- 15 **Proceso 8-1-b:**
- Se puede producir también el compuesto (q-6) haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (u) (en adelante denominado compuesto (u)) con el compuesto (o).
- 20 La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente en presencia de una base.
- Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen amidas ácidas como N,N-dimetilformamida, éteres como éter dietílico, 1,4-dioxano o tetrahidrofurano, azufres orgánicos como sulfóxido de dimetilo o sulfolano, hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos armáticos como tolueno o xileno, alcoholes como metanol o etanol, agua, y una mezcla de ellos.
- 25 Entre los ejemplos de bases utilizadas en la reacción se incluyen bases inorgánicas como hidruro sódico, hidruro potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato potásico o carbonato de cesio, alcóxidos de metal alcalino como metóxido sódico, terc-butóxido potásico, y bases orgánicas como trietilamina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]-7-undeceno.
- 30 La cantidad de base utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (u).
- 35 La cantidad del compuesto (o) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (u).
- La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -20 a 150°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.
- 40 Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-6) por ejemplo por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-6) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario.
- 45 **Proceso 8-2:**
- Se puede producir el compuesto (q-7) haciendo reaccionar el compuesto (q-6) con el agente oxidante (x).
- 50 La reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente.
- Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno, hidrocarburos orgánicos como tolueno o xileno, ácidos carboxílicos alifáticos como ácido acético o ácido trifluoroacético, alcoholes como metanol o etanol, agua, y una mezcla de los mismos.
- 55 Entre los ejemplos de agente oxidante (x) utilizado en la reacción se incluyen peróxidos orgánicos como ácido peracético, ácido trifluoroperacético o ácido m-clorobenzoico, halógenos como cloro o bromo, imidas con contenido en halógeno como N-clorosuccinimida, haluros como ácido perclórico (o una sal del mismo) o ácido peryódico (o una sal del mismo), permanganatos como permanganato potásico, cromatos como cromato potásico y peróxido de hidrógeno.
- 60 La cantidad del agente oxidante (x) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (q-6).
- 65

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro del intervalo de -50 a 200°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 72 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (q-7) por ejemplo por vertido de la mezcla de reacción en agua y extracción de la mezcla resultante con un disolvente orgánico, seguido de concentración. Asimismo, se puede purificar el compuesto aislado (q-7) por cromatografía, recristalización o similares, si es necesario.

Proceso de producción 9

Se puede producir el compuesto (f) haciendo reaccionar el compuesto (d) con un agente halogenante (e) tal como se muestra a continuación.



donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , X^2 , p , m , y n son como se han definido antes.

Se lleva a cabo la reacción sin disolvente o en un disolvente.

Entre los ejemplos de disolvente utilizado en la reacción se incluyen hidrocarburos halogenados como cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano o clorobenceno e hidrocarburos aromáticos como tolueno o xileno.

Entre los ejemplos de agente halogenante (e) se incluyen cloruro de oxalilo, cloruro de tionilio, bromuro de tionilio, tricloruro de fósforo, tribromuro de fósforo y pentacloruro de fósforo.

La cantidad de agente halogenante (e) utilizada en la reacción está comprendida normalmente entre 1 y 10 moles por cada 1 mol del compuesto (d).

La temperatura de reacción está comprendida normalmente dentro de intervalo de -20 a 150°C y el período de reacción está comprendido normalmente entre 1 y 24 horas.

Una vez completada la reacción, se puede aislar el compuesto (f) por concentración o similares. Asimismo, se puede purificar posteriormente el compuesto aislado (f) por destilación o similar, si es necesario.

Entre los ejemplos de plagas de artrópodos contra las que el compuesto de la presente invención presenta un efecto de control se incluyen insectos dañinos y ácaros dañinos, más específicamente los siguientes artrópodos.

Hemípteros:

La Chinches (Delfácidos) como chinche parda pequeña (*Laodelphax striatellus*), chinche parda (*Nilaparvata lugens*) y chinche del arroz de dorso blanco (*Sogatella furcifera*), langostas (Deltofálidos), como langosta verde del arroz (*Nephotettix cincticeps*) y langosta verde del arroz (*Nephotettix virescens*), langosta del té verde (*Empoasca onukii*); Afídidos como pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), pulgón del melocotón verde (*Myzus persicae*); pulgón del repollo (*Brevicoryne brassicae*), pulgón verde de los cítricos (*Aphis spiraecola*), pulgón de la patata (*Macrosiphum euphorbiae*), pulgón de las solanáceas (*Aulacorthum solani*), pulgón de la avena (*Rhopalosiphum padi*), pulgón negro de los cítricos (*Toxoptera citricidus*), y pulgón harinoso del melocotonero (*Hyalopterus pruni*); chinches (Pentatomidae) como chinche fétida verde (*Nezara antennata*), chinches de las alubias (*Riptortus clavatus*), chinche del arroz (*Leptocoris chinensis*), escarabajo de puntos blancos (*Eysarcoris parvus*), y chinche parda marmórea (*Halyomorpha mista*); moscas blancas (Aleyrodidae), como mosca blanca de invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*), mosca blanca del tabaco (*Bemisia tabaci*), mosca blanca de los cítricos (*Dialeurodes citri*), y mosca blanca espinosa del naranjo (*Aleurocanthus spiniferus*), cochinillas, (Coccidae) como piojo rojo de California (*Aonidiella aurantii*), cochinilla de san José (*Comstockaspis perniciososa*), cochinilla blanca del tronco (*Unaspis citri*), cochinilla de cera roja (*Ceroplastes rubens*), cochinilla acanalada (*Icerya purchasi*), chinche harinosa japonesa (*Planococcus kraunhiae*), cochinilla de cola larga (*Pseudococcus longispinis*) y cochinilla blanca del duraznero (*Pseudaulacaspis pentagona*); chinches (Tingidae); chinches como cinche de la cama (*Cimex lectularius*), piojos saltarines (Psyllidae), etc.

Lepidópteros:

Polillas piráidas (Pyralidae), como barrenillo del arroz (*Chilo suppressalis*), perforador amarillo del arroz (*Tryporyza incertulas*), arrugahojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), insecto arrugahojas del algodón (*Notarcha derogata*), polilla de la harina (*Plodia interpunctella*), barrenador del maíz oriental (*Ostrinia furnacalis*) *Maruca testulalis*, gusano de la col (*Hellula undalis*), y gusano de la hierba (*Pediasia teterellus*); polillas nocturnas (Noctuidae) como por ejemplo oruga del tabaco, (*Spodoptera litura*), gusano de la remolacha (*Spodoptera exigua*), procesionaria del arroz (*Pseudaletia separata*), polilla de la col (*Mamestra brassicae*), gusano cortador grasiento (*Agrotis ipsilon*), gusano de la remolacha (*Plusia nigrisigna*), *Thoricoplusia* spp. *Heliotis* spp. y *Helicoverpa* spp; mariposas blancas (Pieridae) como mariposa de la col (*Pieris rapae*); polillas tortricidas (Tortricidae) como *Adoxophyes* spp., polilla de la fruta oriental (*Grapholita molesta*), gusano de la vaina de la soja (*Leguminivora glycinivorella*), gusano de la vaina de la alubia azuki (*Matsumuraeses azukivora*), polilla enredadora de la fruta de verano (*Adoxophyes orana fasciata*), polilla enredadora más pequeña del té (*Adoxophyes honmai.*), polilla del té oriental (*Homona magnanima*), polilla de la manzana (*Archips fuscocupreanus*) y polilla del manzano (*Cydia pomonella*); gusanos minadores de las hojas (Gracillariidae) como minador de la hoja de té (*Caloptilia theivora*), y minador de la hoja del manzano (*Phyllonorycter ringoneella*); Carposínidos como polilla del melocotón (*Carposina niponensis*); polillas lionétidas (Lyonetiidae) como *Lyonetia* spp.; limántridos (Lymanantriidae) como *Lymantria* spp. y *Euproctis* spp.; polillas iponomeútididas (Yponomeutidae) como polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*); polillas gelénquidas (Gelenchidae) como polilla rosa (*Pectinophora gossypiella*) y gusano de la patata (*Phthorimaea operculella*); polillas tigre y arctidos (Arctiidae) como polilla del otoño (*Hyphantria cunea*), polillas de la ropa (Tineidos) como polilla de la ropa de las maletas (*Tinea translucens*) y polilla de los tejidos (*Tineola bisselliella*), etc.;

Tisanópteros:

Trips (Triptidae) trips de las flores (*Frankliniella occidentalis*), trips del melón (*Thrips palmi*), trips del té amarillo (*Scirtothrips dorsalis*), trips del tabaco (*Thrips tabaci*), trips de las flores (*Frankliniella intonsa*), etc.

Dípteros:

Cúlices (Calicidae) como mosquito común (*Culex pipiens pallens*), *Culex tritaeniorhynchus* y mosquito doméstico del sur (*Culex quinquefasciatus*); *Aedes* spp. como mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*) y mosquito tigre asiático (*Aedes albopictus*), *Anopheles* spp. como *Anopheles sinensis*, Quironómidos (moscas enanas); moscas domésticas (Múscidos) como mosca doméstica (*Musca domestica*) y falsa mosca de los establos (*Muscina stabulans*); moscas chupadoras (Califóridos); moscardas de la carne (Sarcofágidos); moscas domésticas pequeñas (Fanniidae); moscas antomidas (Anthomyiidae) como cresa del maíz (*Delia platura*) y cresa de la cebolla (*Delia antiqua*); moscas minadoras de las hojas (Agromyzidae) como barrenador de la hoja del arroz (*Agromyza oryzae*), barrenador de la hoja del arroz (*Hydrellia griseola*), barrenador de la hoja del tomate (*Liriomyza sativae*), barrenador de la hoja de las legumbres (*Liriomyza trifolii*), barrenador de la hoja del guisante (*Chromatomyia horticola*), moscas clorópidas (Chloropidae) como cresa del tallo del arroz (*Chlorops oryzae*); moscas de la fruta (Tephritidae) como mosca del melón (*Dacus curcubitae*) y mosca de la fruta mediterránea (*Ceratitis capitata*), moscas drosófilas (Drosophilidae), moscas de los champiñones (Fóridos) como *Megaselia spiracularis*; Psychodidae como *Clogmia albipunctata*; Simúliidos; Tabánidos como tábano (*Tabanus trigonus*), mosca de los establos (*Stomoxys calcitrans*), etc.

Coleópteros:

Escarabajos (*Diabrotica* spp.) como gusano de la raíz del maíz septentrional (*Diabrotica virgifera virgifera*) y gusanos de la raíz del maíz meridional (*Diabrotica undecimpunctata howardi*); escarabajos (Scarabaeidae) como escarabajo cobrizo (*Anomala cuprea*), escarabajo de la soja (*Anomala rufocuprea*) y escarabajo japonés (*Popilia japonica*); gorgojos (Curculionidae) como gorgojo del maíz (*Sitophilus zeamais*), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), gorgojo sureño del frijol (*Callosobruchus chinensis*), gorgojo de la planta del arroz (*Echinocnemus squameus*), picudo del algodono (*Anthonomus grandis*) y gorgojo del césped (*Sphenophrus venatus*); escarabajos negros (Tenebrionidae) como escarabajo de la harina (*Tenebrio molitor*), escarabajo rojo de la harina (*Tribolium castaneum*); escarabajos de las hojas (Chrysomelidae) como escarabajo de las hojas del arroz (*Oulema oryzae*), escarabajo foliar de las curcubitáceas (*Aulacophora femoralis*), escarabajo pulga rayado (*Phyllotreta striolata*) y escarabajo de la patata (*Leptinotarsa decemlineata*); escarabajos de las alfombras (Dermestidae) como escarabajo de los museos (*Anthrenus verbasci*) y escarabajo del cuero (*Dermestes maculatus*); escarabajos anobiidos o del reloj de la muerte (Anobiidae) como escarabajo del cigarrillo (*Lasioderma serricorne*); mariquitas, como mariquita grande de la patata (*Epilachna vigintioctopunctata*); escolitidos o escarabajos de la corteza (Scolytidae) como escarabajo de los postes (*Lyctus brunneus*), y escarabajo de los brotes del pino (*Tomicus piniperda*); escarabajos del taladro (Bostrichidae); escarabajos araña (Ptinidae); escarabajos longicornios (Cerambycidae) como escarabajo de cuernos largos y manchas blancas (*Anoplophora malasiaca*); gusano de alambre (*Agriotes* spp.); *Paederus fuscipes*, etc.

Ortópteros:

Langosta migratoria (*Locusta migratoria*); alacrán cebollero (*Gryllotalpa africana*), saltamontes del arroz de alas cortas (*Oxya yezoensis*), saltamontes del arroz (*Oxya japonica*) y Gryllodea, etc.

Sifonápteros:

Pulga felina (*Ctenocephalides felis*), pulga canina (*Ctenocephalides canis*), pulga humana (*Pulex irritans*), pulga de la rata oriental (*Xenopsylla cheopis*), etc.

Anopluros:

- 5 Piojo del cuerpo (*Pediculus humanus corporis*); ladilla (*Phthirus pubis*), piojos chupadores (*Haematopinus eurysternus*), piojos de las ovejas (*Dalmaninia ovis*), piojos del ganado porcino (*Haematopinus suis*), etc.

Himenópteros:

- 10 Hormigas (Formicidae) como hormiga faraón (*Monomorium pharaonis*), hormiga negra (*Formica fusca japonica*, hormigas negras (*Ochetellus glaber*), *Pristomyrmex pungens*, *Pheidole noda*, hormigas jardineras (*Acromyrmex* spp.) y hormigas de fuego rojas (*Solenopsis* spp.); avispas (Vespidae); avispas solitarias (Betylidae); avispas de sierra (Tenthredinidae) como mosca de la zanahoria (*Athalia rosae*) y *Athalia japonica*, etc.

Blatodeos:

- 15 Cucaracha rubia (*Blattella germanica*), cucaracha café ahumada (*Periplaneta fuliginosa*), cucaracha común (*Periplaneta americana*), *Periplaneta brunnea* y cucaracha negra (*Blatta orientalis*);

Isópteros:

- 20 Termitas (Termitidae) como termitas subterráneas, como termita japonesa subterránea (*Reticulitermes speratus*); termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus*), termita de madera seca occidental (*Incisitermes minor*), termita de la madera seca doméstica (*Cryptotermes domesticus*), *Odontotermes formosanus*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes satsumensis*, *Glyptotermes nakajimai*, *Glyptotermes fuscus*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes kushimensis*, termita de madera húmeda japonesa (*Hodotermopsis japonica*), *Coptotermes guangzhouensis*, *Reticulitermes miyatakei*, *Reticulitermes flavipes amamianus*, *Reticulitermes karimonensis* (25 *Reticulitermes* sp.), *Nasutitermes takasagoensis*, *Pericapritermes nitobei*, *Sinocapritermes mushae*, etc.

Acarina:

- 30 Ácaros araña (Tetranychidae) como araña roja (*Tetranychus urticae*), araña garrapata de Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), araña roja de los frutales (*Panonychus ulmi*) y *Oligonychus* spp.; ácaros eriófidos (Eriophyidae) como ácaro rosa de la herrumbre de los cítricos (*Aculops pelekassi*), *Phyllocoptruta citri*, ácaro de la herrumbre del tomate (*Aculops lycopersici*), ácaro del té púrpura (*Calacarus carinatus*), ácaro del té rosa (*Acaphylla theavagran*), *Eriophyes chibaensis* y ácaro de la herrumbre del manzano (*Aculus schlechtendali*); ácaros tarsonémidos (Tarsonemidae) como araña blanca (*Polyphagotarsonemus latus*); ácaro rojo de las palmeras (Tenuipalpidae) como *Brevipalpus phoenicis*; Tuckerellidae; garrapatas (Ixodidae) como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, garrapata americana del perro (*Dermacentor variabilis*), *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, garrapata de patas negras (*Ixodes scapularis*), garrapata solitaria (*Amblyomma americanum*), *Boophilus microplus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros psoróptidos como ácaros de las orejas (*Otodectes cynotis*); ácaros de prurito (Sarcoptidae) como arador de la sarna (*Sarcoptes scabiei*); ácaros de folículo (Demodicidae) como ácaro de los perros (*Demodex canis*); ácaros acarida (Acaridae) como pulgón del jamón serrano ibérico (*Tyrophagus putrescentiae*) y *Tyrophagus similis*; ácaros del polvo doméstico (Pyroglyphidae) como *Dermatophagoides farinae*; y *Dermatophagoides pteronyssus*; ácaros queilétidos (Cheyletidae) como *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis*, y *Cheyletus moorei*; ácaros parasitoides (Dermanyssidae) como ácaro de la rata tropical (*Ornithonyssus bacoti*), ácaros de palomas silvestres (*Ornithonyssus sylviarum*), y ácaro rojo de las gallinas (*Dermanyssus gallinae*); ácaros de la coesecha (Trombiculidae) como *Leptotrombidium akamushi*; arañas (Araneae) (45 como araña del follaje japonesa (*Chiracanthium japonicum*), araña de dorso rojo (*Latrodectus hasseltii*), etc.

Quilópodos o ciempiés: *Thereuonema hilgendorfi*, *Scolopendra subspinipes*, etc.

- 50 Diplodos: milpiés de jardín (*Oxidus gracilis*), *Nedyopus tambanus*, etc.;

Isópodos: cochinillas comunes (*Armadillidium vulgare*), etc.;

Gastrópodos: *Limax marginatus*, *Limax flavus*, etc.

- 55 Aunque la composición plaguicida de la presente invención puede consistir en el compuesto de la presente invención por sí solo, la composición plaguicida de la presente invención comprende normalmente el compuesto de la presente invención en combinación con un vehículo sólido, un vehículo líquido y/o un vehículo gaseoso, y si es necesario, un agente tensioactivo u otros aditivos farmacéuticos y adopta la forma de una emulsión, un aceite, una formulación de champú, una formulación fluible, un polvo, un polvo humectable, un granulado, una pasta, una (60 microcápsula, una formulación de espuma, un aerosol, una preparación de gas de dióxido de carbono, una tableta, una preparación de resina o similar. La composición plaguicida de la presente invención se puede procesar en un cebo de veneno, una espiral para mosquitos, una esterilla eléctrica para mosquitos, un agente de humo, un fumigante o una lámina, para su uso posterior.

- 65 La composición plaguicida de la presente invención contiene normalmente entre 0,1 y 95% en peso del compuesto de la presente invención.

5 Entre los ejemplos de vehículo sólido se incluyen un polvo finamente dividido o un granulado de arcilla (v.g. arcilla de caolín, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla de Fubassami, arcilla ácida, etc.), óxido de silicio hidratado sintético, talco, cerámicas, otros minerales inorgánicos (v.g., sericita, cuarzo, azufre, carbono activo, carbonato cálcico, sílice hidratada, etc.), fertilizantes químicos (v.g., sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, cloruro de amonio, urea, etc.) y similares.

10 Entre los ejemplos de vehículo líquido se incluyen hidrocarburos aromáticos o alifáticos (v.g., xileno, tolueno, alquilnaftaleno, fenil xililetano, queroseno, aceite ligero, hexano, ciclohexano, etc.), hidrocarburos halogenados (v.g., clorobenceno, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, etc.), alcoholes (v.g., metanol, etanol, alcohol isopropílico, butanol, hexanol, etilen glicol, etc.), éteres (v.g., éter dietílico, éter dimetílico de etilen glicol, éter monometílico de dietilen glicol, éter monoetílico de dietilen glicol, éter monometílico de propilen glicol, tetrahidrofurano, dioxano, etc.), ésteres (v.g., acetato de etilo, acetato de butilo, etc.), cetonas (v.g., acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, ciclohexanona, etc.), nitrilos (v.g., acetonitrilo, isobutironitrilo, etc.), sulfóxidos (v.g., sulfóxido de dimetilo, etc.), amidas ácidas (v.g., N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, etc.), aceites vegetales (v.g. aceite de soja, aceite de semilla de algodón, etc.), aceites esenciales vegetales (v.g., aceite de naranja, aceite esencial de hisopo, aceite de limón, etc.), agua y similares.

20 Entre los ejemplos de vehículo gaseoso se incluyen gas butano, clorofluorocarbono, LPG (gas petróleo licuado), éter dimetílico, gas dióxido de carbono y similares.

25 Entre los ejemplos de agente tensioactivo se incluyen sales de sulfato de alquilo, sales de sulfonato de alquilo, sales de sulfonato de alquilarilo, éteres alquil arílicos y sus derivados polioxiethylados, éteres de polietilen glicol, ésteres de alcohol polihidroxílico, y derivados de alcohol de azúcar.

30 Entre los ejemplos de otros aditivos farmacéuticos se incluyen un aglutinante, un dispersante, un estabilizante y similares, y entre los ejemplos específicos de ellos se incluyen caseína, gelatina, polisacáridos (v.g., almidón, goma arábiga, derivados de celulosa, ácido alginico, etc.), derivados de lignina, bentonita, sacáridos, polímeros hidrosolubles sintéticos (v.g., polialcohol vinílico, polivinil pirrolidona, poliácido acrílico, etc.), PAP (fosfato de ácido isopropílico), BHT (2,6-di-terc-butil-4-metilfenol), BHA (una mezcla de 2-terc-butil-4-metoxifenol y 3-terc-butil-4-metoxifenol), aceites vegetales, aceites minerales, ácidos grasos y ésteres de ácido graso.

