

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 409 832**

51 Int. Cl.:

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

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **11.08.2006 E 06796509 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **10.04.2013 EP 1925613**

54 Título: **Derivado de anilida de ácido pirazolcarboxílico sustituido o una sal del mismo, intermedio de síntesis, agente para uso agrícola y hortícola, y uso del mismo.**

30 Prioridad:

12.08.2005 JP 2005234405
07.11.2005 JP 2005322531
18.04.2006 JP 2006114937

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
28.06.2013

73 Titular/es:

NIHON NOHYAKU CO., LTD. (100.0%)
2-5, NIHONBASHI 1-CHOME, CHUO-KU
TOKYO 103-8236, JP

72 Inventor/es:

FURUYA, TAKASHI;
KANNO, HIDEO;
MACHIYA, KOZO;
SUWA, AKIYUKI;
YASOKAWA, NORIAKI y
FUJIOKA, SHINSUKE

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 409 832 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

Derivado de anilida de ácido pirazolcarboxílico sustituido o una sal del mismo, intermedio de síntesis, agente para uso agrícola y hortícola, y uso del mismo.

Campo técnico

- 5 La presente invención se refiere a derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida o sus sales, a sus intermediarios y a agentes agrohortícolas, particularmente insecticidas o acaricidas, que contienen dichos compuestos como un ingrediente activo, y a un método para el uso de estos.

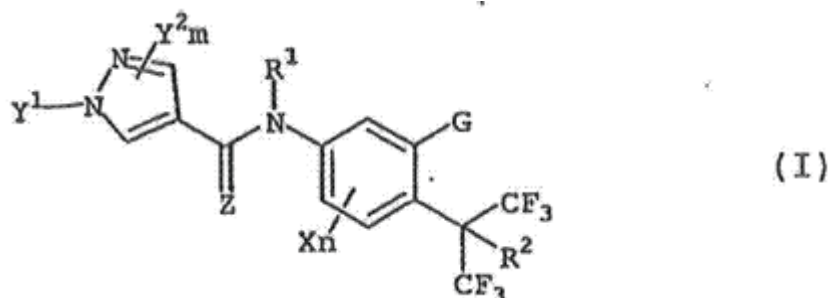
Arte previo

- 10 Convencionalmente, se conoce que los derivados de pirazolcarboxamida sustituidos similares a la presente invención son útiles como insecticidas agrohortícolas, fungicidas o acaricidas (por ejemplo, JP-A-2003-48878, JP-A-2004-18973E y JP-A2004-269515). En la JP-A2003-48878 se divulgan los derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida. Sin embargo, los sustituyentes en el resto anilina se limitan en su mayoría a los sustituyentes en posición 2, el sustituyente en posición 3 es el grupo metilo solamente y el compuesto descrito en la presente invención, en el cual el grupo alquilo que tiene 2 o más átomos de carbono es introducido en la posición 3, no está incluido aun en su lista de compuestos. Además, la forma metilo en la posición 3 divulgada concretamente allí no muestra una actividad acaricida. En el documento JP 25 A-2004-189738, se divulgan derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida. Sin embargo, los sustituyentes en el resto anilina están limitados al grupo alcoxi, al grupo alquiltio y al grupo alquilamino y el compuesto descrito en la presente invención, en el cual el grupo alquilo que tiene 2 o más átomos de carbono es introducido directamente en la posición 3, no está incluido aún en su lista de compuestos. En el documento JP-A-2004-269515, se divulgan derivados de pirazolcarboxamida sustituidos. Sin embargo, sólo se divulga un compuesto amida con heterocicilamina y los derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida de la presente invención no se divulgan.

Descripción de la invención

- 25 En las plantaciones de cultivos en los campos agrícolas y hortícolas, los daños causados por las plagas de insectos aún son serios y el desarrollo de nuevos agentes agrohortícolas, particularmente el desarrollo de insecticidas y acaricidas, se desea debido a la generación de plagas de insectos resistentes a los agentes conocidos, y similares. Como se requieren varios trabajos agrícolas que ahorren labores debido al número creciente de la población mayor que trabaja las granjas, también se requiere la creación de agentes agrohortícolas con propiedades adecuadas para tales trabajos de granja que ahorran labores, particularmente insecticidas y acaricidas. Los presentes inventores han realizado amplios estudios continuados sobre el desarrollo de nuevos agentes agrohortícolas, en particular insecticidas y acaricidas y han hallado, como resultado, que entre el amplio intervalo de compuestos descrito en el documento previo arriba mencionado, un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I), en la cual un anillo pirazol es seleccionado como el resto de ácido carboxílico heterocíclico y un sustituyente específico es introducido en el resto de anilina en posición 3, mostró un excelente efecto de control como acaricida, no predicho del contenido descrito en las referencias del arte previo arriba mencionadas. Los derivados sustituidos de anilina representados por la fórmula (II) y el ácido 5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico sustituido o una sal de éste son útiles como intermediarios para la elaboración de los compuestos de la invención.