35 Entre los ejemplos de un material base para una preparación de resina se incluyen polímeros de cloruro de vinilo, poliuretano y similares. Se puede añadir al material base, si es necesario, un plastificante como ftalato (v.g., ftalato de dimetilo, ftalato de dioctilo, etc.), adipato, ácido esteárico y similares. La preparación de resina se obtiene por amasado del compuesto de la presente invención en un material base utilizando un aparato de amasado convencional, seguido de moldeo, por ejemplo moldeo de inyección, moldeo por extrusión, moldeo a presión o similares. Se puede configurar la preparación de resina resultante en forma de placa, película, cinta, red, cordón o similares, a través de una etapa posterior de moldeo, cortado o similares, si es necesario. Se pueden utilizar estas preparaciones de resina por ejemplo en forma de un collar para animales, un dispositivo para la oreja del animal, una preparación de lámina, un plomo, o un puesto de horticultura.

45 Entre los ejemplos de material base para el cebo de veneno se incluyen un polvo de cereales, aceite vegetal, azúcar, celulosa cristalina y similares. Se puede añadir al material base, si es necesario, un antioxidante como dibutilhidroxitolueno o ácido nordihidroguaiarético, un conservante como ácido dehidroacético, un agente para evitar la ingestión por parte de niños y mascotas de forma errónea, por ejemplo un polvo de pimienta negra, un aroma atractivo para la plaga, como por ejemplo aroma de queso, aroma de cebolla o aceite de cacahuete o similares.

50 Se puede aplicar la composición plaguicida de la presente invención por ejemplo a artrópodos dañinos directamente y/o en el lugar en el que habitan los artrópodos dañinos (v.g., plantas, animales, suelo, etc.).

55 La composición plaguicida de la presente invención se puede utilizar en tierras de cultivo, como por ejemplo tierras cultivadas, campos de arrozal, prados y huertos. La composición plaguicida de la presente invención sirve para controlar artrópodos dañinos en una tierra de cultivo sin causar daños de fármaco a las plantas de cultivo cultivadas en la tierra de cultivo.

Entre los ejemplos de dichas plantas de cultivo se incluyen las que se enumeran a continuación:

60 Cultivos agrícolas: maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, trigo sarraceno, caña de azúcar, colza, girasol, caña de azúcar, tabaco, etc.;

65 Vegetales: solanáceas (berenjena, tomate, pimiento verde, guindilla, patata, etc.), curcubitáceas (pepino, calabaza naranja, calabacín, sandía, melón, etc.), crucíferas (rábano japonés, rábano, rábano picante, rábanos kohlrabi, calabaza china, calabaza, mostaza marrón, brecol, coliflor, etc.), verduras compuestas (bardana, crisantemo, alcachofa, lechuga, etc.), liliáceas (cebolla galesa, cebolla, ajo, espárrago, etc.), umbelíferas (zanahoria, perejil, apio, chirivía, etc.), quenopodiáceas (espinacas, acelgas, etc.), Labiáceas (perejil japonés, menta, albaca, etc.), fresas, batatas, ñame, aráceas, etc.;

Flores y plantas ornamentales;

Plantas de follaje;

Árboles frutales: frutas pomáceas (manzana, pera común, pera japonesa, membrillo chino, membrillo, etc.), frutas carnosas con hueso (melocotón, ciruela, nectarina, ciruela japonesa, cereza, albaricoque, ciruela negra, etc.), cítricos (mandarina Satsuma, naranja, limón, pomelo, lima, etc.), frutos secos (avellana, almendra, pistacho, nuez, anacardo, macadamia, etc.), bayas (arándanos, grosellas, moras, frambuesas), uvas, tomate, aceitunas, nísperos, plátanos, café, dátiles, coco, etc.;

Otros árboles distintos a los frutales: té, morera, árboles y arbustos en flor, árboles de hilera (fresnos, abedules, cornejos, eucalipto, ginkgo, lilo, arces, robles, álamo, cedro, caucho chino, plataneros, zelkova, arborvitae japoneses, abeto, falso abeto, junípero espinoso, falso abeto, pino, tejo), etc.

Entre las plantas de cultivo que se han mencionado se incluyen aquellas en las que se ha impartido resistencia a un inhibidor de HPPD como isoxaflutol, un inhibidor de ALS como imazethapyr o thifensulfuron-metilo, un inhibidor de enzima de síntesis de EPSP, un inhibidor de enzima de síntesis de glutamina, un inhibidor de acetil CoA carboxilasa o bromoxinilo, a través de un método de desarrollo clásico, una técnica de ingeniería genética o similar.

Entre los ejemplos de plantas de cultivo en las que se ha impartido una resistencia a un herbicida a través de un método de desarrollo clásico se incluyen canola Clearfield (marca registrada) que es resistente a un herbicida de imidazolinona como imazethapyr, soja STS que es resistente a un herbicida inhibidor de ALS sulfonil urea como tifensulfuron-metilo, así como maíz SR que es resistente a un inhibidor acetil CoA carboxilasa, como herbicidas de triona oxima o herbicidas de ácido ariloxifenilpropiónico. Por ejemplo, en Proc. Natl. Acad. Sci. EE.UU. 1990, 87, p. 7175-7179 se describe una planta de cultivo en la que se ha impartido resistencia a inhibidor de acetil CoA carboxilasa. Por otra parte, en Weed Science, vol. 53: p. 728-746, 2005 se describe un mutante acetil CoA carboxilasa que es resistente a un inhibidor de acetil CoA carboxilasa, por ejemplo, en Weed Science. Cuando se introduce un gen que codifica el mutante acetil CoA carboxilasa en una planta de cultivo por técnicas de ingeniería genética o cuando se introduce una mutación relacionada con la impartición de resistencia a acetil CoA carboxilasa en un gen que codifica acetil CoA carboxilasa de una planta de cultivo, se puede producir una planta de cultivo que tiene resistencia a un inhibidor de acetil CoA carboxilasa. Por otra parte, se pueden introducir ácidos nucleicos para introducir una mutación de sustitución de base en la célula de una planta de cultivo por quimioplastia (ver, Gura T. 1999, Repairing the Genome's Spelling Mistakes, Science 285: 316-318) para inducir una mutación de aminoácido dirigida a sitio en el gen diana al que se apunta el inhibidor de acetil CoA carboxilasa o herbicida de la planta de cultivo, y por lo tanto se puede producir una planta de cultivo resistente a un inhibidor de acetil CoA carboxilasa o herbicida.

Entre los ejemplos de planta de cultivo en la que se ha impartido resistencia a un herbicida por técnicas de ingeniería genética se incluyen cultivares de maíz que tienen resistencia a glifosfato y glufosinato. Algunos de estos cultivares de maíz se distribuyen con la marca comercial RoundupReady (marca registrada), LibertyLink (marca registrada) y similares.

Entre las plantas de cultivo que se han mencionado se incluyen aquellas que tienen la capacidad de producir una toxina insecticida, por ejemplo, se ha impartido una toxina selectiva que se conoce por ser producida por Bacillus, por ingeniería genética.

Entre los ejemplos de toxina insecticida producida por dichas plantas producidas por ingeniería genética se incluyen proteínas insecticidas derivadas de Bacillus cereus y Bacillus popillillae; δ -endotoxinas derivadas de Bacillus thuringiensis, como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3B1 y Cry9C; proteínas insecticidas derivadas de Bacillus thuringiensis, como VIP 1, VIP 2, VIP 3 y VIP 3A; proteínas insecticidas derivadas de nematodos; toxinas producidas por animales como toxinas de escorpión, toxinas de araña, toxinas de abeja, y toxinas del nervio específicas de insectos; toxinas fúngicas, lecitina vegetal, aglutinina, inhibidores de proteasa como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cristatina y papaína; proteínas inactivantes de ribosoma (RIP) como ricina, RIP de maíz, abrina, saporina y briodina; enzimas metabolizantes de esteroides como 3-hidroxiesteroide oxidasa; ecdysteroide-UDP-glucosiltransferasa y colesterol oxidasa; inhibidores de ecdysona; HMG-CoA reductasa; inhibidores del canal iónico como inhibidores del canal de sodio; inhibidores del canal de calcio; estearasa de hormona juvenil; receptores de hormona diurética; sintasa de estilbeno; bibencil sintasa, quitinasa y glucanasa.

La toxina insecticida que se produce a través de dicha planta producida por ingeniería genética también incluye toxinas híbridas de diferentes proteínas insecticidas como por ejemplo δ -endotoxinas como Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3B1 y Cry9C y proteínas insecticidas como VIP 1, VIP 2, VIP3, y VIP 3A y toxinas en las que se suprime o modifica una parte de los aminoácidos que constituyen la proteína insecticida. La toxina híbrida se obtiene combinando diferentes dominios de las proteínas insecticidas por técnicas de ingeniería genética. Un ejemplo de toxina en la que está suprimida una parte de los aminoácidos que constituyen la proteína insecticida incluye Cry1Ab en la que está suprimido una parte de los aminoácidos. Un ejemplo de toxina en la que se modifica una parte de los aminoácidos que constituyen una proteína insecticida incluye una toxina en la que están sustituidos uno o más aminoácidos de una toxina natural.

La toxina insecticida y la planta de cultivo producida por ingeniería genética que tiene la capacidad de producir una toxina insecticida se describen por ejemplo en EP-A-0.374.753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0.427.529, EP-A-451878, WO 03/052073, y similares.

- 5 Las plantas de cultivo producidas por ingeniería genética que tienen la capacidad de producir la toxina insecticida en particular tienen resistencia al ataque de plagas de coleópteros, plagas de dípteros y plagas de lepidópteros.

Las plantas producidas por ingeniería genética que tienen uno o más genes de resistencia a las plagas y, por lo tanto, producen una o más toxinas insecticidas, también son conocidas y algunas de ellas se distribuyen en el comercio. Entre los ejemplos de dichas plantas producidas por ingeniería genética se incluyen YieldGard (marca comercial registrada) (un cultivar de maíz que expresa la toxina Cry1Ab), YieldGard Rootworm (marca comercial registrada) (un cultivar de maíz que expresa la toxina Cry3Bb1), YieldGard Plus (marca comercial registrada) (un cultivar de maíz que expresa las toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1), Heculex I (marca comercial registrada) (un cultivar de maíz que expresa toxina Cry1Fa2 y fosfotricina N-acetiltransferasa (PAT) para impartir resistencia a glufosinato), NuCOTN33B (marca comercial registrada) (un cultivar de algodón que expresa toxina Cry1Ac), Bollgard I (marca comercial registrada) (un cultivar de algodón que expresa toxina Cry1Ac), Bollgard II (marca comercial registrada) (un cultivar de algodón que expresa las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab), VIPCOT (marca comercial registrada) (un cultivar de algodón que expresa la toxina VIP), NewLeaf (marca comercial registrada) (un cultivar de patata que expresa la toxina Cry3A), NatureGard Agrisure GT Advantage (marca comercial registrada) (GA21 carácter resistente a glifosato), Agrisure CB Advantage (marca comercial registrada) (Bt11 carácter portador de maíz (CB)), Protecta (marca comercial registrada), y similares.

Entre las plantas de cultivo que se han mencionado se incluyen aquellas en las que se ha impartido la capacidad para producir una sustancia anti-patógeno a través de técnicas de ingeniería genética.

Entre los ejemplos de sustancias anti-patógeno se incluyen proteínas PR (PRPs descritas en EP-A-0.392.225); inhibidores del canal iónico como inhibidores del canal de sodio, e inhibidores del canal de calcio (v.g., toxinas KP1, KP4, KP6, etc., producidas por virus); estilbeno sintasa; bibencilo sintasa; quitinasa; glucanasa; sustancias producidas por microorganismos como antibióticos de péptido; antibióticos que contienen heterociclo, y factores de proteína relacionadas con la resistencia a enfermedades de las plantas (descritos en WO 03/000906) y similares. Dichas sustancias anti-patógenas y las plantas producidas por ingeniería genética que producen sustancias antipatógeno se describen en EP-A-0.392.225, WO 05/33818, EP-A-0.353.191, y similares.

Cuando se utiliza la composición plaguicida de la presente invención para controlar plagas en agricultura y en los bosques, la cantidad de aplicación está comprendida normalmente entre 1 y 10.000 g/ha, preferiblemente entre 10 y 500 g/ha del compuesto de la presente invención. Cuando la composición plaguicida de la presente invención se presenta en forma de concentrado emulsionable, polvo humectable, formulación fluible o una microcápsula, normalmente se utiliza tras la dilución con agua a fin de conseguir una concentración del compuesto de la presente invención como ingrediente activo comprendida entre 0,01 y 1.000 ppm. Cuando la composición plaguicida de la presente invención presenta la forma de un polvo o un granulado, normalmente se utiliza como tal. Se puede rociar la composición plaguicida de la presente invención como tal o diluida directamente sobre las plantas que se van a proteger de los artrópodos dañinos. Alternativamente, se puede tratar el suelo con la composición plaguicida de la presente invención, como tal, o como una dilución para controlar artrópodos dañinos que viven en el suelo. También se pueden tratar los surcos de la siembra antes de plantar, o en los agujeros para plantar, o a pie de la planta con la composición plaguicida de la presente invención. Asimismo, se puede aplicar una formulación de lámina de la composición plaguicida de la presente invención enrollándola en torno a la planta, colocándola próxima a la planta, colocándola en la superficie del suelo a pie de la planta o similares.

Cuando se utiliza la composición plaguicida de la presente invención para controlar epidemias, la cantidad de aplicación está comprendida normalmente entre 0,001 y 10 mg/m³ del compuesto de la presente invención como ingrediente activo para la aplicación en el espacio, y 0,001 y 100 mg/m² del ingrediente activo para su aplicación en un plano. La composición plaguicida en forma de concentrado emulsionable, un polvo humectable o una formulación fluible se aplica normalmente tras su dilución con agua en una cantidad suficiente como para contener normalmente de 0,001 a 10,000 ppm del ingrediente activo. Generalmente se aplica la composición plaguicida en forma de una solución oleosa, una formulación de aerosol, un plaguicida ahumante o un cebo con veneno.

Cuando se utiliza la composición plaguicida de la presente invención para controlar parásitos externos del ganado, como por ejemplo vacas, caballos, cerdos, ovejas, cabras y pollos, o animales pequeños como perros, gatos, ratas y ratones, se puede aplicar sobre dichos animales a través de un método conocido en el campo de la veterinaria. Específicamente, cuando se pretende un control sistémico, se administra la composición plaguicida de la presente invención, por ejemplo, en forma de tableta, mezclada con el alimento, un supositorio o una inyección (v.g., por vía intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, etc.). Cuando se pretende un control no sistémico, el método de uso de la composición plaguicida de la presente invención incluye el rociado, tratamiento por vertido o tratamiento en un punto con la composición plaguicida en forma de una solución oleosa o un líquido acuoso, el lavado de un animal con la composición plaguicida en forma de una formulación de champú, y la aplicación de un collar o una etiqueta para la oreja hecho de la composición plaguicida en forma de una preparación de resina en el animal.

Cuando se administra a un animal, la cantidad del compuesto de la presente invención está comprendida normalmente en el intervalo entre 0,1 y 1.000 mg por cada 1 kg de peso corporal del animal.

5 La composición plaguicida de la presente invención se puede utilizar como mezcla o en combinación con otros insecticidas, nematocidas, acaricidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, agentes de sinergia, fertilizantes, acondicionadores del suelo, alimento para animales y similares.

Entre los ejemplos de ingrediente activo de dichos insecticidas se incluyen:

10 (1) Compuestos de fósforo orgánicos:
acefato, fosfida de aluminio, butatiofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos (CYAP), diazinon, DCIP (éter diclorodiisopropílico), diclofentión (ECP), diclorvos (DDVP), dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, fention (MPP), fenitrotion (MEP), fostiazato, formotion, hidrogen fosfida, isofenfos, isoxation, malation, mesulfenfos, metidation (DMTP), monocrotofos, naled (BRP), oxideprofos (ESP),
15 paration, fosalon, fosmet (PMP), pirimifos-metilo, piridafention, quinalfos, fentoato (PAP), profenofos, propafos, protiofos, piraclufos, saltion, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometon, triclorfon (DEP), vamidotion, forato, cadusafos, y similares;

20 (2) Compuestos de carbamato:
alanicarb, bendiocarb, benfuracarb; BPMC, carbaril, carbofuran, carbosulfan, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, benotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb (MIPC), metolcarb, metomil, metiocarb, NAC, oxamil, pirimicarb, propoxur (PHC), XMC, tiodicarb, xililcarb, aldicarb y similares;

25 (3) Compuestos piretroides sintéticos
acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, empentrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, tetrametrina, fenotrina, cipfenotrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, furametrina, tau-fluvalinato, metoflutrina, 2,2-dimetil-3-(1-
30 propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbencilo, 2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, 2,2-dimetil-3-(2-ciano-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, 2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencil y similares;

35 (4) Compuestos de nereistoxina:
cartap, bensultap, tiociclam, monosultap, bisultap y similares;

(5) Compuestos neonicotinoides:
imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurano, clotianidina, y similares;

40 (6) Compuestos de benzoilurea:
clorfluazuron, bistrifluron, diafentiuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron, triazuron y similares;

(7) Compuestos de fenilpirazol
acetoprol, etiprol, fipronil, vaniliprol, piriprol, pirafluprol y similares;

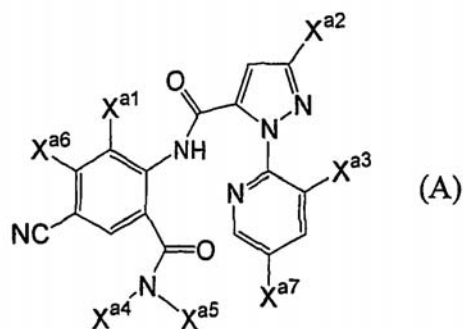
45 (8) Insecticidas de toxina Bt
Esporas vivas derivadas de *Bacillus thuringiensis* y toxinas cristalizadas producidas de *Bacillus thuringiensis* y mezclas de ellos;

(9) Compuestos de hidrazina:
cloromafenzida, halofenzida, metoxifenzida, tebufenzida y similares;

50 (10) Compuestos de cloro orgánicos
aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfan, metoxiclor y similares;

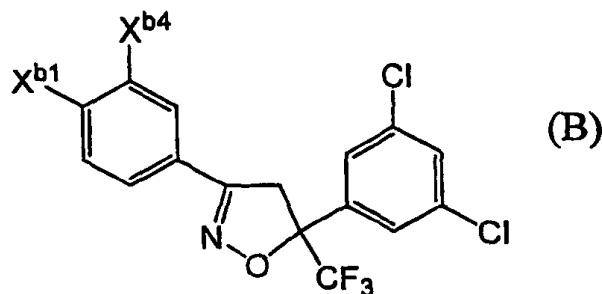
(11) Insecticidas naturales:
aceite mecánico, sulfato de nicotina y similares;

55 (12) Otros insecticidas:
avemectina-B, bromopropilato, buprofeszina, clorfenapir, ciromazina, D-D(1,3-dicloropropeno), emamectina-benzoato, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, metopreno, idoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetozina, piridalilo, piriproxifeno, espinosad, sulfuramid, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, lepimectina, ácido arsénico, benclotiaz, cianiamida cálcica, polisulfuro cálcico, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamid, flurimfen, fometanato, metamamonio, metám-sodio, bromuro de metilo, oleato potásico, proftrifenbute, espiromesifeno, azufre, metaflumizona, espirotetramat, pirifluquinazona, espinetoram, clorantraniprol, tralopiril, un compuesto representado por la siguiente
60 fórmula (A):



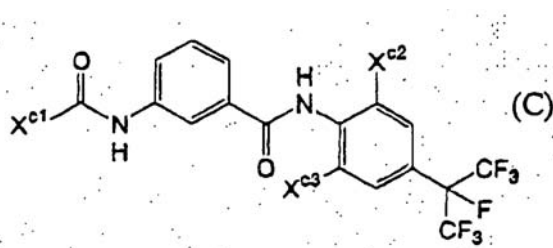
en la que X^{a1} representa un grupo metilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, o un átomo de flúor, X^{a2} represente un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo haloalquilo de C1-C4 o un grupo haloalcoxi de C1-C4, X^{a3} represente un átomo de flúor, un átomo de cloro o un átomo de bromo, X^{a4} representa un grupo alquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente, un grupo alquenilo de C3-C4 sustituido opcionalmente, un grupo alquinilo de C3-C4 sustituido opcionalmente, un grupo cicloalquilo de C3-C5 sustituido opcionalmente o un átomo de hidrógeno, X^{a5} representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, X^{a6} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro y X^{a7} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro;

10 un compuesto representado por la siguiente fórmula (B):



en la que X^{b1} representa un grupo X^{b2} -NH-C(=O), un grupo X^{b2} -C(=O)-NH, un grupo X^{b3} -S(O) pirrol-1-ilo sustituido opcionalmente, un grupo imidazol-1-ilo sustituido opcionalmente, un grupo pirazol-1-ilo sustituido opcionalmente, o un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo sustituido opcionalmente, X^{b2} representa un grupo haloalquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente como, por ejemplo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo o un grupo cicloalquilo de C3-C6 sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo ciclopropilo, y X^{b3} representa un grupo alquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo metilo;

20 un compuesto representado por la siguiente fórmula (C):



en la que X^{c1} representa un grupo alquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente como por ejemplo un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo alcoxi de C1-C4 sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo 2,2,2-tricloroetoxi o un grupo fenilo sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo 4-cianofenilo, un grupo piridilo sustituido opcionalmente como por ejemplo, un grupo 2-cloro-3-piridilo, X^{c2} representa un grupo metilo o un grupo trifluorometiltilio y X^{c3} representa un grupo metilo o un átomo de halógeno, y similares.

30 Entre los ejemplos de ingredientes activos del acaricida se incluyen acequinocil, amitraz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, chinometionat, clorobenzilato, CPCBS (clorfenson), clofentezina, ciflumetofen, keltano (dicofol), etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacipirim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita (BPPS), poliactinas, piridaben, pirimidifen, tebufenpirad, tetradifon, espirodiclofen, espiromesifen, espirotetramat, amidoflumet, cienopirafen y similares.

35

Entre los ejemplos de nematocida, se incluyen DCIP, fostiazato, hidrocloreuro de levamisol, metilisotiocianato, tartrato de morantel, imiciafos y similares.

- 5 Entre los ejemplos de ingredientes activos de dicho fungicida se incluyen compuestos de estrobilurina como azoxistrobina; compuestos de organofosfato como tolclofos-metilo, compuestos de azol como triflumizol, pefurazoato y difenoconazol; ftalida, flutolanilo, validamicina, probenazol, diclomezina, pencicuron, dazomet, kasugamicina, IBP, piroquilon, ácido oxolínico, triciclazol, ferimzona, mepronil, EDDP, isoprotilano, carpropamid, diclocimet, furametpir, fludioxonil, procimidona y dietofencarb.

10 Ejemplos

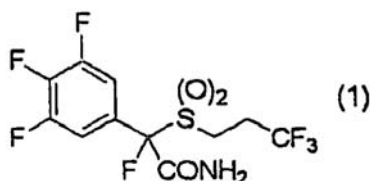
A continuación, se explicará la presente invención con mayor detalle con los siguientes Ejemplos de Producción, Ejemplos de Formulación y Ejemplos de Ensayo, si bien la presente invención no queda limitada con ellos.

- 15 En primer lugar, se presentan los Ejemplos de Producción del compuesto de la presente invención.

Ejemplo de producción 1

- 20 Se añadió a una solución de 0,5 g de 2-fluoro-2-(3,4,5-trifluorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo en 20 ml de metanol 0,6 ml de una solución 7M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente y se agitó la mezcla resultante a la misma temperatura durante 14 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,35 g de 2-fluoro-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)-2-(3,4,5-trifluorofenil)acetamida (en adelante denominado compuesto (1) de la presente invención).

- 25 Compuesto (1) de la presente invención

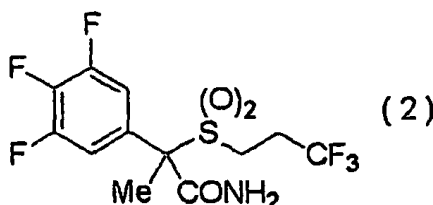


- 30 $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 7,56-7,65 (2H, m), (1H, ancho), 5,91 (1H, ancho s), 3,56-3,73 (2H, m), 3,23-3,48 (2H, m).

Ejemplo de producción 2

- 35 Se añadió a una solución de 1,0 g de 2-(3,4,5-trifluorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propionato de metilo en 2,0 ml de metanol 8,0 ml de una solución 7M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 48 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,20 g de 2-(3,4,5-trifluorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propaneamida (en adelante denominado compuesto (2) de la presente invención).

- 40 Compuesto (2) de la presente invención



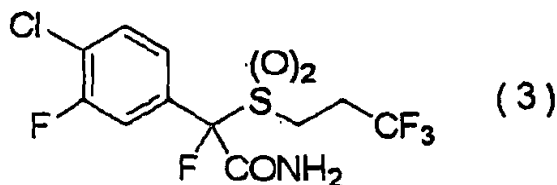
- 45 $^1\text{H-RMN}$ (CDCl_3 , TMS): δ (ppm) 7,36 (2H, dd), 6,41 (1H, ancho s), 6,15 (1H, ancho s), 3,26-3,58 (2H, m), 2,50-2,74 (2H, m), 2,08 (3H, s).

Ejemplo de producción 3

Se añadió a una solución de 0,8 g de 2-(4-cloro-3-fluorofenil)-2-fluoro-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo en 20 ml de metanol 1,5 ml de una solución 7M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente, y se agitó

la mezcla a la misma temperatura durante 16 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,60 g de 2-(4-cloro-3-fluorofenil)-2-fluoro-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetamida (en adelante denominado compuesto (3) de la presente invención).

5 Compuesto (3) de la presente invención:



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,74 (1H, dd), 7,64 (1H, dd), 7,55 (1H, dd), 6,60 (1H, ancho s), 6,02 (1H, ancho s), 3,21-3,46 (2H, m), 2,49-2,69 (2H, m).

10

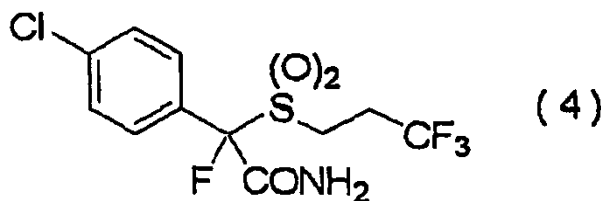
Ejemplo de producción 4

Se añadió a una solución de 0,6 g de 2-(4-clorofenil)-2-fluoro-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo en 30 ml de metanol 0,7 ml de solución 7M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 10 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,40 g de 2-(4-clorofenil)-2-fluoro-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetamida (en adelante denominado compuesto (4) de la presente invención).

15

Compuesto (4) de la presente invención:

20



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,86 (2H, d), 7,49 (2H, d), 6,57 (1H, ancho s), 5,92 (1H, ancho s), 3,20-3,45 (2H, m), 2,43-2,68 (2H, m).

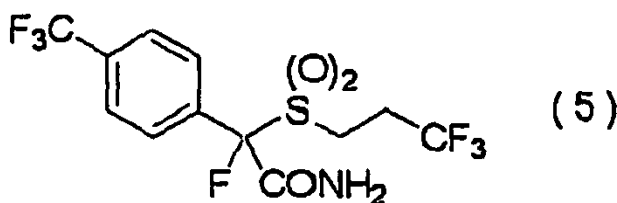
25 Ejemplo de producción 5

Se añadió a una solución de 0,4 g de 2-fluoro-2-(4-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo en 30 ml de metanol 0,4 mL de solución 7M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 4 días. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,25 g de 2-fluoro-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)-2-(4-trifluorometilfenil)acetamida (en adelante denominado compuesto (5) de la presente invención).

30

Compuesto (5) de la presente invención:

35



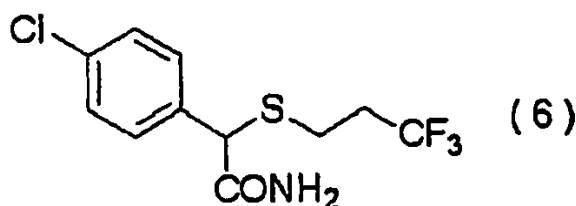
¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 8,06 (2H, d), 7,78 (2H, d), 6,58 (1H, ancho), 5,92 (1H, ancho), 3,22-3,48 (2H, m), 2,52-2,88 (2H, m).

40

Ejemplo de producción 6

Se añadió a una solución de 1,69 g de ácido 2(4-clorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfanil)acético y 0,81 g de cloruro de tionilo en 15 mL de tolueno una gota de N,N-dimetilformamida a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a 80°C durante una hora. Se concentró la mezcla de reacción. Se disolvió el residuo en 10 ml de tetrahidrofurano y se añadieron 4,0 g de solución acuosa al 28% de amoníaco a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 0,5 horas, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 1,52 g de 2-(4-clorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfanil)acetamida (en adelante denominado compuesto (6) de la presente invención.

Compuesto (6) de la presente invención



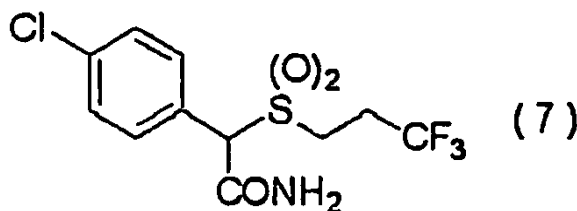
¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,36-7,34 (4H, m), 6,30 (1H, ancho), 5,89 (1H, ancho), 4,54 (1H, s), 2,81 –2,69 (2H, m), 2,46 –2,31 (2H, m).

Ejemplo de producción 7

Se añadió a una solución de 0,40 g de 2-(4-clorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfanil)acetamida en 10 ml de cloroformo, 0,76 g de ácido meta-cloroperbenzoico (67%) a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 3 horas y después se sometió a reflujo durante 10 horas.

Se lavó la mezcla de reacción sucesivamente con una solución acuosa de sulfito sódico y una solución acuosa saturada de hidrogen carbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,30 g de 2-(4-clorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetamida (en adelante denominado compuesto (7) de la presente invención)

Compuesto (7) de la presente invención:

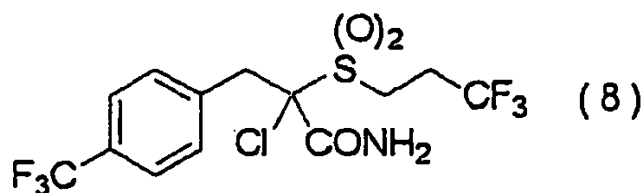


¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,76 (1H, ancho s), 7,64 –7,61 (2H, m), 7,56-7,53 (2H, m), 5,42 (1H, s), 3,57 (1H, m), 3,33-3,29 (1H, m), 2,81-2,56 (2H, m).

Ejemplo de producción 8

Se añadió a una solución de 0,33 g de 2-cloro-3-(4-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo en 3,0 ml de metanol 1,0 ml de solución 7M de amoníaco en metanol, a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 28 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,20 g de 2-cloro-3-(4-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanamida (en adelante denominado compuesto (8) de la presente invención)

Compuesto (8) de la presente invención:

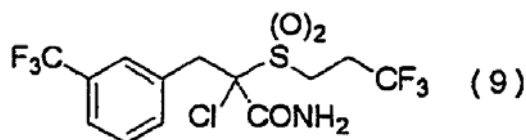


¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,61 (2H, d), 7,44 (2H, d), 6,67 (1H, ancho s), 5,77 (1H, ancho s), 4,13 (1H, d), 3,93 –3,85 (1H, m), 3,56 –3,48 (1H, m), 3,41 (1H, d), 2,83-2,76 (2H, m).

5 Ejemplo de producción 9

Se añadió a una solución de 0,23 g de 2-cloro-3-(3-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato en 3,0 ml de metanol 0,8 ml de solución 7 M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 2 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,13 g de 2-cloro-3-(3-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanamida (en adelante denominado compuesto (9) de la presente invención).

Compuesto (9) de la presente invención:

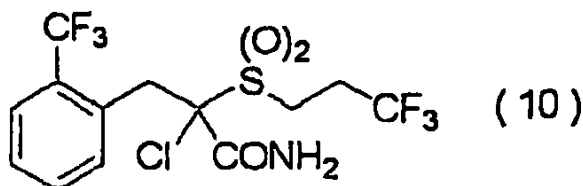


¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,61 –7,59 (2H, m), 7,52-7,45 (2H, m), 6,67 (1H, ancho s), 5,89 (1H, ancho s), 4,13 (1H, d), 3,91 –3,87 (1H, m), 3,56 –3,48 (1H, m), 3,41 (1H, d), 2,81-2,77 (2H, m).

20 Ejemplo de producción 10

Se añadió a una solución de 0,61 g de 2-cloro-3-(2-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo en 3,0 ml de metanol, 5,2 ml de una solución 7M de amoníaco en metanol a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 2 horas. Se concentró la mezcla de reacción a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna para obtener 0,20 g de 2-cloro-3-(2-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoamida (en adelante denominado compuesto (10) de la presente invención).

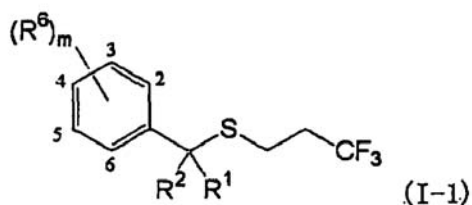
Compuesto (10) de la presente invención:



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm) 7,72 (1H, d), 7,52-7,50 (1H, m), 7,45-7,43 (2H, m), 6,95 (1H, ancho s), 6,41 (1H, ancho), 4,28 (1H, d), 3,87-3,80 (2H, m), 3,58-3,50 (1H, m), 2,82-2,76 (2H, m).

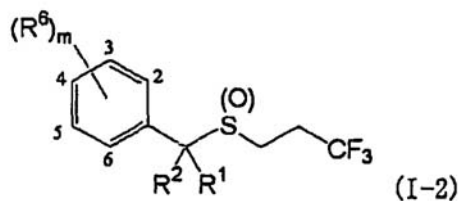
A continuación, se presentan ejemplos específicos del compuesto de la invención.

35 Un compuesto representado por la fórmula (I-1).



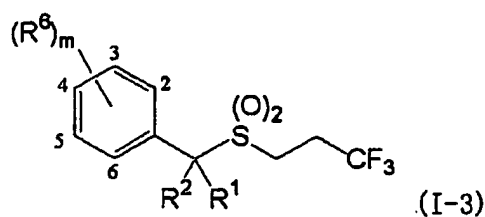
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-2):



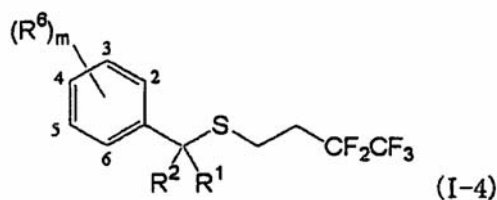
5 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-3).



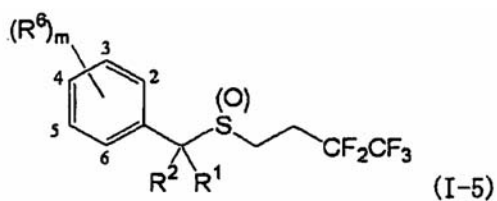
10 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-4).



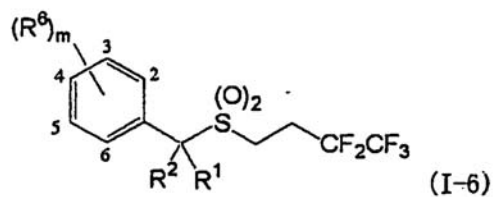
15 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-5).



20 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

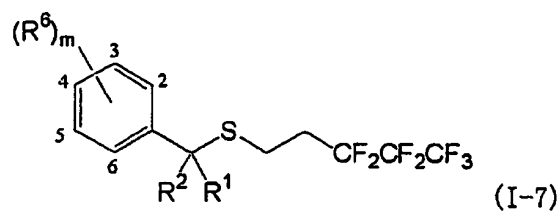
Un compuesto representado por la fórmula (I-6).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5

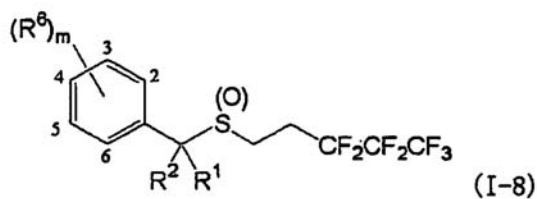
Un compuesto representado por la fórmula (I-7).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

10

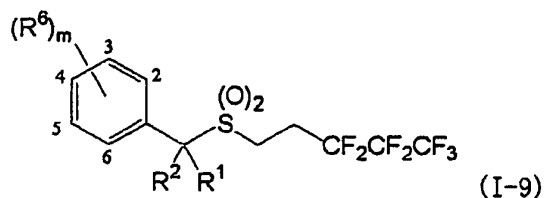
Un compuesto representado por la fórmula (I-8).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

15

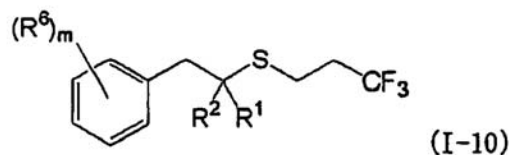
Un compuesto representado por la fórmula (I-9).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

20

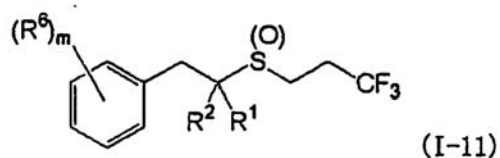
Un compuesto representado por la fórmula (I-10).



25

en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

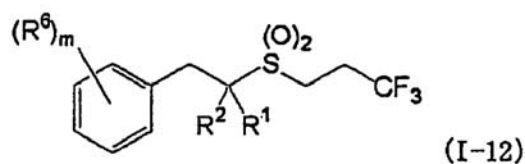
Un compuesto representado por la fórmula (I-11).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-12).

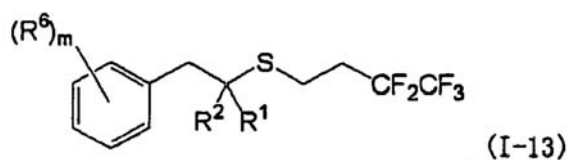
5



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-13).

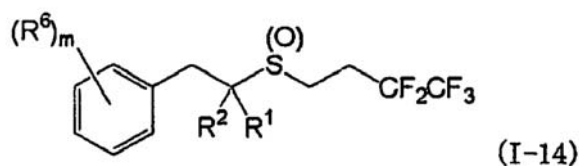
10



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-14).

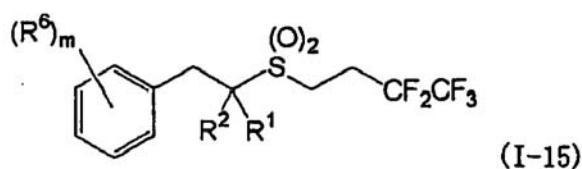
15



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-15).

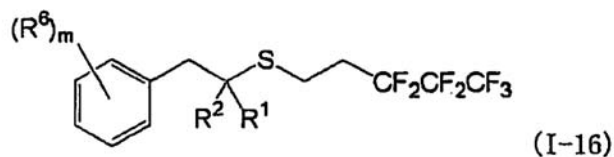
20



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

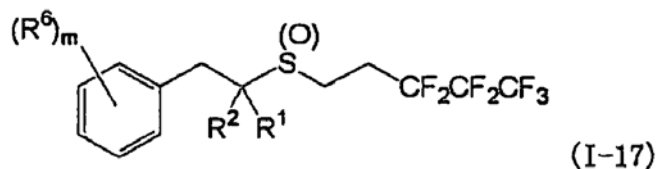
Un compuesto representado por la fórmula (I-16).

25



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-17).

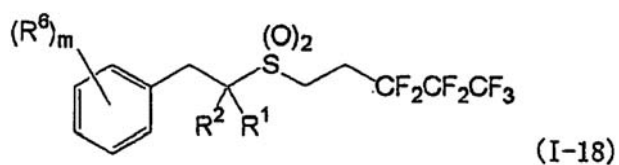


5

en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-18).

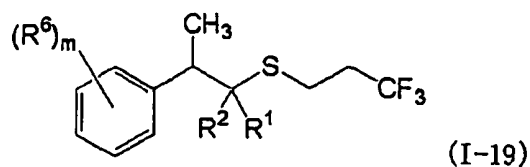
10



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-19).

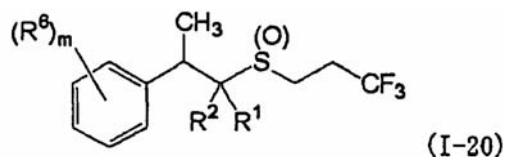
15



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-20).

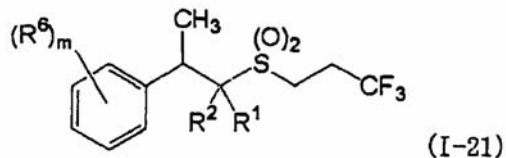
20



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-21).

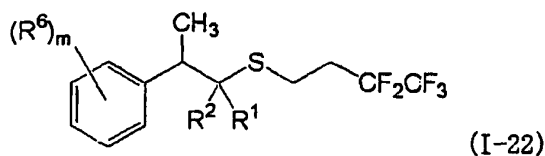
25



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

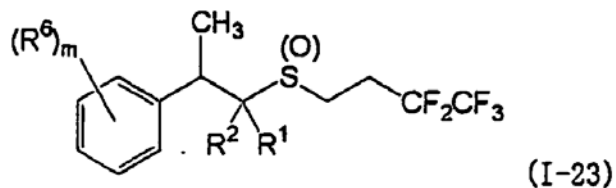
Un compuesto representado por la fórmula (I-22).

30



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

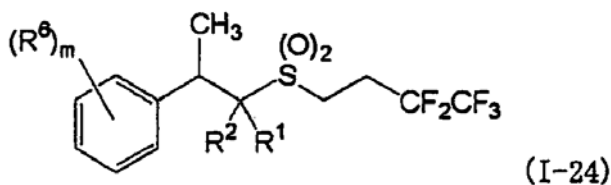
- 5 Un compuesto representado por la fórmula (I-23).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

10

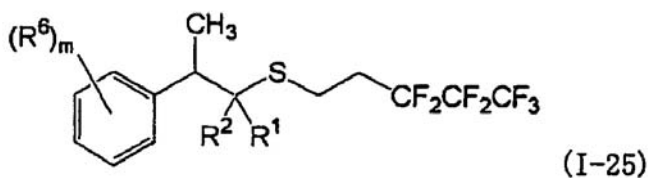
Un compuesto representado por la fórmula (I-24).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

15

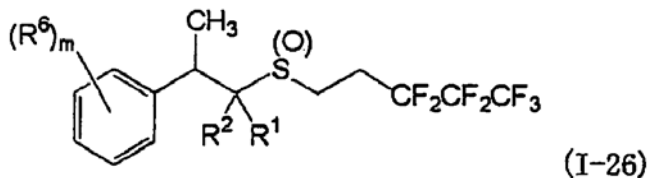
Un compuesto representado por la fórmula (I-25).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

20

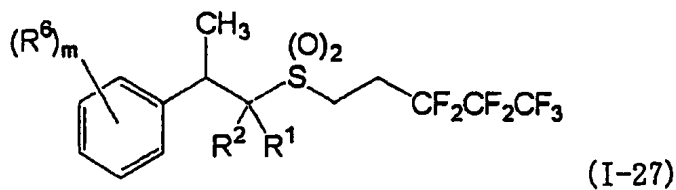
Un compuesto representado por la fórmula (I-26).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

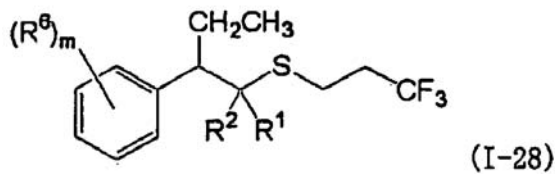
25

Un compuesto representado por la fórmula (I-27).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

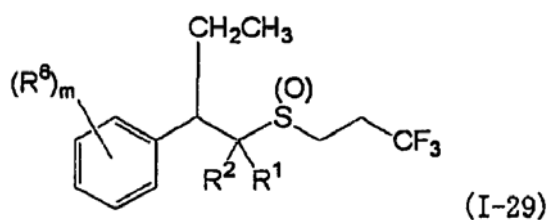
Un compuesto representado por la fórmula (I-28).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-29).

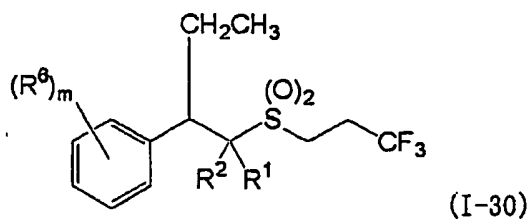
10



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

15

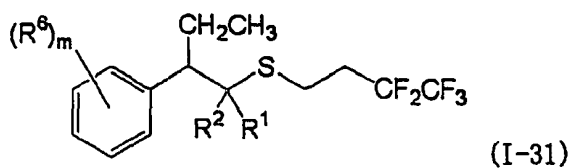
Un compuesto representado por la fórmula (I-30).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

20

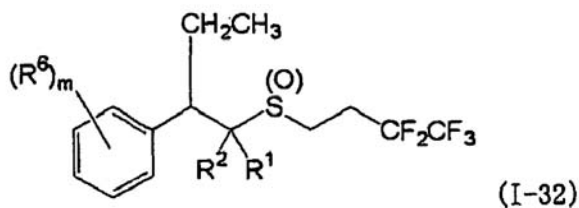
Un compuesto representado por la fórmula (I-31).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-32).

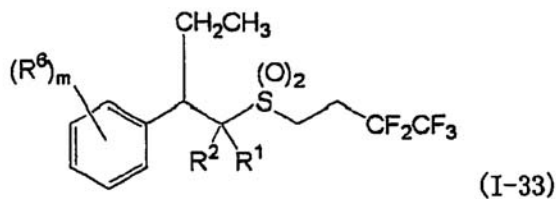
25



30

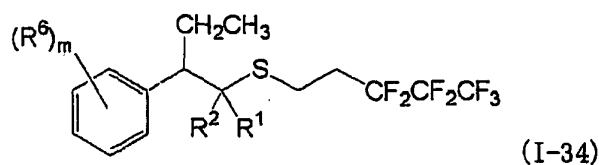
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-33).



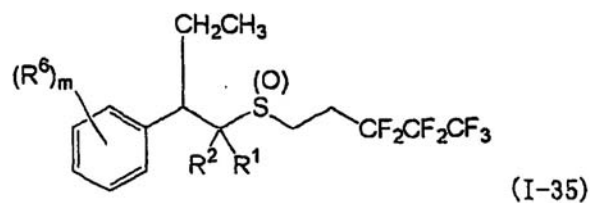
5 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-34).



10 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-35).



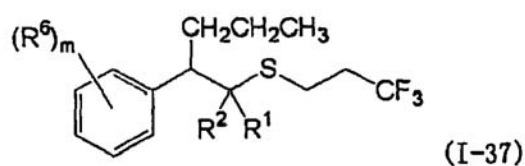
15 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-36).



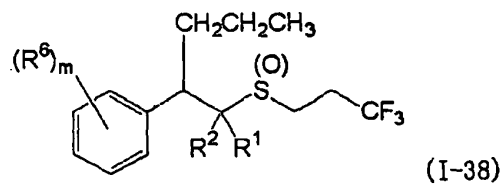
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

25 Un compuesto representado por la fórmula (I-37).



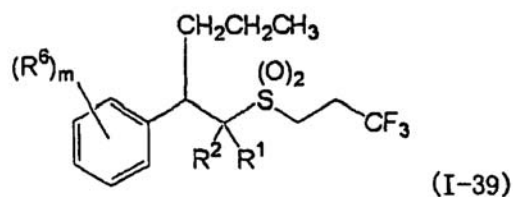
30 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-38).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

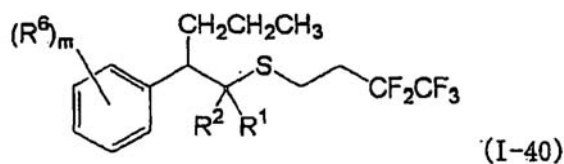
- 5 Un compuesto representado por la fórmula (I-39).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

10

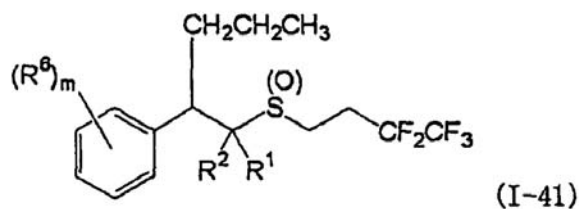
Un compuesto representado por la fórmula (I-40).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

15

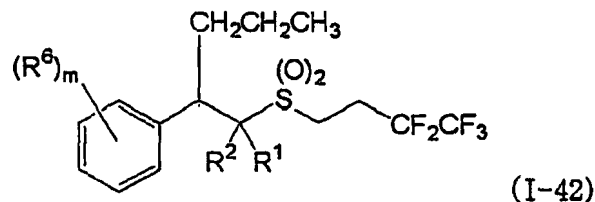
Un compuesto representado por la fórmula (I-41).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

20

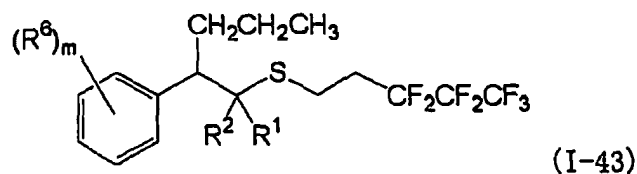
Un compuesto representado por la fórmula (I-42).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

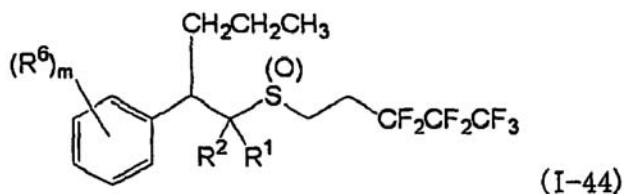
25

Un compuesto representado por la fórmula (I-43).



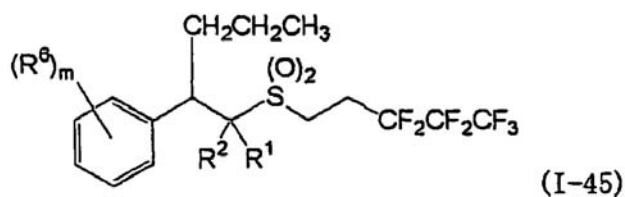
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (I-44).



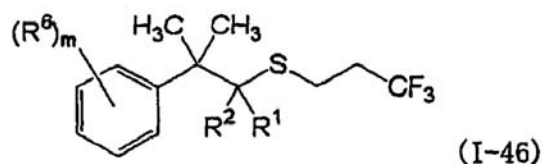
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

10 Un compuesto representado por la fórmula (I-45).



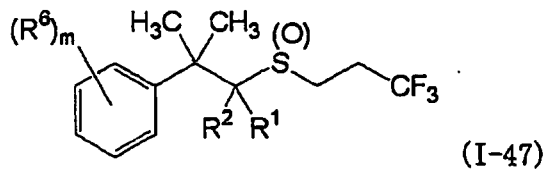
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

15 Un compuesto representado por la fórmula (I-46).



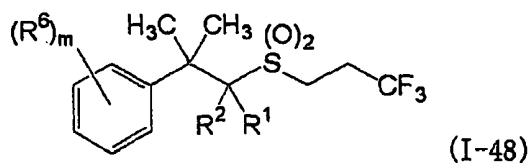
20 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-47).



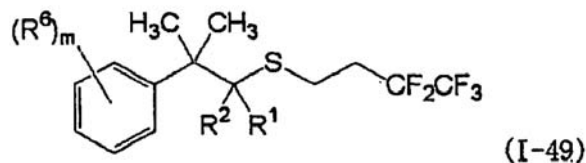
25 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-48).



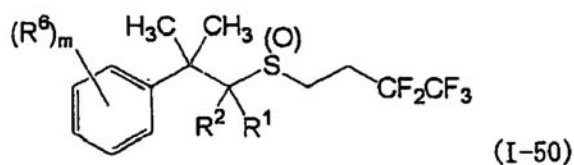
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (I-49).



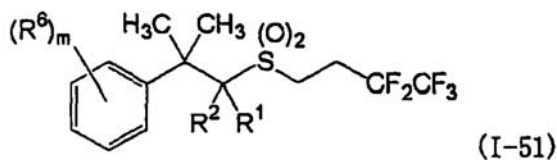
en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

10 Un compuesto representado por la fórmula (I-50).



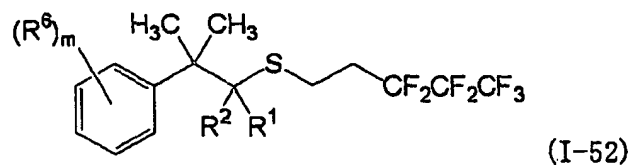
15 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-51).



20 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-52).



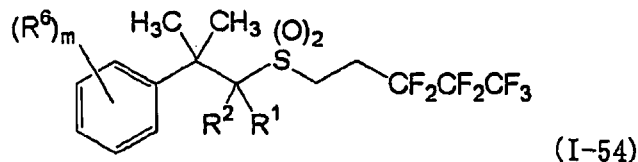
25 en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-53).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (I-54).



en el que R^1 , R^2 y $(R^6)_m$ son cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Combinaciones de R^2 , R^1 y $(R^6)_m$ para los compuestos representados por las fórmulas anteriores (I-1)-(I-54) son como siguen.

[Número de combinación: R^2 ; R^1 ; $(R^6)_m$ =

[1: H; CONH₂; 4-Cl], [2: H; CONH₂; 3-Cl],

[3: H; CONH₂; 4-F]; [4: H; CONH₂; 4-Br],

[5: H; CONH₂; 4-I]; [6: H; CONH₂; 4-CN],

[7: H; CONH₂; 4-NO₂]; [8: H; CONH₂; 4-CF₃],

[9: H; CONH₂; 3-CF₃], [10: H; CONH₂; 4-CF₂CF₃],

[11: H; CONH₂; 4-C≡CH], [12: H; CONH₂; 4-OCF₃],

[13: H; CONH₂; 4-SCF₃], [14: H; CONH₂; 4-SCH₃],

[15: H; CONH₂; 4-SOCH₃], [16: H; CONH₂; 4-SO₂CH₃],

[17: H; CONH₂; 4-Cl-3-F], [18: H; CONH₂; 4-Br-3-F],

[19: H; CONH₂; 3,4-(CH)₂], [20: H; CONH₂; 4-Cl-3-CF₃],

[21: H; CONH₂; 4-F-3-Cl], [22: H; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],

[23: H; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [24: H; CONHCH₃; 4-Cl],

[25: H; CONHCH₃; 3-Cl], [26: H; CONHCH₃; 4-F],

[27: H; CONHCH₃; 4-Br], [28: H; CONHCH₃; 4-I],

[29: H; CONHCH₃; 4-CN], [30: H; CONHCH₃; 4-NO₂],

[31: H; CONHCH₃; 4-CH₃], [32: H; CONHCH₃; 3-CF₃],

[33: H; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃], [34: H; CONHCH₃; 4-C≡CH],

[35: H; CONHCH₃; 4-OCF₃], [36: H; CONHCH₃; 4-SCF₃],

[37: H; CONHCH₃; 4-SCH₃], [38: H; CONHCH₃; 4-SOCH₃],

[39: H; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃], [40: H; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],

[41: H; CONHCH₃; 4-Br-3-F], [42: H; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],

[43: H; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃], [44: H; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],

[45: H; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₃], [46: H; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],

[47: H; CONHCH₂CH₃], 4-Cl [48: H; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],

[49: H; CONHCH₂CH₃; 4-F], [50: H; CONHCH₂CH₃; 4-Br],

[51: H; CONHCH₂CH₃; 4-I], [52: H; CONHCH₂CH₃; 4-CN],

[53: H; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂], [54: H; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],

[55: H; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃], [56: H; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],

[57: H; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH], [58: H; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],

[59: H; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃], [60: H; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],

[61: H; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃], [62: H; CONHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],

[63: H; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F], [64: H; CONHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],

[65: H; CONHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂], [66: H; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],

[67: H; CONHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl], [68: H; CONHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],

[69: H; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂], [70: H; CON(CH₃)₂; 4-Cl],

[71: H; CON(CH₃)₂; 3-Cl], [72: H; CON(CH₃)₂; 4-F],

[73: H; CON(CH₃)₂; 4-Br], [74: H; CON(CH₃)₂; 4-I],

[75: H; CON(CH₃)₂; 4-CN], [76: H; CON(CH₃)₂; 4-NO₂],

[77: H; CON(CH₃)₂; 4-CF₃], [78: H; CON(CH₃)₂; 3-CF₃],

[79: H; CON(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [80: H; CON(CH₃)₂; 4-C≡CH],

[81: H; CON(CH₃)₂; 4-OCF₃], [82: H; CON(CH₃)₂; 4-SCF₃],

[83: H; CON(CH₃)₂; 4-SCH₃], [84: H; CON(CH₃)₂; 4-SOCH₃],

[85: H; CON(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [86: H; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],

[87: H; CON(CH₃)₂; 4-Br-3-F], [88: H; CON(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],

[89: H; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃], [90: H; CON(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],

[91: H; CON(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃], [92: H; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],

[93: H; CON(CH₂H₃)₂; 4-Cl], [94: H; CON(CH₂H₃)₂; 3-Cl],

- [95: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F], [96: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [97: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-I], [98: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 [99: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂], [100: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 5 [101: H; CON(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃], [102: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [103: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH], [104: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [105: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃], [106: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [107: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃], [108: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [109: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [110: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 10 [111: H; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [112: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [113: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [114: H; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [115: H; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [116: H; CSNH₂; 4-Cl],
 15 [117: H; CSNH₂; 3-Cl], [118: H; CSNH₂; 4-F],
 [119: H; CSNH₂; 4-Br], [120: H; CSNH₂; 4-I],
 [121: H; CSNH₂; 4-CN], [122: H; CSNH₂; 4-NO₂],
 [123: H; CSNH₂; 4-CF₃], [124: H; CSNH₂; 3-CF₃],
 20 [125: H; CSNH₂; 4-CF₂CF₃], [126: H; CSNH₂; 4-C≡CH],
 [127: H; CSNH₂; 4-OCF₃], [128: H; CSNH₂; 4-SCF₃],
 [129: H; CSNH₂; 4-SCH₃], [130: H; CSNH₂; 4-SOCH₃],
 [131: H; CSNH₂; 4-SO₂CH₃], [132: H; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 [133: H; CSNH₂; 4-Br-3-F], [134: H; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 [135: H; CSNH₂; 4-Cl-CF₃], [136: H; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 25 [137: H; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃], [138: H; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [139: H; CSNHCH₃; 4-Cl], [140: H; CSNHCH₃; 3-Cl],
 [141: H; CSNHCH₃; 4-F], [142: H; CSNHCH₃; 4-Br],
 [143: H; CSNHCH₃; 4-I], [144: H; CSNHCH₃; 4-CN],
 [145: H; CSNHCH₃; 4-NO₂], [146: H; CSNHCH₃; 4-CF₃],
 30 [147: H; CSNHCH₃; 3-CF₃], [148: H; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [149: H; CSNHCH₃; 4-C≡CH], [150: H; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 [151: H; CSNHCH₃; 4-SCF₃], [152: H; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 [153: H; CSNHCH₃; 4-SOCH₃], [154: H; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [155: H; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F], [156: H; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 35 [157: H; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂], [158: H; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [159: H; CSNHCH₃; 4-F-3-Cl], [160: H; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [161: H; CSNHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂], [162: H; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl],
 [163: H; CSNHCH₃; 3-Cl], [164: H; CSNHCH₂CH₃; 4-F],
 [165: H; CSNHCH₂CH₃; 4-Br], [166: H; CSNHCH₂CH₃; 4-I],
 40 [167: H; CSNHCH₂CH₃; 4-CN], [168: H; CSNHCH₂CH₃; 4-NO₂],
 [169: H; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₃], [170: H; CSNHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [171: H; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃], [172: H; CSNHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [173: H; CSNHCH₂CH₃; 4-OCF₃], [174: H; CSNHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 [175: H; CSNHCH₂CH₃; 4-SCH₃], [176: H; CSNHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 45 [177: H; CSNHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃], [178: H; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 [179: H; CSNHCH₂CH₃; 4-Br-3-F], [180: H; CSNHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [181: H; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃], [182: H; CSNHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 [183: H; CSNHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [184: H; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5(F)₂],
 50 [185: H; CSN(CH₃)₂; 4-Cl], [186: H; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 [187: H; CSN(CH₃)₂; 4-F], [188: H; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 [189: H; CSN(CH₃)₂; 4-I], [190: H; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 [191: H; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂], [192: H; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [193: H; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃], [194: H; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 55 [195: H; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH], [196: H; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [197: H; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃], [198: H; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [199: H; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃], [200: H; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [201: H; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [202: H; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [203: H; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂], [204: H; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 60 [205: H; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [206: H; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [207: H; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [208: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 [209: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-Cl], [210: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [211: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br], [212: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 [213: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CN], [214: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 65 [215: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃], [216: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [217: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [218: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],

- 5 [219 H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃], [220: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [221 H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃], [222: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [223 H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [224: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [225 H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F], [226: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [227 H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [228: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [229 H; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [230: H; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [231: F; CONH₂; 4-Cl], [232; F; CONH₂; 3-Cl],
 10 [233: F; CONH₂; 4-F], [234; F; CONH₂; 4-Br],
 [235: F; CONH₂; 4-I], [236; F; CONH₂; 4-CN],
 [237: F; CONH₂; 4-NO₂][238: F; CONH₂; 4-CF₃],
 [239: F; CONH₂; 3-CF₃], [240: F; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [241: F; CONH₂; 4-C≡CH], [242: F; CONH₂; 4-OCF₃],
 15 [243: F; CONH₂; 4-SCF₃], [244: F; CONH₂; 4-SCH₃],
 [245: F; CONH₂; 4-SOCH₃], [246: F; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 [247: F; CONH₂; 4-Cl-3-F], [248: F; CONH₂; 4-Br-3-F],
 [249: F; CONH₂; 3,4-(CH)₂], [250: F; CONH₂; 4-Cl-3- CF₃],
 [251: F; CONH₂; 4-F-3-Cl], [252: F; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],
 20 [253: F; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [254: F; CONHCH₃; 4-Cl],
 [255: F; CONHCH₃; 3-Cl], [256: F; CONHCH₃; 4-F],
 [257: F; CONHCH₃; 4-Br], [258: F; CONHCH₃; 4-I],
 [259: H; CONHCH₃; 4-CN], [260: F; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [261: F; CONHCH₃; 4-CH₃], [262: F; CONHCH₃; 3-CF₃],
 25 [263: F; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃], [264: F; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 [265: F; CONHCH₃; 4-OCF₃], [266: F; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [267: F; CONHCH₃; 4-SCH₃], [268: F; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 [269: F; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃], [270: F; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [271: F; CONHCH₃; 4-Br-3-F], [272: F; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 30 [273: F; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃], [274: F; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 [275: F; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₂], [276: F; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [277: F; CONHCH₂CH₃], 4-Cl [278: F; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],
 [279: H ; CONHCH₂CH₃; 4-F], [280: F; CONHCH₂CH₃; 4-Br],
 [281: F; CONHCH₂CH₃; 4-I], [282: F; CONHCH₂CH₃; 4-CN],
 35 [283: F; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂], [284: F; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],
 [285: F; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃], [286: F; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],
 [287: F; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH], [288: F; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 [289: F; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃], [290: F; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [291: F; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃], [292: F; CONHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 40 [293: F; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F], [294: F; CONHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 [295: F; CONHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂], [296: F; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [297: F; CONHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl], [298: F; CONHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [299: F; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5-(F)], [300: F; CON (CH₃)₂; 4-Cl],
 [301: F; CON(CH₃)₂; 3-Cl], [302: F; CON(CH₃)₂; 4-F],
 45 [303: F; CON(CH₃)₂; 4-Br], [304: F; CON(CH₃)₂; 4-I],
 [305: F; CON(CH₃)₂; 4-CN], [306: F; CON(CH₃)₂; 4-NO₂],
 [307: F; CON(CH₃)₂; 4-CF₃], [308: F; CON(CH₃)₂; 3-CF₃],
 [309: F; CON(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [310: F; CON(CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [311: F; CON(CH₃)₂; 4-OCF₃], [312: F; CON(CH₃)₂; 4-SCF₃],
 50 [313: F; CON(CH₃)₂; 4-SCH₃], [314: F; CON(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [315: F; CON(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [316: F; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [317: F; CON(CH₃)₂; 4-Br-3-F], [318: F; CON(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [319: F; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃], [320: F; CON(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [321: F; CON(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃], [322: F; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 55 [323: F; CON(CH₂H₃)₂; 4-Cl], [324: F; CON(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [325: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F], [326: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [327: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-I], [328: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 [329: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂], [330: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 [331: F; CON(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃], [332: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 60 [333: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH], [334: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [335: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃], [336: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [337: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃], [338: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [339: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [340: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [341: F; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 65 [342: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [343: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],

- [344: F; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [345: F; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)], [346: F; CSNH₂; 4-Cl],
 [347: F; CSNH₂; 3-Cl], [348: F; CSNH₂; 4-F],
 5 [349: F; CSNH₂; 4-Br], [350: F; CSNH₂; 4-I],
 [351: F; CSNH₂; 4-CN], [352: F; CSNH₂; 4-NO₂],
 [353: F; CSNH₂; 4-CF₃], [354: F; CSNH₂; 3-CF₃],
 [355: F; CSNH₂; 4-CF₂CF₃], [356: F; CSNH₂; 4-C≡CH],
 [357: F; CSNH₂; 4-OCF₃], [358: F; CSNH₂; 4-SCF₃],
 10 [359: F; CSNH₂; 4-SCH₃], [360: F; CSNH₂; 4-SOCH₃],
 [361: F; CSNH₂; 4-SO₂CH₃], [362: F; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 [363: F; CSNH₂; 4-Br-3-F], [364: F; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 [365: F; CSNH₂; 4-Cl-3-CF₃], [366: F; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 [367: F; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃], [368: F; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [369: F; CSNHCH₃; 4-Cl], [370: F; CSNHCH₃; 3-Cl],
 15 [371: F; CSNHCH₃; 4-F], [372: F; CSNHCH₃; 4-Br],
 [373: F; CSNHCH₃; 4-I], [374: F; CSNHCH₃; 4-CN],
 [375: F; CSNHCH₃; 4-NO₂], [376: F; CSNHCH₃; 4-CF₃],
 [377: F; CSNHCH₃; 3-CF₃], [378: F; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [379: F; CSNHCH₃; 4-C≡CH], [380: F; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 20 [381: F; CSNHCH₃; 4-SCF₃], [382: F; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 [383: F; CSNHCH₃; 4-SOCH₃], [384: F; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [385: F; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F], [386: F; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 [387: F; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂], [388: F; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [389: F; CSNHCH₃; 4-F-3-Cl], [390: F; CSNHCH₃; 3,4,5-(F)₃],
 25 [391: F; CSNHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)], [392: F; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl],
 [393: F; CSNHCH₂CH₃; 3-Cl], [394: F; CSNHCH₂CH₃; 4-F],
 [395: F; CSNHCH₂CH₃; 4-Br], [396: F; CSNHCH₂CH₃; 4-I],
 [397: F; CSNHCH₂CH₃; 4-CN], [398: F; CSNHCH₂CH₃; 4-NO₂],
 [399: F; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₃], [400: F; CSNHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 30 [401: F; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃], [402: F; CSNHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [403: F; CSNHCH₂CH₃; 4-OCF₃], [404: F; CSNHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 [405: F; CSNHCH₂CH₃; 4-SCH₃], [406: F; CSNHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 [407: F; CSNHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃], [408: F; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 [409: F; CSNHCH₂CH₃; 4-Br-3-F], [410: F; CSNHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 35 [411: F; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃], [412: F; CSNHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 [413: F; CSNHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [414: F; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [415: F; CSN(CH₃)₂; 4-Cl], [416: F; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 [417: F; CSN(CH₃)₂; 4-F], [418: F; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 40 [419: F; CSN(CH₃)₂; 4-I], [420: F; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 [421: F; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂], [422: F; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [423: F; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃], [424: F; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [425: F; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH], [426: F; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [427: F; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃], [428: F; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 45 [429: F; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃], [430: F; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [431: F; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [432: F; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [433: F; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂], [434: F; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [435: F; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [436: F; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [437: F; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)], [438: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 50 [439: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-Cl], [440: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [441: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br], [442: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 [443: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CN], [444: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 [445: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃], [446: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [447: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [448: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 55 [449: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃], [450: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [451: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃], [452: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [453: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [454: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [455: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F], [456: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [457: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 60 [458: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [459: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [460: F; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [461: Cl; CONH₂; 4-Cl], [462: Cl; CONH₂; 3-Cl],
 [463: Cl; CONH₂; 4-F], [464: Cl; CONH₂; 4-Br],
 65 [465: Cl; CONH₂; 4-I], [466: Cl; CONH₂; 4-CN],
 [467: Cl; CONH₂; 4-NO₂] [468: Cl; CONH₂; 4-CF₃],

- [469: Cl; CONH₂; 3-CF₃], [470: Cl; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [471: Cl; CONH₂; 4-C≡CH], [472: Cl; CONH₂; 4-OCF₃],
 [473: Cl; CONH₂; 4-SCF₃], [474: Cl; CONH₂; 4-SCH₃],
 5 [475: Cl; CONH₂; 4-SOCH₃], [476: Cl; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 [477: Cl; CONH₂; 4-Cl-3-F], [478: Cl; CONH₂; 4-Br-3-F],
 [479: Cl; CONH₂; 3,4-(CH₂)₂], [480: Cl; CONH₂; 4-Cl-3- CF₃],
 [481: Cl; CONH₂; 4-F-3-Cl], [482: Cl; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],
 [483: Cl; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [484: Cl; CONHCH₃; 4-Cl],
 10 [485: Cl; CONHCH₃; 3-Cl], [486: Cl; CONHCH₃; 4-F],
 [487: Cl; CONHCH₃; 4-Br], [488: Cl; CONHCH₃; 4-I],
 [489: Cl; CONHCH₃; 4-CN], [490: Cl; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [491: Cl; CONHCH₃; 4-C-F₃], [492: Cl; CONHCH₃; 3-CF₃],
 [493: Cl; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃], [494: Cl; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 15 [495: Cl; CONHCH₃; 4-OCF₃], [496: Cl; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [497: Cl; CONHCH₃; 4-SCH₃], [498: Cl; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 [499: Cl; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃], [500: Cl; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [501: Cl; CONHCH₃; 4-Br-3-F], [502: Cl; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [503: Cl; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃], [504: Cl; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 20 [505: Cl; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₃], [506: Cl; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [507: Cl; CONHCH₂CH₃], 4-Cl [508: Cl; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],
 [509: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-F], [510: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-Br],
 [511: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-I], [512: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-CN],
 [513: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂], [514: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],
 25 [515: Cl; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃], [516: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],
 [517: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH], [518: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 [519: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃], [520: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [521: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃], [522: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 [523: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F], [524: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 [525: Cl; CONHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂], [526: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 30 [527: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl], [528: Cl; CONHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [529: Cl; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5-(F)], [530: Cl; CON(CH₃)₂; 4-Cl],
 [531: Cl; CON(CH₃)₂; 3-Cl], [532: Cl; CON(CH₃)₂; 4-F],
 [533: Cl; CON(CH₃)₂; 4-Br], [534: Cl; CON(CH₃)₂; 4-I],
 [535: Cl; CON(CH₃)₂; 4-CN], [536: Cl; CON(CH₃)₂; 4-NO₂],
 35 [537: Cl; CON(CH₃)₂; 4-CF₃], [538: Cl; CON(CH₃)₂; 3-CF₃],
 [539: Cl; CON(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [540: Cl; CON(CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [541: Cl; CON(CH₃)₂; 4-OCF₃], [542: Cl; CON(CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [543: Cl; CON(CH₃)₂; 4-SCH₃], [544: Cl; CON(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [545: Cl; CON(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [546: Cl; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 40 [547: Cl; CON(CH₃)₂; 4-Br-3-F], [548: Cl; CON(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [549: Cl; CON(CH₃)₂; 4-Cl-CF₃], [550: Cl; CON(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [551: Cl; CON(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [552: Cl; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 45 [553: Cl; CON(CH₂H₃)₂; 4-Cl], [554: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [555: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F], [556: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [557: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-I], [558: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 [559: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂], [560: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 [561: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃], [562: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 50 [563: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH], [564: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [565: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃], [566: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [567: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃], [568: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [569: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [570: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [571: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 55 [572: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [573: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [574: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [575: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)],
 [576: Cl; CSNH₂; 4-Cl],
 60 [577: Cl; CSNH₂; 3-Cl], [578: Cl; CSNH₂; 4-F],
 [579: Cl; CSNH₂; 4-Br], [580: Cl; CSNH₂; 4-I],
 [581: Cl; CSNH₂; 4-CN], [582: Cl; CSNH₂; 4-NO₂],
 [583: Cl; CSNH₂; 4-CF₃], [584: Cl; CSNH₂; 3-CF₃],
 [585: Cl; CSNH₂; 4-CF₂CF₃], [586: Cl; CSNH₂; 4-C≡CH],
 65 [587: Cl; CSNH₂; 4-OCF₃], [588: Cl; CSNH₂; 4-SCF₃],
 [589: Cl; CSNH₂; 4-SCH₃], [590: Cl; CSNH₂; 4-SOCH₃],

- 5 [591: Cl; CSNH₂; 4-SO₂CH₃], [592: Cl; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 [593: Cl; CSNH₂; 4-Br-3-F], [594: Cl; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 [595: Cl; CSNH₂; 4-Cl-3-CF₃], [596: Cl; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 [597: Cl; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃], [598: Cl; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [599: Cl; CSNHCH₃; 4-Cl], [600: Cl; CSNHCH₃; 3-Cl],
 [601: Cl; CSNHCH₃; 4-F], [602: Cl; CSNHCH₃; 4-Br],
 [603: Cl; CSNHCH₃; 4-I], [604: Cl; CSNHCH₃; 4-CN],
 [605: Cl; CSNHCH₃; 4-NO₂], [606: Cl; CSNHCH₃; 4-CF₃],
 [607: Cl; CSNHCH₃; 3-CF₃], [608: Cl; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 10 [609: Cl; CSNHCH₃; 4-C≡CH], [610: Cl; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 [611: Cl; CSNHCH₃; 4-SCF₃], [612: Cl; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 [613: Cl; CSNHCH₃; 4-SOCH₃], [614: Cl; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [615: Cl; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F], [616: Cl; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 [617: Cl; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂], [618: Cl; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 15 [619: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [620: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [621: Cl; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)], [622: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl],
 [623: Cl; CSNHCH₂CH₃; 3-Cl], [624: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-F],
 [625: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-Br], [626: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-I],
 [627: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-CN], [628: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-NO₂],
 20 [629: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₃], [630: Cl; CSNHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [631: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃], [632: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [633: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-OCF₃], [634: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 [635: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-SCH₃], [636: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 [637: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃], [638: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 25 [639: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-Br-3-F], [640: Cl; CSNHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [641: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃], [642: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 [643: Cl; CSNHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [644: Cl; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [645: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-Cl], [646: Cl; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 30 [647: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-F], [648: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 [649: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-I], [650: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 [651: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂], [652: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [653: Cl; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃], [654: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [655: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH], [656: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 35 [657: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃], [658: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [659: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃], [660: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [661: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [662: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [663: Cl; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂], [664: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [665: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [666: Cl; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 40 [667: Cl; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)], [668: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 [669: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-Cl], [670: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [671: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br], [672: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 [673: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CN], [674: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 45 [675: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃], [676: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [677: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [678: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [679: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃], [680: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [681: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃], [682: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [683: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [684: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 50 [685: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [686: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [687: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [688: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [689: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 55 [690: Cl; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [691: Br; CONH₂; 4-Cl], [692: Br; CONH₂; 3-Cl],
 [691: Br; CONH₂; 4-F], [994: Br; CONH₂; 4-Br],
 [6995: Br; CONH₂; 4-I], [696: Br; CONH₂; 4-CN],
 [697: Br; CONH₂; 4-NO₂], [698: Br; CONH₂; 4-CF₃],
 60 [699: Br; CONH₂; 3-CF₃], [700: Br; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [701: Br; CONH₂; 4-C≡CH], [702: Br; CONH₂; 4-OCF₃],
 [703: Br; CONH₂; 4-SCF₃], [704: Br; CONH₂; 4-SCH₃],
 [705: Br; CONH₂; 4-SOCH₃], [706: Br; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 [707: Br; CONH₂; 4-Cl-3-F], [708: Br; CONH₂; 4-Br-3-F],
 65 [709: Br; CONH₂; 3,4-(Cl)₂], [710: Br; CONH₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [711: Br; CONH₂; 4-F-3-Cl], [712: Br; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],

- [713: Br; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [714: Br; CONHCH₃; 4-Cl],
 [715: Br; CONHCH₃; 3-Cl], [716: Br; CONHCH₃; 4-F],
 [717: Br; CONHCH₃; 4-Br], [718: Br; CONHCH₃; 4-I],
 5 [719: Br; CONHCH₃; 4-CN], [720: Br; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [721: Br; CONHCH₃; 4-CF₃], [722: Br; CONHCH₃; 3-CF₃],
 [723: Br; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃], [724: Br; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 [725: Br; CONHCH₃; 4-OCF₃], [726: Br; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [727: Br; CONHCH₃; 4-SCH₃], [728: Br; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 10 [729: Br; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃], [730: Br; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [731: Br; CONHCH₃; 4-Br-3-F], [732: Br; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [733: Br; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃], [734: Br; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 [735: Br; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₃], [736: Br; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [737: Br; CONHCH₂CH₃; 4-Cl] [738: Br; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],
 15 [739: Br; CONHCH₂CH₃; 4-F], [740: Br; CONHCH₂CH₃; 4-Br],
 [741: Br; CONHCH₂CH₃; 4-I], [742: Br; CONHCH₂CH₃; 4-CN],
 [743: Br; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂], [744: Br; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],
 [745: Br; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃], [746: Br; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],
 [747: Br; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH], [748: Br; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 20 [749: Br; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃], [750: Br; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [751: Br; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃], [752: Br; CONHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 [753: Br; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F], [754: Br; CONHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 [755: Br; CONHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂], [756: Br; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [757: Br; CONHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl], [758: Br; CONHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 25 [759: Br; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂], [760: Br; CON(CH₃)₂; 4-Cl],
 [761: Br; CON(CH₃)₂; 3-Cl], [762: Br; CON(CH₃)₂; 4-F],
 [763: Br; CON(CH₃)₂; 4-Br], [764: Br; CON(CH₃)₂; 4-I],
 [765: Br; CON(CH₃)₂; 4-CN], [766: Br; CON(CH₃)₂; 4-NO₂],
 [767: Br; CON(CH₃)₂; 4-CF₃], [768: Br; CON(CH₃)₂; 3-CF₃],
 30 [769: Br; CON(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [770: Br; CON(CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [771: Br; CON(CH₃)₂; 4-OCF₃], [772: Br; CON(CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [773: Br; CON(CH₃)₂; 4-SCH₃], [774: Br; CON(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [775: Br; CON(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [776: Br; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [777: Br; CON(CH₃)₂; 4-Br-3-F], [778: Br; CON(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 35 [779: Br; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃], [780: Br; CON(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [781: Br; CON(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃], [782: Br; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [783: Br; CON(CH₂H₃)₂; 4-Cl], [784: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [785: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F], [786: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [787: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-I], [788: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 40 [789: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂], [790: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 [791: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃], [792: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [793: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH], [794: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [795: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃], [796: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [797: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃], [798: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 45 [799: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [800: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [801: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [802: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [803: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 50 [804: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [805: Br; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)],
 [806: Br; CSNH₂; 4-Cl],
 [807: Br; CSNH₂; 3-Cl], [808: Br; CSNH₂; 4-F],
 [809: Br; CSNH₂; 4-Br], [810: Br; CSNH₂; 4-I],
 55 [811: Br; CSNH₂; 4-CN], [812: Br; CSNH₂; 4-NO₂],
 [813: Br; CSNH₂; 4-CF₃], [814: Br; CSNH₂; 3-CF₃],
 [815: Br; CSNH₂; 4-CF₂CF₃], [816: Br; CSNH₂; 4-C=CH],
 [817: Br; CSNH₂; 4-OCF₃], [818: Br; CSNH₂; 4-SCF₃],
 [819: Br; CSNH₂; 4-SCH₃], [820: Br; CSNH₂; 4-SOCH₃],
 [821: Br; CSNH₂; 4-SO₂CH₃], [822: Br; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 60 [823: Br; CSNH₂; 4-Br-3-F], [824: Br; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 [825: Br; CSNH₂; 4-Cl-3-CF₃], [826: Br; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 [827: Br; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃], [828: Br; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [829: Br; CSNHCH₃; 4-Cl], [830: Br; CSNHCH₃; 3-Cl],
 [831: Br; CSNHCH₃; 4-F], [832: Br; CSNHCH₃; 4-Br],
 65 [833: Br; CSNHCH₃; 4-I], [834: Br; CSNHCH₃; 4-CN],
 [835: Br; CSNHCH₃; 4-NO₂], [836: Br; CSNHCH₃; 4-CF₃],

- 5 [837: Br; CSNHCH₃; 3-CF₃], [838: Br; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [839: Br; CSNHCH₃; 4-C≡CH], [840: Br; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 [841: Br; CSNHCH₃; 4-SCF₃], [842: Br; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 [843: Br; CSNHCH₃; 4-SOCH₃], [844: Br; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [845: Br; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F], [846: Br; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 [847: Br; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂],[848: Br; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [849: Br; CSNHCH₃; 4-F-3-Cl], [850: Br; CSNHCH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [851: Br; CSNHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)], [852: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl],
 [853: Br; CSNHCH₂CH₃; 3-Cl],[854: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-F],
 10 [855: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-Br], [856: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-I],
 [857: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-CN], [858: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-NO₂],
 [859: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₃], [860: Br; CSNHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [861: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],[862: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [863: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-OCF₃], [864: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 15 [865: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-SCH₃], [866: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 [867: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃], [868: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 [869: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-Br-3-F], [870: Br; CSNHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [871: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃], [182: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 [873: Br; CSNHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃-],
 20 [874: Br; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [875: Br; CSN(CH₃)₂; 4-Cl], [876: Br; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 [877: Br; CSN(CH₃)₂; 4-F], [878: Br; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 [879: Br; CSN(CH₃)₂; 4-I], [880: Br; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 25 [881: Br; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂], [882: Br; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [883: Br; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃], [884: Br; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [885: Br; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH], [886: Br; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [887: Br; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃], [888: Br; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [889: Br; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃], [890: Br; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [891: Br; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [892: Br; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 30 [893: Br; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],[894: Br; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [895: Br; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [896: Br; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [897: Br; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [898: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 [899: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],[900: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [901: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br], [902: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 35 [903: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CN], [904: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 [905: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃], [906: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [907: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],[908: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [909: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃], [910: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [911: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃], [912: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 40 [913: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [914: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [915: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F], [916: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [917: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3CF₃],
 [918: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [919: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃-],
 45 [920: Br; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [921: CH₃; CONH₂; 4-Cl], [922: CH₃; CONH₂; 3-Cl],
 [923: CH₃; CONH₂; 4-F], [924: CH₃; CONH₂; 4-Br],
 [925: CH₃; CONH₂; 4-I], [926: CH₃; CONH₂; 4-CN],
 [927: CH₃; CONH₂; 4-NO₂],[928: CH₃; CONH₂; 4-CF₃],
 50 [929: CH₃; CONH₂; 3-CF₃], [930: CH₃; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [931: CH₃; CONH₂; 4-C≡CH], [932: CH₃; CONH₂; 4-OCF₃],
 [933: CH₃; CONH₂; 4-SCF₃], [934: CH₃; CONH₂; 4-SCH₃],
 [935: CH₃; CONH₂; 4-SOCH₃], [936: CH₃; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 [937: CH₃; CONH₂; 4-Cl-3-F], [938: CH₃; CONH₂; 4-Br-3-F],
 55 [939: CH₃; CONH₂; 3,4-(Cl)₂], [940: CH₃; CONH₂; 4-Cl-3- CF₃],
 [941: CH₃; CONH₂; 4-F-3-Cl], [942: CH₃; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],
 [943: CH₃; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [944: CH₃; CONHCH₃; 4-Cl],
 [945: CH₃; CONHCH₃; 3-Cl], [946: CH₃; CONHCH₃; 4-F],
 [947: CH₃; CONHCH₃; 4-Br], [948: CH₃; CONHCH₃; 4-I],
 60 [949: CH₃; CONHCH₃; 4-CN], [950: CH₃; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [951: CH₃; CONHCH₃; 4-CF₃], [952: CH₃; CONHCH₃; 3-CF₃],
 [953: CH₃; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃], [954: CH₃; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 [955: CH₃; CONHCH₃; 4-OCF₃], [956: CH₃; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [957: CH₃; CONHCH₃; 4-SCH₃], [958: CH₃; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 65 [959: CH₃; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃], [960: CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [961: CH₃; CONHCH₃; 4-Br-3-F], [962: CH₃; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],

- [963: CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃], [964: CH₃; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 [965: CH₃; CONHCH₃; 3,4,5-(F)], [966: CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [967: CH₃; CONHCH₂CH₃], 4-Cl [968: CH₃; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],
 5 [969: H ; CONHCH₂CH₃; 4-F], [970: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Br],
 [971: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-I], [972: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CN],
 [973: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂], [974: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],
 [975: CH₃; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃], [976: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],
 [977: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH], [978: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 10 [979: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃], [980: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [981: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃], [982: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 [983: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F], [984: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 [985: CH₃; CONHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂], [986: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [987: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl], [988: CH₃; CONHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 15 [989: CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5-(F)], [990: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl],
 [991: CH₃; CON(CH₃)₂; 3-Cl], [992: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-F],
 [993: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Br], [994: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-I],
 [995: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-CN], [996: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-NO₂],
 [997: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-CF₃], [998: CH₃; CON(CH₃)₂; 3-CF₃],
 20 [999: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [1000: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [1001: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-OCF₃], [1002: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [1003: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SCH₃], [1004: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1005: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [1006: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1007: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Br-3-F], [1008: CH₃; CON(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 25 [1009: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃], [1010: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1011: CH₃; CON(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃], [1012: CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1013: CH₃; CON(CH₂H₃)₂; 4-Cl], [1014: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [1015: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F], [1016: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [1017: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-I], [1018: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 30 [1019: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂], [1020: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 [1021: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃], [1022: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1023: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH], [1024: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [1025: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃], [1026: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [1027: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃], [1028: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 35 [1029: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [1030: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1031: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1032: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1033: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1034: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 40 [1035: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)],
 [1036: CH₃; CSNH₂; 4-Cl],
 [1037: CH₃; CSNH₂; 3-Cl], [1038: CH₃; CSNH₂; 4-F],
 [1039: CH₃; CSNH₂; 4-Br], [1040: CH₃; CSNH₂; 4-I],
 [1041: CH₃; CSNH₂; 4-CN], [1042: CH₃; CSNH₂; 4-NO₂],
 45 [1043: CH₃; CSNH₂; 4-CF₃], [1044: CH₃; CSNH₂; 3-CF₃],
 [1045: CH₃; CSNH₂; 4-CF₂CF₃], [1046: CH₃; CSNH₂; 4-C≡CH],
 [1047: CH₃; CSNH₂; 4-OCF₃], [1048: CH₃; CSNH₂; 4-SCF₃],
 [1049: CH₃; CSNH₂; 4-SCH₃], [1050: CH₃; CSNH₂; 4-SOCH₃],
 [1051: CH₃; CSNH₂; 4-SO₂CH₃], [1052: CH₃; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 50 [1053: CH₃; CSNH₂; 4-Br-3-F], [1054: CH₃; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1055: CH₃; CSNH₂; 4-Cl-3-CF₃], [1056: CH₃; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 [1057: CH₃; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃], [1058: CH₃; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1059: CH₃; CSNHCH₃; 4-Cl], [1060: CH₃; CSNHCH₃; 3-Cl],
 [1061: CH₃; CSNHCH₃; 4-F], [1062: CH₃; CSNHCH₃; 4-Br],
 55 [1063: CH₃; CSNHCH₃; 4-I], [1064: CH₃; CSNHCH₃; 4-CN],
 [1065: CH₃; CSNHCH₃; 4-NO₂], [1066: CH₃; CSNHCH₃; 4-CF₃],
 [1067: CH₃; CSNHCH₃; 3-CF₃], [1068: CH₃; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [1069: CH₃; CSNHCH₃; 4-C≡CH], [1070: CH₃; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 [1071: CH₃; CSNHCH₃; 4-SCF₃], [1072: CH₃; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 60 [1073: CH₃; CSNHCH₃; 4-SOCH₃], [1074: CH₃; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [1075: CH₃; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F], [1076: CH₃; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 [1077: CH₃; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂], [1078: CH₃; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [1079: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [1080: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1081: CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)], [1082: CH₃; CSNH₂; 4-Cl],
 65 [1083: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3-Cl], [1084: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-F],
 [1085: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Br], [1086: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-I],
 [1087: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-CN], [1088: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-NO₂],

[1089: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₃], [1090: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [1091: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃], [1092: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [1093: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-OCF₃], [1094: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 5 [1095: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SCH₃], [1096: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 [1097: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 [1098: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 [1099: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 [1100: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 10 [1101: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [1102: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 [1103: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃-],
 [1104: CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1105: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl], [1106: CH₃; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 15 [1107: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-F], [1108: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 [1109: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-I], [1110: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 [1111: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂], [1112: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [1113: CH₃; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃], [1114: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1115: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH], [1116: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 20 [1117: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃], [1118: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [1119: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃], [1120: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1121: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F], [1122: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1123: CH₃; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂], [1124: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1125: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl], [1126: CH₃; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 25 [1127: CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [1128: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 [1129: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-Cl], [1130: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [1131: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br], [1132: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 [1133: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CN], [1134: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 [1135: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃], [1136: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 30 [1137: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃], [1138: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [1139: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃], [1140: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [1141: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃], [1142: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1143: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃], [1144: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1145: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F], [1146: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 35 [1147: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1148: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1149: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃-],
 [1150: CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1151: CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl], [1152: CH₂CH₃; CONH₂; 3-Cl],
 40 [1153: CH₂CH₃; CONH₂; 4-F], [1154: CH₂CH₃; CONH₂; 4-Br],
 [1155: CH₂CH₃; CONH₂; 4-I], [1156: CH₂CH₃; CONH₂; 4-CN],
 [1157: CH₂CH₃; CONH₂; 4-NO₂], [1158: CH₂CH₃; CONH₂; 4-CF₃],
 [1159: CH₂CH₃; CONH₂; 3-CF₃], [1160: CH₂CH₃; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [1161: CH₂CH₃; CONH₂; 4-C≡CH], [1162: CH₂CH₃; CONH₂; 4-OCF₃],
 45 [1163: CH₂CH₃; CONH₂; 4-SCF₃], [1164: CH₂CH₃; CONH₂; 4-SCH₃],
 [1165: CH₂CH₃; CONH₂; 4-SOCH₃], [1166: CH₂CH₃; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 [1167: CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl-3-F], [1168: CH₂CH₃; CONH₂; 4-Br-3-F],
 [1169: CH₂CH₃; CONH₂; 3,4-(CH)₂], [1170: CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1171: CH₂CH₃; CONH₂; 4-F-3-Cl], [1172: CH₂CH₃; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],
 50 [1173: CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂], [1174: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl],
 [1175: CH₂CH₃; CONHCH₃; 3-Cl], [1176: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-F],
 [1177: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Br], [1178: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-I],
 [1179: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-CN], [1180: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [1181: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-CF₃], [1182: CH₂CH₃; CONHCH₃; 3-CF₃],
 55 [1183: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃], [1184: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 [1185: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-OCF₃], [1186: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [1187: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SCH₃], [1188: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 [1189: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃], [1190: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [1191: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Br-3-F], [1192: CH₂CH₃; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 60 [1193: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃], [1194: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 [1195: CH₂CH₃; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₃], [1196: CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1197: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃], [1198: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],
 [1199: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-F], [1200: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Br],
 [1201: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-I], [1202: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CN],
 [1203: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂], [1204: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],
 65 [1205: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [1206: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],

- [1207: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [1208: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 [1209: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 5 [1210: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [1211: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 [1212: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 [1213: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 [1214: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 10 [1215: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [1216: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [1217: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 [1218: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [1219: CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1220: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl],
 15 [1221: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 3-Cl], [1222: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-F],
 [1223: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Br], [1224: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-I],
 [1225: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-CN], [1226: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-NO₂],
 [1227: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-CF₃], [1228: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 3-CF₃],
 [1229: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 20 [1230: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [1231: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-OCF₃], [1132: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [1233: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [1234: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1235: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 25 [1236: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1237: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1238: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1239: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1240: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 30 [1241: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1242: CH₂CH₃; CON(CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1243: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 [1244: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [1245: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 35 [1246: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [1247: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 [1248: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 [1249: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 [1250: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 40 [1251: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [1252: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1253: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [1254: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [1255: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 45 [1256: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [1257: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1258: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1259: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1260: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 50 [1261: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1262: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1263: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1264: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1265: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)],
 55 [1266: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Cl],
 [1267: CH₂CH₃; CSNH₂; 3-Cl], [1268: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-F],
 [1269: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Br], [1270: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-I],
 [1271: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-CN], [1272: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-NO₂],
 [1273: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-CF₃], [1274: CH₂CH₃; CSNH₂; 3-CF₃],
 60 [1275: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-CF₂CF₃], [1276: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-C≡CH],
 [1277: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-OCF₃], [1278: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-SCF₃],
 [1279: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-SCH₃], [1280: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-SOCH₃],
 [1281: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-SO₂CH₃], [1282: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 [1283: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Br-3-F], [1284: CH₂CH₃; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 65 [1285: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Cl-3-CF₃], [1286: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 [1287: CH₂CH₃; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃],

- [1288: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1289: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-Cl], [1290: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 3-Cl],
 [1291: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-F], [1292: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-Br],
 5 [1293: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-I], [1294: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-CN],
 [1295: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-NO₂], [1296: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-CF₃],
 [1297: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 3-CF₃], [1298: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [1299: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-C≡CH], [1300: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 [1301: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-SCF₃], [1302: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 10 [1303: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-SOCH₃], [1304: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [1305: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [1306: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 [1307: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [1308: CH₂CH₃; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 15 [1309: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1310: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1311: CH₂CH₃; CON(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1312: CH₂CH₃; CSNH₂; 4-Cl],
 [1313: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3-Cl],[1314: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-F],
 20 [1315: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Br], [1316: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-I],
 [1317: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-CN], [1318: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-NO₂],
 [1319: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₃], [1320: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [1321: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],
 25 [1322: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [1323: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 [1324: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 [1325: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [1326: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],
 [1327: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-SO₂CH₃],
 30 [1328: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-F],
 [1329: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Br-3-F],
 [1330: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [1331: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [1332: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-F-3-Cl],
 35 [1333: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [1334: CH₂CH₃; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1335: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl], [1336: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 [1337: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-F], [1338: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 [1339: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-I], [1340: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 40 [1341: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂], [1342: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [1343: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃],
 [1344: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1345: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH], [1346: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [1347: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃], [1348: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 45 [1349: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1350: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1351: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1352: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1353: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 50 [1354: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1355: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1356: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1357: CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1358: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 55 [1359: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [1360: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [1361: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [1362: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-I],
 [1363: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 60 [1364: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 [1365: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 [1366: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [1367: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1368: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 65 [1369: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [1370: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [1371: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],

- [1372: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1373: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1374: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 5 [1375: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1376: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1377: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1378: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1379: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 10 [1380: CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1381: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl],
 [1382: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 3-Cl],
 [1383: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-F],
 [1384: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-Br],
 15 [1385: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-I],
 [1386: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-CN],
 [1387: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-NO₂],
 [1388: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-CF₃],
 [1389: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 3-CF₃],
 20 [1390: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [1391: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-C≡CH],
 [1392: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-OCF₃],
 [1393: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-SCF₃],
 [1394: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-SCH₃],
 25 [1395: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-SOCH₃],
 [1396: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 [1167: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl-3-F],
 [1398: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-Br-3-F],
 [1399: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 3,4-(Cl)₂],
 30 [1400: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1401: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-F-3-Cl],
 [1402: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1403: CH₂CH₂CH₃; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1404: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl],
 35 [1405: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 3-Cl], [1406: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-F],
 [1407: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Br], [1408: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-I],
 [1409: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-CN], [1410: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [1411: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-CF₃], [1412: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 3-CF₃],
 [1413: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 40 [1414: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 [1415: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-OCF₃],
 [1416: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [1417: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SCH₃],
 [1418: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 45 [1419: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [1420: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [1421: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Br-3-F],
 [1422: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [1423: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [1424: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 50 [1425: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₃],
 [1426: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1427: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Cl],
 [1428: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 3-Cl],
 [1429: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-F],
 55 [1430: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-Br],
 [1431: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-I],
 [1432: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CN],
 [1433: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-NO₂],
 [1434: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CF₃],
 60 [1435: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 3-CF₃],
 [1436: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-CF₂CF₃],
 [1437: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-C≡CH],
 [1438: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-OCF₃],
 [1439: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SCF₃],
 65 [1440: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SCH₃],
 [1441: CH₂CH₂CH₃; CONHCH₂CH₃; 4-SOCH₃],

	[1442: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1443: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl-3-F],
	[1444: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 4-Br-3-F],
5	[1445: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1446: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl-3-CF ₃],
	[1447: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 4-F-3-Cl],
	[1448: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 3,4,5-(F) ₃],
	[1449: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CONHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl-3,5-(F)],
10	[1450: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl],
	[1451: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 3-Cl],
	[1452: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-F],
	[1453: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Br],
	[1454: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-I],
15	[1455: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-CN],
	[1456: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-NO ₂],
	[1457: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-CF ₃],
	[1458: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 3-CF ₃],
	[1459: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-CF ₂ CF ₃],
20	[1460: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-C≡CH],
	[1461: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-OCF ₃],
	[1462: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SCF ₃],
	[1463: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SCH ₃],
	[1464: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SOCH ₃],
25	[1465: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1466: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-F],
	[1467: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Br-3-F],
	[1468: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1469: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-CF ₃],
30	[1470: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-F-3-Cl],
	[1471: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 3,4,5-(F) ₃],
	[1472: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3,5(F) ₂],
	[1473: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ H ₃) ₂ ; 4-Cl],
	[1474: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 3-Cl],
35	[1475: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-F],
	[1476: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-Br],
	[1477: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-I],
	[1478: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-CN],
	[1479: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-NO ₂],
40	[1480: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-CF ₃],
	[1481: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 3-CF ₃],
	[1482: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-CF ₂ CF ₃],
	[1483: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-C≡CH],
45	[1484: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-OCF ₃],
	[1485: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-SCF ₃],
	[1486: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-SCH ₃],
	[1487: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-SOCH ₃],
	[1488: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1489: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-F],
50	[1490: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-Br-3-F],
	[1491: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1492: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-CF ₃],
	[1493: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-F-3-Cl],
	[1494: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 3,4,5-(F) ₃],
55	[1495: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CON(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3,5-(F)],
	[1496: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-Cl],
	[1497: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 3-Cl], [1498: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-F],
	[1499: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-Br], [1500: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-I],
	[1501: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-CN], [1502: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-NO ₂],
60	[1503: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-CF ₃], [1504: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 3-CF ₃],
	[1505: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-CF ₂ CF ₃], [1506: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-C≡CH],
	[1507: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-OCF ₃], [1508: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-SCF ₃],
	[1509: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-SCH ₃], [1510: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-SOCH ₃],
	[1511: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-SO ₂ CH ₃],
65	[1512: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-Cl-3-F],
	[1513: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-Br-3-F],
	[1514: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 3,4-(Cl) ₂],

	[1515: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-Cl-3-CF ₃],
	[1516: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-F-3-Cl],
	[1517: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 3,4,5-(F) ₃ -],
5	[1518: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNH ₂ ; 4-Cl-3,5(F) ₂],
	[1519: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-Cl], [1520: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 3-Cl],
	[1521: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-F], [1522: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-Br],
	[1523: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-I], [1524: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-CN],
	[1525: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-NO ₂], [1526: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-CF ₃],
10	[1527: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 3-CF ₃],
	[1528: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-CF ₂ CF ₃],
	[1529: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-C≡CH],
	[1530: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-OCF ₃],
	[1531: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-SCF ₃],
15	[1532: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-SCH ₃],
	[1533: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-SOCH ₃],
	[1534: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1535: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-Cl-3-F],
	[1536: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-Br-3-F],
20	[1537: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1538: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-Cl-3-CF ₃],
	[1539: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-F-3-Cl],
	[1540: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 3,4,5-(F) ₃],
	[1541: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₃ ; 4-Cl-3,5-(F)],
25	[1542: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl],
	[1543: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 3-Cl],
	[1544: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-F],
	[1545: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-Br],
	[1546: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-I],
30	[1547: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-CN],
	[1548: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-NO ₂],
	[1549: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-CF ₃],
	[1550: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 3-CF ₃],
	[1551: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-CF ₂ CF ₃],
35	[1552: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-C≡CH],
	[1553: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-OCF ₃],
	[1554: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-SCF ₃],
	[1555: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-SCH ₃],
	[1556: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-SOCH ₃],
40	[1557: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1558: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl-3-F],
	[1559: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-Br-3-F],
	[1560: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1561: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl-3-CF ₃],
45	[1562: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-F-3-Cl],
	[1563: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 3,4,5-(F) ₃ -],
	[1564: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSNHCH ₂ CH ₃ ; 4-Cl-3,5(F) ₂],
	[1565: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-Cl],
	[1566: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 3-Cl],
50	[1567: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-F],
	[1568: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-Br],
	[1569: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-I],
	[1570: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-CN],
	[1571: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-NO ₂],
55	[1572: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-CF ₃],
	[1573: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 3-CF ₃],
	[1574: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-CF ₂ CF ₃],
	[1575: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-C≡CH],
	[1576: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-OCF ₃],
60	[1577: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-SCF ₃],
	[1578: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-SCH ₃],
	[1579: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-SOCH ₃],
	[1580: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1581: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-F],
65	[1582: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-Br-3-F],
	[1583: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1584: CH ₂ CH ₂ CH ₃ ; CSN(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-CF ₃],

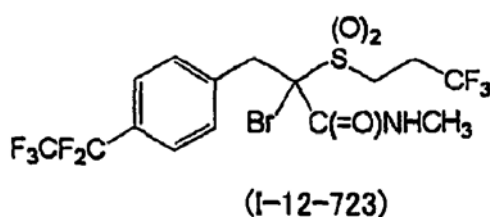
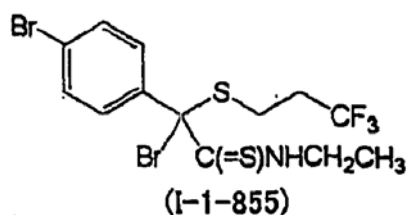
- [1585: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1586: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1587: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 5 [1588: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-Cl],
 [1589: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 3-Cl],
 [1590: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-F],
 [1591: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-Br],
 [1592: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-I],
 10 [1593: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-CN],
 [1594: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-NO₂],
 [1595: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-CF₃],
 [1596: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 3-CF₃],
 [1597: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 15 [1598: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-C≡CH],
 [1599: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [1600: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-SCF₃],
 [1601: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [1602: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 20 [1603: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1604: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1605: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1606: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1607: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1608: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 25 [1609: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1610: CH₂CH₂CH₃; CSN(CH₂CH₂CH₃)₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1611: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-Cl], [1612: CH(CH₃)₂; CONH₂; 3-Cl],
 [1613: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-F],[1614: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-Br],
 [1615: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-I],[1616: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-CN],
 30 [1617: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-NO₂],[1618: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-CF₃],
 [1619: CH(CH₃)₂; CONH₂; 3-CF₃],[1620: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-CF₂CF₃],
 [1621: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-C≡CH], [1622: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-OCF₃],
 [1623: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-SCF₃], [1624: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-SCH₃],
 [1625: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-SOCH₃], [1626: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-SO₂CH₃],
 35 [1627: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-Cl-3-F],
 [1628: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-Br-3-F],
 [1629: CH(CH₃)₂; CONH₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1630: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-Cl-3- CF₃],
 [1631: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-F-3-Cl],
 40 [1632: CH(CH₃)₂; CONH₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1633: CH(CH₃)₂; CONH₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1634: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-Cl],
 [1635: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 3-Cl],[1636: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-F],
 45 [1637: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-Br],[1638: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-I],
 [1639: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-CN],[1640: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-NO₂],
 [1641: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-CF₃],[1642: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 3-CF₃],
 [1643: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [1644: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-C≡CH],
 50 [1645: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-OCF₃],
 [1646: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-SCF₃],
 [1647: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-SCH₃],
 [1648: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-SOCH₃],
 [1649: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 55 [1650: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [1651: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-Br-3-F],
 [1652: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [1653: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 [1654: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-F-3-Cl],
 [1655: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 3,4,5-(F)₃],
 60 [1656: CH(CH₃)₂; CONHCH₃; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1657: CH(CH₃)₂; CONHCH(CH₃)₂; 4-Cl],
 [1658: CH(CH₃)₂; CONHCH(CH₃)₂; 3-Cl],
 [1659: CH(CH₃)₂; CONHCH(CH₃)₂; 4-F],
 [1660: CH(CH₃)₂; CONHCH(CH₃)₂; 4-Br],
 65 [1661: CH(CH₃)₂; CONHCH(CH₃)₂; 4-I],
 [1662: CH(CH₃)₂; CONHCH(CH₃)₂; 4-CN],

	[1663: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-NO ₂],
	[1664: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-CF ₃],
	[1665: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 3-CF ₃],
5	[1666: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-CF ₂ CF ₃],
	[1667: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-C≡CH],
	[1668: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-OCF ₃],
	[1669: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-SCF ₃],
	[1670: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-SCH ₃],
10	[1671: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-SOCH ₃],
	[1672: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1673: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-Cl-3-F],
	[1674: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-Br-3-F],
	[1675: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 3,4-(Cl) ₂],
	[1676: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-Cl-3-CF ₃],
15	[1677: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-F-3-Cl],
	[1678: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 3,4,5-(F) ₃],
	[1679: CH(CH3)2; CONHCH(CH3)2; 4-Cl-3,5-(F) ₂],
	[1680: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl],
20	[1681: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 3-Cl],
	[1682: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-F],
	[1683: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Br],
	[1684: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-I],
	[1685: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-CN],
25	[1686: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-NO ₂],
	[1687: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-CF ₃],
	[1688: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 3-CF ₃],
	[1689: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-CF ₂ CF ₃],
	[1690: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-C≡CH],
30	[1691: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-OCF ₃],
	[1692: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SCF ₃],
	[1693: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SCH ₃],
	[1694: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SOCH ₃],
	[1695: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-SO ₂ CH ₃],
35	[1696: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-F],
	[1697: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Br-3-F],
	[1698: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1699: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3-CF ₃],
	[1700: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-F-3-Cl],
40	[1701: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 3,4,5-(F) ₃],
	[1702: CH(CH3)2; CON(CH ₃) ₂ ; 4-Cl-3,5(F) ₂],
	[1703: CH(CH3)2; CON(CH ₂ H ₃) ₂ ; 4-Cl],
	[1704: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 3-Cl],
	[1705: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-F],
45	[1706: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-Br],
	[1707: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-I],
	[1708: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-CN],
	[1709: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-NO ₂],
	[1710: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-CF ₃],
50	[1711: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 3-CF ₃],
	[1712: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-CF ₂ CF ₃],
	[1713: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-C≡CH],
	[1714: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-OCF ₃],
	[1715: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-SCF ₃],
55	[1716: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-SCH ₃],
	[1717: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-SOCH ₃],
	[1718: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-SO ₂ CH ₃],
	[1719: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-Cl-3-F],
	[1720: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-Br-3-F],
60	[1721: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 3,4-(Cl) ₂],
	[1722: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-Cl-3-CF ₃],
	[1723: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-F-3-Cl],
	[1724: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 3,4,5-(F) ₃],
	[1725: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2) ₂ ; 4-Cl-3,5-(F)],
65	[1726: CH(CH3)2; CSNH ₂ ; 4-Cl],
	[1727: CH(CH3)2; CSNH ₂ ; 3-Cl], [1728: CH(CH3)2; CSNH ₂ ; 4-F],
	[1729: CH(CH3)2; CSNH ₂ ; 4-Br], [1730: CH(CH3)2; CSNH ₂ ; 4-I],

- 5 [1731: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-CN], [1732: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-NO₂],
 [1733: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-CF₃],[1734: CH(CH3)2; CSNH₂; 3-CF₃],
 [1735: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-CF₂CF₃],[1736: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-C≡CH],
 [1737: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-OCF₃], [1738: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-SCF₃],
 [1739: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-SCH₃], [1740: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-SOCH₃],
 [1741: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-SO₂CH₃],
 [1742: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-Cl-3-F],
 [1743: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-Br-3-F],
 [1744: CH(CH3)2; CSNH₂; 3,4-(Cl)₂],
 10 [1745: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1746: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-F-3-Cl],
 [1747: CH(CH3)2; CSNH₂; 3,4,5-(F)₃-],
 [1748: CH(CH3)2; CSNH₂; 4-Cl-3,5(F)₂],
 15 [1749: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-Cl], [1750: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 3-Cl],
 [1751: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-F], [1752: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-Br],
 [1753: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-I], [1754: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-CN],
 [1755: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-NO₂], [1756: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-CF₃],
 [1757: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 3-CF₃],
 20 [1758: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-CF₂CF₃],
 [1759: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-C≡CH],
 [1760: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-OCF₃],
 [1761: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-SCF₃],
 [1762: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-SCH₃],
 25 [1763: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-SOCH₃],
 [1764: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-SO₂CH₃],
 [1765: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-Cl-3-F],
 [1766: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-Br-3-F],
 [1767: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 3,4-(Cl)₂],
 [1768: CH(CH3)2; CSNHCH₃; 4-Cl-3-CF₃],
 30 [1769: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2)₂; 4-F-3-Cl],
 [1770: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1771: CH(CH3)2; CON(CH(CH3)2)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1772: CH(CH3)2; CSNHCH₂CH₃; 4-Cl],
 [1773: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 3-Cl],
 35 [1774: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-F],
 [1775: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-Br],
 [1776: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-I],
 [1777: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-CN],
 [1778: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-NO₂],
 40 [1779: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-CF₃],
 [1780: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 3-CF₃],
 [1781: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-CF₂CF₃],
 [1782: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-C≡CH],
 45 [1783: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-OCF₃],
 [1784: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-SCF₃],
 [1785: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-SCH₃],
 [1786: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-SOCH₃],
 [1787: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-SO₂CH₃],
 50 [1788: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-Cl-3-F],
 [1789: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-Br-3-F],
 [1790: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 3,4-(Cl)₂],
 [1791: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-Cl-3-CF₃],
 [1792: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-F-3-Cl],
 [1793: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 3,4,5-(F)₃-],
 55 [1794: CH(CH3)2; CSNHCH(CH3)2; 4-Cl-3,5(F)₂],
 [1795: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-Cl],
 [1796: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 3-Cl],
 [1797: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-F], [1798: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-Br],
 [1799: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-I], [1800: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-CN],
 60 [1801: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-NO₂],
 [1802: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-CF₃],
 [1803: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 3-CF₃],
 [1804: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1805: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-C≡CH],
 65 [1806: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-OCF₃],
 [1807: CH(CH3)2; CSN(CH₃)₂; 4-SCF₃],

- 5 [1808: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-SCH₃],
 [1809: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-SOCH₃],
 [1810: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1811: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-F],
 [1812: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-Br-3-F],
 [1813: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 3,4-(Cl)₂],
 [1814: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1185: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-F-3-Cl],
 [1186: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 3,4,5-(F)₃],
 10 [1817: CH(CH₃)₂; CSN(CH₃)₂; 4-Cl-3,5-(F)₂],
 [1188: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-Cl],
 [1819: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 3-Cl],
 [1820: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-F],
 [1821: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-Br],
 15 [1822: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-I],
 [1823: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-CN],
 [1824: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-NO₂],
 [1825: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-CF₃],
 [1826: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 3-CF₃],
 20 [1827: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-CF₂CF₃],
 [1828: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-C≡CH],
 [1829: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-OCF₃],
 [1830: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-SCF₃],
 [1831: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-SCH₃],
 25 [1832: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-SOCH₃],
 [1833: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-SO₂CH₃],
 [1834: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-Cl-3-F],
 [1835: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-Br-3-F],
 [1836: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 3,4-(Cl)₂],
 30 [1837: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-Cl-3-CF₃],
 [1838: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-F-3-Cl],
 [1839: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 3,4,5-(F)₃],
 [1840: CH(CH₃)₂; CSN(CH(CH₃)₂)₂; 4-Cl-3,5(F)₂].

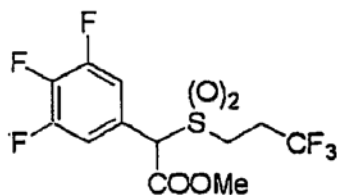
- 35 Entre los compuestos definidos por las fórmulas (I-1) a (I-54) anteriores y las combinaciones anteriores de R¹, R² y (R⁶)_m, por ejemplo, un compuesto definido por la fórmula (I-1) y la combinación N° 855 (denominado compuesto (I-1-855)) y el compuesto definido por la fórmula (I-12) y la combinación del N° 723 (denominado compuesto (I-12-723)) son los siguientes compuestos.



- 40 A continuación, se presentan Ejemplos de Producción de Referencia para la producción de los compuestos intermedios de la presente invención.

Ejemplo de producción de referencia 1

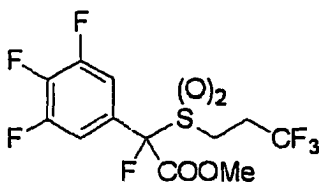
- 45 Se añadieron a una solución de 0,5 g de 5-bromo-1,2,3-trifluorobenceno y 0,72 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo en 20 ml 1,4-dioxano 0,28 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en líquido de parafina), 49 mg de tris(dibencilidenacetona)(cloroformo)dipaladio (0) y 75 mg de trifetilfosfina a temperatura ambiente y se agitó la mezcla a 80°C durante 48 horas. Se añadió a la mezcla de reacción ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,54 g de
- 50 (3,4,5-trifluorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo representado por la fórmula:



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,29 (2H, dd), 4,95 (1H, s), 3,91 (3H, s), 3,18-3,56 (2H, m), 2,48-2,76 (2H, m).

Ejemplo de Producción de referencia 2

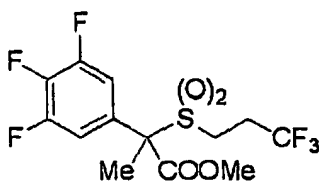
5 Se añadió a una suspensión de 0,11 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida) en 30 ml de tetrahidrofurano 1,0 g de (3,4,5-trifluorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se añadió 0,79 g de trifluorometanosulfonato de 1-fluoro-2,4,6-trimetilpiridinio. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 2 horas, y se añadió 10 ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,99 g de fluoro-(3,4,5-trifluorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo representado por la fórmula:



15 ¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,50 (2H, dd), 4,00 (3H, s), 3,33-3,46 (2H, m), 2,61-2,76 (2H, m).

Ejemplo de producción de referencia

20 Se añadió a una suspensión de 0,11 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida) en 30 ml de N,N-dimetilformamida 1,0 g de (3,4,5-trifluorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se añadió 0,39 g de yoduro de metilo. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 48 horas, y se añadió 25 ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,92 g de 2-(3,4,5-trifluorofenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)propanoato de metilo representado por la siguiente fórmula:

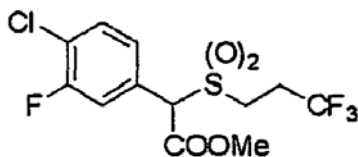


30 ¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,20 (2H, dd), 3,94 (3H, s), 3,05-3,70 (2H, m), 2,39-2,73 (2H, m), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de producción de referencia 4

35 Se añadió a una solución de 3,0 g de 2-fluoro4-yodoclorobenceno y 3,6 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo en 100 ml de 1,4-dioxano 1,40 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida), 242 mg de (dibencilidenacetona)(cloroformo)dipaladio (0) y 368 mg de trifenilfosfina a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a 80°C durante 5 días. Se añadió a la mezcla de reacción ácido clorhídrico al 10%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 1,8 g de (4-cloro-3-fluorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo representado por la siguiente fórmula:

40



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,43-7,53 (2H, m), 7,31 (1H, dd), 5,02 (1H, s), 3,90 (3H, s), 3,17-3,58 (2H, m), 2,44-2,77 (2H, m).

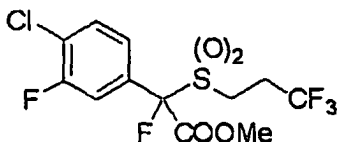
5

Ejemplo de producción de referencia 5

Se añadió a una suspensión de 0,11 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida) en 30 ml de tetrahidrofurano 1,0 g de (4-cloro-3-fluorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se añadieron 0,79 g de trifluorometanosulfonato de 1-fluoro-2,4,6-trimetilpiridinio. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 2 horas y se añadió ácido clorhídrico al 10%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sodico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,99 g de (4-cloro-3-fluorofenil)-fluoro-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo representado por la siguiente fórmula:

10

15

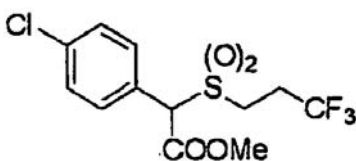


¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,2-7,66 (3H, m), 4,00 (3H, s), 3,28-3,38 (2H, m), 2,58-2,73 (2H, m).

Ejemplo de producción de referencia 6

Se añadió a una solución de 2,8 g de 4-yodoclorobenceno y 3,56 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo en 100 ml de 1,4-dioxano 1,4 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida), 242 mg de tris(dibencilidenacetona)(cloroformo) dipaladio (0) y 368 mg de trifenilfosfito a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a 80°C durante 48 horas. Se añadió a la mezcla de reacción ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sodico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 2,6 g de (4-clorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo representado por la siguiente fórmula:

25



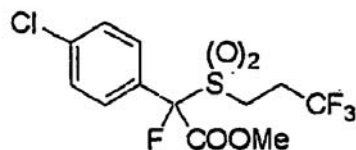
30

¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,53 (2H, d), 7,44 (2H, d), 5,05 (1H, s), 3,88 (3H, s), 3,15-3,55 (2H, m), 2,40-2,73 (2H, m).

Ejemplo de producción de referencia 7

Se añadió a una suspensión de 81 mg de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida) en 30 ml de tetrahidrofurano 0,7 g de (4-clorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se añadieron 0,59 g de trifluorometanosulfonato de 1-fluoro-2,4,6-trimetilpiridinio. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 2 horas y se añadió ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,67 g de (4-clorofenil)-fluoro-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo representado por la siguiente fórmula:

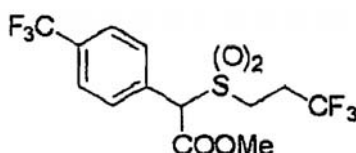
40



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,74 (2H, dd), 7,49 (2H, dd), 3,99 (3H, s), 3,24-3,38 (2H, m), 2,52 –2,72 (2H, m).

5 Ejemplo de producción de referencia 8

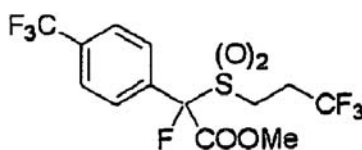
Se añadió a una solución de 5,0 g de 4-trifluorometiliodobenceno y 5,6 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo en 100 ml de 1,4-dioxano 2,21 g de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida), 579 g de tris(dibencilidenacetona)(cloroformo)dipaladio(0) y 381 mg de trifenilfosfina a temperatura ambiente y se agitó la mezcla a 80°C durante 20 horas. Se añadió a la mezcla de reacción ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 4,2 g de (4-fluorometilfenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo representado por la siguiente fórmula:



15 ¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,73 (4H, s), 5,11 (1H, s), 3,90 (3H, s), 3,15-3,58 (2H, m), 2,43-2,75 (2H, m).

Ejemplo de producción de referencia 9

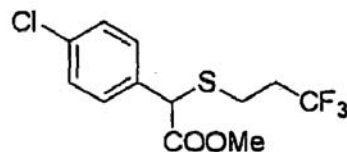
20 Se añadió a una suspensión de 106 mg de hidruro sódico (dispersión al 60% en parafina líquida) en 30 ml de tetrahidrofurano 1,0 g de (4-trifluorometilfenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)-acetato de metilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se añadieron 0,77 g de trifluorometanosulfonato de 1-fluoro-2,4,6-trimetilpiridinio. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 10 horas, y se añadió ácido clorhídrico al 10%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,92 g de fluoro-(4-trifluorometilfenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo representado por la fórmula:



30 ¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,96 (2H, d), 7,78 (2H, d), 4,00 (3H, s), 3,28-3,42 (2H, m), 2,56-2,80 (2H, m).

Ejemplo de producción de referencia 10

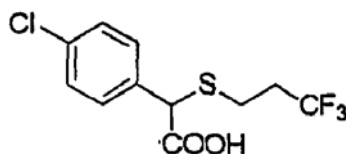
35 Se añadió a una solución de 1,78 g de S-(3,3,3-trifluoropropil)benzenotioato en 30 ml de tetrahidrofurano, gota a gota, 1,5 ml de metóxido sódico (solución en metanol al 28%) a temperatura ambiente y a continuación, se añadieron 2,0 g de bromo-(4-clorofenil)acetato de metilo a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 4 horas. Se añadió a la mezcla de reacción ácido clorhídrico al 10%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 2,2 g de (4-clorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonyl)acetato de metilo representado por la siguiente fórmula:



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,40 (2H, dd), 7,34 (2H, dd), 4,57 (1H, s), 3,76 (3H, s), 2,61-2,78 (2H, m), 2,25 – 2,42 (2H, m).

5 Ejemplo de producción de referencia 11

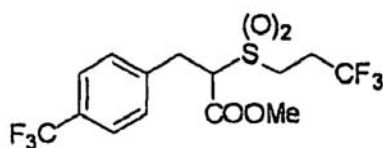
Se añadió a una solución de 1,88 g de (4-clorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo en 10 ml de metanol 5,0 ml de solución de hidróxido sódico al 10% a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 0,5 horas. Se añadió a la mezcla de reacción ácido clorhídrico al 12%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 1,70 g de ácido (4-clorofenil)-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acético representado por la siguiente fórmula.



15 ¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,41 – 7,35 (4H, m), 4,56 (1H, s), 2,80-2,67 (2H, m), 2,41-2,26 (2H, m).

Ejemplo de producción de referencia 12

20 Se añadió a una suspensión de 349 mg de hidruro sódico (dispersión al 55% en parafina líquida) en 6,0 ml de tetrahidrofurano gota a gota, una solución de 1,87 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfanil)acetato de metilo en 3,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 0,5 horas. Se añadió una solución de 1,91 g de bromuro de 4-trifluorometilbencilo en 6,0 ml de tetrahidrofurano. Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 4 horas, y se añadió ácido clorhídrico al 12%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 1,80 g de 3-(4-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo representado por la siguiente fórmula:

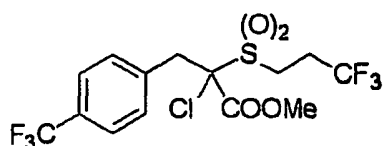


30 ¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,60 (2H, d), 7,34 (2H, d), 4,11 (1H, dd), 3,76 (3H, s), 3,57 – 3,33 (4H, m), 2,80-2,66 (2H, m).

35 Ejemplo de producción de referencia 13

Se añadió a una suspensión de 104 mg de hidruro sódico (dispersión al 55% en parafina líquida) en 3,0 ml de tetrahidrofurano una solución de 0,85 g de 3-(4-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo en 5,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 0,5 horas y se añadió una solución de 0,42 g de N-clorosuccinimida en 6,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 19 horas, y se añadió ácido clorhídrico al 10%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,33 g de 2-cloro-3-(4-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo representado por la siguiente fórmula:

45



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,60 (2H, d), 7,47 (2H, d), 4,05 (1H, d), 3,91 (3H, s), 3,81-3,72 (1H, m), 3,55 (1H, d), 3,54-3,50 (1H, m), 2,80-2,71 (2H, m).

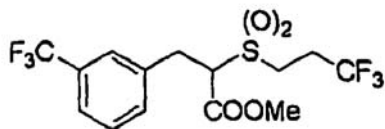
5

Ejemplo de producción de referencia 14

Se añadió a una suspensión de 0,16 g de hidruro sódico (dispersión al 55% en parafina líquida), en 6,0 ml de tetrahidrofurano, gota a gota, una solución de 0,95 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo en 3,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 0,5 horas. Se añadió una solución de 0,94 g de bromuro de 3-trifluorometilbencilo en 6,0 ml de tetrahidrofurano. Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 3 horas, y se añadió ácido clorhídrico al 12%, seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,38 g de 3-(3-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo representado por la fórmula:

10

15



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,57 -7,56 (1H, m), 7,50-7,41 (3H, m), 4,10 (1H, dd), 3,75 (3H, s), 3,54 (1H, dd), 3,52-3,45 (1H, m), 3,44 (1H, dd), 3,42-3,32 (1H, m), 2,79 -2,67 (2H, m).

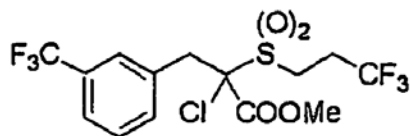
20

Ejemplo de producción de referencia 15

Se añadió a una suspensión de 47 mg de hidruro sódico (dispersión al 55% en parafina líquida) en 3,0 ml de tetrahidrofurano una solución de 0,38 g de 3-(3-(3-(trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo en 5,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas. Se añadió una solución de 0,14 g de N-clorosuccinimida en 6,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 2 horas, y se añadió ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,31 g de 2-cloro-3-(3-(3-(trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo representado por la siguiente fórmula:

25

30



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,58 -7,48 (4H, m), 4,05 (1H, d), 3,90 (3H, s), 3,79-3,76 (1H, m), 3,55 (1H, d), 3,54 -3,50 (1H, m), 2,82-2,69 (2H, m).

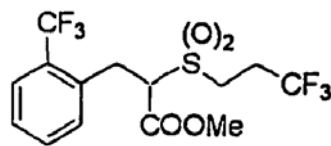
35

Ejemplo de producción de referencia 16

Se añadió a una suspensión de 349 mg de hidruro sódico (dispersión al 55% en parafina líquida) en 6,0 ml de tetrahidrofurano, gota a gota, una solución de 1,87 g de (3,3,3-trifluoropropilsulfonil)acetato de metilo en 3,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente, y se agitó la mezcla a la misma temperatura durante 0,5 horas. Se añadió una solución de 1,99 g de bromuro de 2-trifluorometilbencilo en 6,0 ml de tetrahidrofurano. Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 4 horas, y se añadió ácido clorhídrico al 12% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 1,79 g de 3-(2-trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo representado por la siguiente fórmula:

40

45



¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,70 (1H, d), 7,51 (1H, t), 7,42 (1H, t), 7,37 (1H, d), 4,16 (1H, dd), 3,76 (3H, s), 3,73 (1H, dd), 3,55-3,32 (3H, m), 2,75 –2,69 (2H, m).

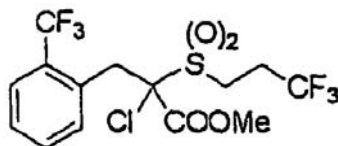
5

Ejemplo de producción de referencia 17

Se añadió a una suspensión de 206 mg de hidruro sódico (dispersión al 55% en parafina líquida) en 3,0 ml de tetrahidrofurano una solución de 1,21 g de 3-(2-(2-(trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo en 5,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente y se agitó la mezcla a temperatura ambiente durante 0,5 horas. Se añadió una solución de 0,82 g de N-clorosuccinimida en 6,0 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente. Se agitó la mezcla de reacción a la misma temperatura durante 7 horas y se añadió a continuación ácido clorhídrico al 10% seguido de extracción con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato sódico anhidro y se concentró a presión reducida. Se sometió el residuo a cromatografía de columna sobre gel de sílice para obtener 0,72 g de 2-cloro-3-(2-(trifluorometilfenil)-2-(3,3,3-trifluoropropilsulfonil)propanoato de metilo representado por la siguiente fórmula:

10

15



20

¹H-RMN (CDCl₃, TMS): δ (ppm): 7,73 –7,71 (1H, m), 7,53-7,51 (1H, m), 7,45-7,38 (2H, m), 4,26 (1H, d), 3,91 (3H, s), 3,88 (1H, d), 3,82-3,78 (1H, m), 3,59-3,55 (1H, m), 2,84-2,71 (2H, m).

25

A continuación, se muestra un ejemplos de formulación. El término "parte(s)" se refiere a parte(s) en peso. Los compuestos de la presente invención están representados por los números de compuesto tal como se han descrito.

Ejemplo de formulación 1

30

Se disuelven nueva partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) en una mezcla de 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecibencenosulfonato cálcico y se mezcla por agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 2

35

Se disuelven cinco partes del compuesto (1) de la present invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] que se indica a continuación en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecibencenosulfonato cálcico y se mezclan por agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

40

Grupo [A]:

Fosfida de aluminio, butatiofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos (CYAP), diazinon, DCIP (éter diclorodiisopropílico), diclofention (ECP), diclorvos (DDVP), dimetoato, dimetivinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, fention (MPP), fenitrotion (MEP), fostiazato, formotion, hidrogen fosfida, isofenfos, isoxation, malation, mesulfenfos, metidation (DMTP), monocrotofos, naled (BRP), oxideprofos (ESP), paration, fosalona, fosmet (PMP), pirimifos-metilo, piridafention, quinalfos, fentoato (PAP), profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salition, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometon, triclorfon (DEP), vamidotion, forato, cadusafos; alanycarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMP, carbaril, carbofuran, carbosulfan, cioetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb (MIPC), metolcarb, metomilo, metiocarb,

50

NAC, oxamil, pirimicarb, propoxur (PHC), XMC, tiodicarb, xililcarb, aldicarb; acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, empentrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigmacipermetrina, silafluofen, teflutrina, tralometrina, transflutrina, tetrametrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, furametrina, tau-fluvalinato, 2,2-dimetil-3-(1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metil)bencilo, 2,2-dimetil-3-(2-metil-1-

55

propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, 2,2-dimetil-3-(2-ciano-1-propenil)ciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo; 2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo;

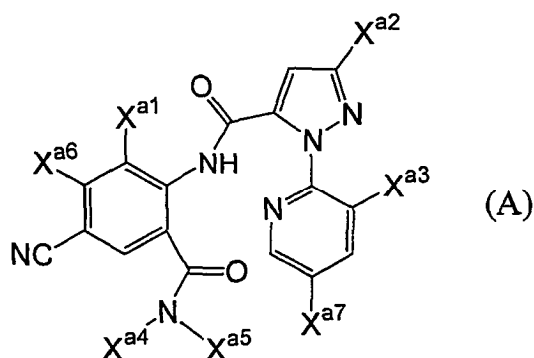
cartap, bensultap, tiociclam, monosultap; bisultap;

5 imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, clorfluazuron, bistrifluron, diafenituron, difluobenzuron, fluazuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron, triazuron, acetoprol, fipronil, vaniliprol, piriprol, pirafluprol;

cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida;

10 aldrina, dieldrina, dienoclor, endosulfan, metoxiclor, sulfato de nicotina, avermectina-B, bromopropilato, buprofezina, clorfenapir, ciromazina, D-D(1,3-dicloropreno), benzoato-emamectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, metopreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbenmicin-A, pimetrozina, piridalilo, espinosad, sulfuramid, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, lepimectina, ácido arsénico, benclotiaz, cianamida cálcica, polisulfuro cálcico, clordano, DDT, DSP, flufenimer, flonicamid, flurimfen, formetanato, metam-amonio,

15 metam-sodio, bromuro de metilo, oleato potásico, protrifenbute, espiromesifen, azufre, metaflumizon, espirotetramat, pirifluquinazona, clorantraniliprol, tralopirilo, un compuesto representado por la siguiente fórmula (A):

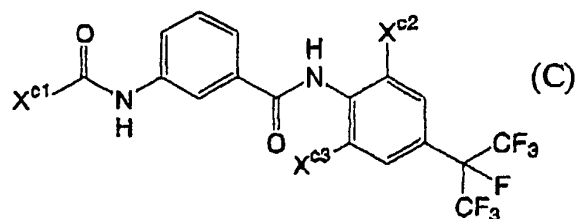


en la que X^{a1} representa un grupo metilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de flúor, X^{a2} representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo haloalquilo de C1-C4 o un grupo haloalcoxi de C1-C4, X^{a3} representa un átomo de flúor, un átomo de cloro o un átomo de bromo, X^{a4} representa un grupo alquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente, un grupo alqueno de C3-C4 sustituido opcionalmente, un grupo alquino de C3-C4 sustituido opcionalmente, un grupo cicloalquilo de C3-C5 sustituido opcionalmente o un átomo de hidrógeno, X^{a5} representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, X^{a6} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro, y X^{a7} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o un átomo de cloro;

un compuesto representado por la siguiente fórmula (B):



en la que X^{b1} representa un grupo X^{b2} -NH-C(=O), un grupo X^{b2} -C(=O)-NH, un grupo X^{b3} -S(O), un grupo pirrol-1-ilo sustituido opcionalmente, un grupo imidazol-1-ilo sustituido opcionalmente, un grupo pirazol-1-ilo sustituido opcionalmente, un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo sustituido opcionalmente, X^{b2} representa un grupo haloalquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente como por ejemplo un grupo 2,2,2-trifluoroetil o un grupo cicloalquilo de C3-C6 sustituido opcionalmente y X^{b3} representa un grupo alquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo metilo; y X^{b4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo ciano o un grupo metilo; un compuesto representado por la siguiente fórmula (C):



en la que X^{c1} representa un grupo alquilo de C1-C4 sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo alcoxi de C1-C4 sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo 2,2,2-tricloroetoxi o

un grupo fenilo sustituido opcionalmente, como por ejemplo 4-cianofenilo o un grupo piridilo sustituido opcionalmente, como por ejemplo un grupo 2-cloro-3-piridilo; X^{c2} representa un grupo metilo o un grupo trifluorometilitio, y X^{c3} representa un grupo metilo o un átomo de halógeno; un acequinocilo, amitraz, benzoximato, bifenzato, bromopropilato, quinometionat, clorobenzilato, CPCBS (clorfenson), clofenfexina, ciflumetofeno, keltano (dicofol), óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluacripirim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita (BPPS), piridabeno, pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifon, espiroclorfen, espiromesifen, espirotetramat, amidoflumet y cienopirafeno.

Ejemplo de formulación 3

Se disuelven cinco partes del compuesto (2) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 4

Se disuelven cinco partes del compuesto (3) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 5

Se disuelven cinco partes del compuesto (4) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 6

Se disuelven cinco partes del compuesto (5) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 7

Se disuelven cinco partes del compuesto (6) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 8

Se disuelven cinco partes del compuesto (7) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 9

Se disuelven cinco partes del compuesto (8) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 10

Se disuelven cinco partes del compuesto (9) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietilen estiril fenílico y 6 partes de dodecilbencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 11

5 Se disuelven cinco partes del compuesto (10) de la presente invención y 4 partes de un compuesto seleccionado del grupo [A] en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. Se añaden 10 partes de éter polioxietileno estiril fenílico y 6 partes de dodecibencenosulfonato cálcico y se mezcla con agitación a fondo para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 12

10 Se añaden cinco partes de SORPOL 5060 (nombre de marca registrada de TOHO Chemical Industry Co. LTD.) a 40 partes de cada uno de los compuestos (1) a (10) de la presente invención y se mezclan a fondo. A continuación, se añaden 32 partes de CARPLEX #80 (nombre de marca registrada de Shionogi & Co., Ltd. polvo fino de óxido de silicio anhidro sintético) y 23 partes de tierra de diatomeas de 300 mallas y se mezcla con una mezcladora de zumos para obtener un polvo humectable.

15

Ejemplo de formulación 13

20 Se añaden tres partes de cada uno de los compuestos (1) a (10) de la presente invención, 5 partes de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 5 partes de dodecibencenosulfonato sódico, 30 partes de bentonita y 57 partes de arcilla con agitación a fondo. Se añade a esta mezcla una cantidad apropiada de agua. Se continúa agitando la mezcla, se granula con una granuladora y después se seca al aire para obtener un granulado.

Ejemplo de formulación 14

25 Se añaden 4,5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención, 1 parte de polvo fino de óxido de silicio hidratado sintético, 1 parte de Doires B (fabricado por Sankyo) como floculante y 7 partes de arcilla, se agitan a fondo con un mortero y a continuación con agitación con una mezcladora de zumos. Se añade a la mezcla resultante 86,5 partes de arcilla cortada y se mezcla con agitación a fondo para obtener un polvo.

30

Ejemplo de formulación 15

35 Se mezclan 10 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención, 35 partes de carbono blanco con un contenido de 50 partes de sal de sulfato amonio de alquil éter de polioxietileno (relación en peso 50/50), 55 partes de agua y a continuación, se dividen finamente a través de un método de triturado en húmedo para obtener una formulación.

Ejemplo de formulación 16

40 Se disuelven 0,5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención en 10 partes de diclorometano. Se mezcla esta solución con 89,5 partes de Isopar M (nombre de marca registrada isoparafina de Exxon Chemical) para obtener una solución oleosa.

Ejemplo de formulación 17

45 Se colocan 0,1 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención y 49,9 partes de NEO-THIOZOL (Chuo Kasei Co., Ltd.) en un bote de aerosol. Se ajusta una válvula para aerosol al bote y después se carga el bote con 25 partes de éter dimetilico y 25 partes de LPG. Se ajusta un actuador al bote para obtener un aerosol oleoso.

50

Ejemplo de formulación 18

55 Se carga un contenedor de aerosol con 0,6 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención, 0,01 partes de BHT, 5 partes de xileno, una mezcla de 3,39 partes de querosina desodorizada y 1 parte de un agente emulsionante [Atmos 300 (nombre de marca registrada de Atmos Chemical Ltd.)] y 50 partes de agua destilada. Se ajusta una pieza de válvula en el contenedor y después se carga el contenedor con 40 partes de un propelente (LPG) a través de la válvula a presión incrementada para obtener un aerosol acuoso.

Ejemplo de formulación 19

60 Se disuelven 5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención en 80 partes de éter monoetilico de dietileno glicol. Se mezcla con ello 15 partes de carbonato de propileno para obtener una formulación líquida de aplicación puntual.

65

Ejemplo de formulación 20

5 Se disuelven 10 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención en 70 partes de éter monoetílico de dietilen glicol. Se añaden 20 partes de 2-octildodecanol para obtener una formulación líquida de aplicación por vertido.

Ejemplo de formulación 21

10 Se añaden a 0,5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención 60 partes de NIKKOL TEALS 42 (una solución acuosa al 42% de lauril sulfato de trietanolamina, Nikko Chemicals) y 20 partes de propilen glicol. Se agita a fondo la mezcla para obtener una solución homogénea. Se añaden 19,5 partes de agua y se mezcla por agitación a fondo para obtener una formulación de champú homogénea.

Ejemplo de formulación 22

15 Se impregna una placa cerámica porosa de 4,0 cm, un ancho de 0,4 cm y un grosor de 1,2 cm con una solución de 0,1 g de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención en 2 ml de propilen glicol para obtener un plaguicida ahumante de tipo calentamiento.

Ejemplo de formulación 23

20 Se funden 5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención y 95 partes de copolímero de etileno-metacrilato de metilo (la proporción de metacrilato de metilo en el copolímero: 10% en peso, ACRYFT WD301, Sumitomo Chemical) y se amasa en una amasadora a presión sellada (Moriyama Manufacturing Co., Ltd.).
25 Se extruye el producto amasado obtenido a través de una boquilla de moldeo utilizando una extrusora para obtener una barra moldeada con una longitud de 15 cm y un diámetro de 3mm.

Ejemplo de formulación 24

30 Se mezclan 5 partes de cualquiera de los compuestos (1) a (39) de la presente invención y 95 partes de una resina de policloruro de vinilo flexible y se amasa en una amasadora a presión sellada (Moriyama Manufacturing Co., Ltd.)
Se extruye el producto amasado obtenido a través de una boquilla de moldeo utilizando una extrusora para obtener una barra moldeada con una longitud de 15 cm y un diámetro de 3 mm.

35 A continuación, se demuestra a través de ejemplos de ensayo la efectividad del compuesto de la presente invención como ingrediente activo de una composición plaguicida.

Ejemplo de ensayo 1

40 Se diluyó una formulación de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención obtenidos con arreglo al ejemplo de formulación 15 de manera que la concentración del ingrediente activo fuera 500 ppm para obtener una solución de ensayo.

45 Al mismo tiempo, se colocaron 50 g de suelo de cultivo , Bonsol N°2 (fabricado por Sumitomo Chemical Co., Ltd.) en un vaso de polietileno, y se plantaron de 10 a 15 semillas de arroz. Se dejaron crecer las plantas de arroz hasta que se desarrolló la hoja de segundo follaje y después se cortó para que tuviera la misma altura de 5 cm. Se aplicó por aspersión la solución de ensayo sobre las plantas de arroz en una cantidad de 20 ml/vaso. Una vez que se secó la solución aplicada por aspersión la solución de ensayo sobre las plantasde arroz se colocaron las plantas de arroz
50 en un vaso de plástico con el fin de prevenir que se escaparan los gusanos de ensayo. Se soltaron larvas en el primer instar de langosta parda del arroz en el vaso y se selló el vaso con una tapa. A continuación, se colocó el vaso en un invernadero a 25°C durante 6 días. A continuación, se examinó el número de langostas pardas del arroz parásitas sobre las plantas de arroz.

55 Como resultado, en las plantas tratadas con alguno de los compuestos (1), (2), (3), (4), (5) y (6) de la presente invención, el número de plagas parásitas fue 3 o menos.

Ejemplo de ensayo 2

60 Se diluyó una formulación de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención obtenidos con arreglo al ejemplo de formulación 15 de manera que la concentración del ingrediente activo fuera 55.6 ppm, para obtener una solución de ensayo.

65 Al mismo tiempo, se colocaron 50 g de suelo de cultivo , Bonsol N°2 (fabricado por Sumitomo Chemical Co., Ltd.) en un vaso de polietileno, con cinco agujeros de 5 mm de diámetro en el fondo, y y se plantaron de 10 a 15 semillas de

arroz. Se dejaron crecer las plantas de arroz hasta que se desarrolló la hoja de segundo follaje y después se trató con 45 ml de la solución de ensayo dejando que las plantas absorbieran la solución de ensayo desde el fondo del vaso. Se colocaron las plantas de arroz en un invernadero a 25°C durante 6 días y después se cortaron a la misma altura de 5 cm. Se soltaron 30 larvas en el primer instar de langosta parda del arroz en el invernadero a 25°C y se dejaron 6 días. A continuación, se examinó el número de langostas pardas del arroz sobre las plantas de arroz.

Como resultado, en las plantas tratadas con alguno de los compuestos (1), (2), (3), (4), (5), (6) y (7) de la presente invención, el número de plagas parásitas fue 3 o menos.

10 Ejemplo de ensayo 3

Se diluyó una formulación de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención obtenidos con arreglo al ejemplo de formulación 15 de manera que la concentración del ingrediente activo fuera 500 ppm para obtener una solución de ensayo.

Se extendió un papel de filtro que tenía un diámetro de 5,5 cm sobre el fondo de un vaso de polietileno que tenía un diámetro de 5,5 cm y se añadieron 0,7 ml de solución de ensayo gota a gota sobre el papel de filtro. Como cebo, se colocaron de manera uniforme 30 mg de sacarosa sobre el papel de filtro. Se soltaron en el vaso de polietileno 10 imagos hembra de *Musca domestica* y se selló el vaso con una tapa. Al cabo de 24 horas, se examinó el número de *Musca domestica* superviviente y se calculó el índice de mortalidad de la plaga.

Como resultado, en las plantas tratadas con alguno de los compuestos (1), (3), (4) y (5) presentaron un índice de mortalidad de la plaga de 90% o más. Los tratamientos con cualquiera de los compuestos (2) y (10) presentaron un índice de mortalidad de la plaga de 40% o más.

25 Ejemplo de ensayo 4

Se diluyó una formulación de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención obtenidos con arreglo al ejemplo de formulación 15 con agua de manera que la concentración del ingrediente activo fuera 500 ppm para obtener una solución de ensayo.

Se extendió un papel de filtro que tenía un diámetro de 5,5 cm sobre el fondo de un vaso de polietileno que tenía un diámetro de 5,5 cm y se añadieron 0,7 ml de la solución de ensayo sobre el papel de filtro. Como cebo, se colocaron 30 mg de sacarosa uniformemente sobre el papel de filtro. Se soltaron en el vaso de polietileno 2 imagos macho de *Blattella germanica* y se selló el vaso con una tapa. Al cabo de 6 días, se examinó el número de *Blattella germanica* supervivientes y se calculó el índice de mortalidad de la plaga.

Como resultado, los tratamientos con cualquiera de los compuestos (1), (2), (3), (4) y (5) de la presente invención presentaron un índice de mortalidad de la plaga de 100%. El tratamiento con el compuesto (9) de la presente invención presentó un índice de mortalidad de la plaga de 50% o más.

40 Ejemplo de ensayo 5

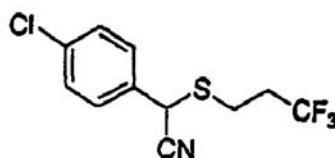
Se diluyó una formulación de cualquiera de los compuestos (1) a (10) de la presente invención obtenida con arreglo al ejemplo de formulación 15 con agua de manera que la concentración del ingrediente activo fuera 500 ppm para obtener una solución de ensayo.

Se añadieron a 100 ml de agua de intercambio iónico 0,7 ml de la solución de ensayo (concentración del ingrediente activo 3,5 ppm). Se soltaron en la solución 20 larvas en el último instar de *Culex pipiens*. Un día después, se examinó el número de *Culex pipiens* supervivientes y se calculó el índice de mortalidad de la plaga.

Como resultado, los tratamientos con cualquiera de los compuestos (1), (3), (4), (5), (6) y (10) de la presente invención presentaron un índice de mortalidad de la plaga de 95% o más. Los tratamientos con cualquiera de los compuestos (6), (7) y (9) de la presente invención presentaron un índice de mortalidad de la plaga de 10% o más.

55 Ejemplo de ensayo 6

En este ejemplo de ensayo, como compuesto comparativo, se utilizó un compuesto descrito en JP-A-2005-179321 (compuesto N° 37 en la tabla 2) representado por la siguiente fórmula:



60

(en adelante denominado compuesto comparativo (1)).

5 Se obtuvo cada una de las formulaciones del compuesto (6) de la presente invención y el compuesto comparativo (1) con arreglo al ejemplo de formulación 15. Se diluyó la formulación de manera que la concentración del ingrediente activo fuera 175 ppm para obtener una solución de ensayo.

10 Al mismo tiempo, se colocaron 50 g de suelo de cultivo, Bonsol N° 2 (fabricado por Sumitomo Chemical Co., Ltd) en un vaso de polietileno y se plantaron en él de 10 a 15 semillas. Se dejaron crecer plantas de arroz hasta que se desarrolló la hoja de segunda follaje y después se cortaron para que tuvieran la misma altura de 5 cm. Se pulverizó la solución de ensayo sobre las plantas de arroz en una cantidad de 20 ml /vaso. Una vez que se secó la solución de ensayo aplicada por aspersión sobre las plantas de arroz, se colocaron las plantas de arroz en un vaso de plástico con el fin de prevenir que se escaparan los gusanos de ensayo. Se soltaron 20 larvas en el primer instar de langostas pardas del arroz en el vaso y se selló el vaso con una tapa. A continuación, se colocó el vaso en un invernadero a 25°C durante 6 días. A continuación, se examinó el número de langostas paradas del arroz parásitas sobre las plantas de arroz.

15 Como resultado, sobre las plantas tratadas con el compuesto (6) de la presente invención, el número de plagas parásitas fue 3 ó menos. Sobre las plantas tratadas con el compuesto comparativo (1), el número de plagas parásitas fue 21 o más.

20 **Aplicación industrial**

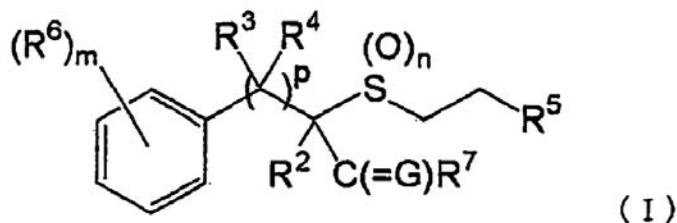
25 El compuesto de la presente invención tiene un efecto de control excelente sobre plagas de artrópodos, y por lo tanto es útil como ingrediente activo para una composición plaguicida.

30

35

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor representado por la fórmula (I):



- 5 en la que G representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
 R² representa un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, o un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno;
 R³ y R⁴ representan cada uno de ellos independientemente un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 o un átomo de hidrógeno;
- 10 R⁵ representa un átomo de flúor; o un grupo haloalquilo de C1-C5 que contiene al menos un átomo de flúor;
 R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro o un grupo $-(G^1)_q-R^8$;
 R⁷ representa un grupo amino, un grupo alquilamino de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno, un grupo di(alquilo de C1-C4)amino que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno o un grupo amino cíclico de C2-C5;
- 15 R⁸ representa un grupo hidrocarburo de cadena de C1-C4 que está sustituido opcionalmente con un átomo de halógeno;
 m representa un entero de 0 a 5; siempre y cuando los R⁶ sean opcionalmente iguales o diferentes entre sí cuando m sea de 2 a 5;
 n representa un entero de 0 a 2;
- 20 p representa 0 ó 1;
 q representa 0 ó 1; y
 G¹ representa un átomo de oxígeno un átomo de azufre, un grupo $-SO-$ o un grupo $-SO_2$.
- 25 2. El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según la reivindicación 1, en el que p es 0.
- 30 3. El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según las reivindicaciones 1 o 2, en el que G es un átomo de oxígeno.
4. El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según las reivindicaciones 1 ó 2 en el que G es un átomo de oxígeno y R⁷ es un grupo amino.
- 35 5. El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en el que R² es un átomo de halógeno.
- 40 6. El compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en el que n es 2.
7. Una composición plaguicida que comprende un compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 como ingrediente activo.
8. Un método para el control de una plaga de artrópodos que comprende la aplicación de una cantidad efectiva del compuesto de azufre orgánico con contenido en flúor según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 sobre una plaga de artrópodos o el lugar en el que habita la plaga de artrópodos.