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



- 40 en donde
- 45 R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo C_1-C_8 , 3a) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , 4a) un grupo alquil C_1-C_6 -carbonilo, 5a) un grupo haloalquil C_1-C_6 -carbonilo, 6a) un grupo alquenil C_2-C_6 -carbonilo, 7a) un grupo haloalquenil C_2-C_6 -carbonilo, 8a) un grupo alquil C_1-C_6 -carbonil-alquilo C_1-C_6 , 9a) un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , 10a) un grupo halocicloalquilo C_3-C_6 , 11a) un grupo cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 12a) un grupo halocicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 13a) un grupo alquenilo C_2-C_6 , 14a) un grupo haloalquenilo C_2-C_6 , 15a) un grupo alquinilo C_2-C_6 , 16a) un grupo haloalquinilo C_2-C_6 , 17a) un grupo alcoxi C_1-C_{10} -alquilo C_1-C_6 , 18a) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 19a) un

5 grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 67a) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquil C₁-C₆-carbonilo, 68a) un grupo alcoxi C₁-C₆-alquil C₁-C₆-carbonilo, 69a) un grupo halocicloalquil C₃-C₆-alquil C₁-C₆-carbonilo, 70a) un grupo fenoxialcoxi C₁-C₆-carbonilo, 71a) un grupo fenoxialcoxi C₁-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 72a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, 73a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilalquil C₁-C₆-carbonilo o 74a) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilalquil C₁-C₆-carbonilo;

15 R² es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo de halógeno, 3b) un grupo alquilo C₁-C₆, 4b) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 5b) un grupo ciano, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxi C₁-C₆, 8b) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, 9b) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₃, 10b) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₃, 11b) un grupo alquil C₁-C₆-tioalcoxi C₁-C₃, 12b) un grupo haloalquil C₁-C₆-tioalcoxi C₁-C₃, 13b) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinalcoxi C₁-C₃, 14b) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinalcoxi C₁-C₃, 15b) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilalcoxi C₁-C₃, 16b) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilalcoxi C₁-C₃, 17b) un grupo monoalquil C₁-C₆-aminoalcoxi C₁-C₃, 18b) un grupo dialquil C₁-C₆-aminoalcoxi C₁-C₃, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 19b) un grupo alquil C₁-C₆-tio, 20b) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, 21b) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, 22b) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, 23b) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, 24b) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, 25b) un grupo amino, 26b) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, 27b) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 28b) un grupo fenoxi, 29b) un grupo fenoxi sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo alquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 30b) un grupo feniltio, 31b) un grupo feniltio sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, a) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 32b) un grupo fenilsulfinito, 33b) un grupo fenilsulfinito sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 34b) un grupo fenilsulfonilo, 35b) un grupo fenilsulfonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 36b) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ o 37b) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo;

55 G es 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo C₂-C₁₀, 3c) un grupo alqueno C₃-C₁₀, 4c) un grupo haloalqueno C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquino C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquino C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀, 8c) un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo alquilo C₁-C₆ y c) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 9c) un grupo cicloalqueno C₃-C₁₀, 10c) un grupo cicloalqueno C₃-C₁₀ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo alquilo C₁-C₄ y c) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ o 12c) un grupo halocicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆;

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

X puede ser igual o diferente y es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo de halógeno, 3d) un grupo ciano, 4d) un

grupo nitro, 5d) un grupo alquilo C₁-C₆ o 6d) un grupo haloalquilo C₁-C₆:

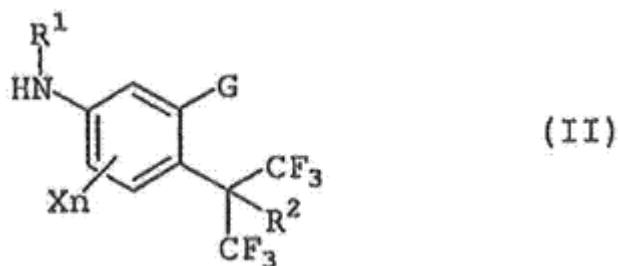
Y¹ es 1e) un átomo de hidrógeno, 2e) un grupo alquilo C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 4e) un grupo alquenilo C₂-C₆, 5e) un grupo haloalquenilo C₂-C₆, 6e) un grupo alquinilo C₂-C₆, 7e) un grupo haloalquinilo C₂-C₆, 8e) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 9e) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, 10e) un grupo alquil C₁-C₆-carboniloxialquilo C₁-C₆, 11e) un grupo cicloalquilo C₃-C₆, 12e) un grupo halocicloalquilo C₃-C₆, 13e) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 14e) un grupo halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 15e) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, 16e) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, 17e) un grupo alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 18e) un grupo haloalquil C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆, 19e) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinalquilo C₁-C₆, 20e) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinalquilo C₁-C₆, 21e) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonalquilo C₁-C₆, 22e) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonalquilo C₁-C₆, 23e) un grupo monoalquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, 24e) un grupo dialquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 25e) un grupo fenilo, 26e) un grupo fenilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo;

Y² puede ser igual o diferente y es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo de halógeno, 3f) un grupo ciano, 4f) un grupo nitro, 5f) un grupo hidroxilo, 6f) un grupo mercapto, 7f) un grupo amino, 8f) un grupo carboxilo, 9f) un grupo alquilo C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 11f) un grupo alquenilo C₂-C₆, 12f) un grupo haloalquenilo C₂-C₆, 13f) un grupo alquinilo C₂-C₆, 14f) un grupo haloalquinilo C₂-C₆, 15f) un grupo trialquil C₁-C₆-sililalquinilo C₂-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 16f) un grupo fenilalquinilo C₂-C₆, 17f) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 18f) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, 19f) un grupo alquil C₁-C₆-carboniloxialquilo C₁-C₆, 20f) un grupo cicloalquilo C₃-C₆, 21f) un grupo halocicloalquilo C₃-C₆, 22f) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 23f) un grupo halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 24f) un grupo alcoxi C₁-C₆, 25f) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, 26f) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, 27f) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, 28f) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆, 29f) un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 30f) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 31f) un grupo alquil C₁-C₆-tio, 32f) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, 33f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, 34f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, 35f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, 36f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, 37f) un grupo alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 38f) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 39f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinalquilo C₁-C₆, 40f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinalquilo C₁-C₆, 41f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonalquilo C₁-C₆, 42f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonalquilo C₁-C₆, 43f) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, 44f) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 45f) un grupo fenilamino, 46f) un grupo monoalquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, 47f) un grupo dialquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 48f) un grupo fenilo, 49f) un grupo fenilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 50f) un grupo fenoxi sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 52f) un grupo heterocíclico o 53f) un grupo heterocíclico sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinito, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinito, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo;

m es 1 ó 2; y

n es un número entero de 1-3, sus sales y agentes agrohortícolas con el compuesto como un ingrediente activo y sus métodos de uso.

55 Los derivados sustituidos de anilina representados por la fórmula (II) son intermediarios para la preparación de los compuestos de la fórmula (I):



en donde

R^1 es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo C_1-C_6 , 3a) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , 4a) un grupo alquil C_1-C_6 -carbonilo, 5a) un grupo haloalquil C_1-C_6 -carbonilo, 6a) un grupo alqueniil C_2-C_6 -carbonilo, 7a) un grupo haloalqueniil C_2-C_6 -carbonilo, 8a) un grupo alquil C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 , 9a) un grupo cicloalquilo C_3-C_6 , 10a) un grupo halocicloalquilo C_3-C_6 , 11a) un grupo cicloalquil C_3-C_6 -alquil C_1-C_6 , 12a) un grupo halocicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 13a) un grupo alqueniilo C_2-C_6 , 14a) un grupo haloalqueniilo C_2-C_6 , 15a) un grupo alquiniilo C_2-C_6 , 16a) un grupo haloalquiniilo C_2-C_6 , 17a) un grupo alcoxi C_1-C_{10} -alquilo C_1-C_6 , 18a) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 19a) un grupo alqueniil C_2-C_6 -oxialquilo C_3-C_6 , 20a) un grupo alcoxi C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 21a) un grupo alquil C_1-C_6 -tioalquilo C_1-C_6 , 22a) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tioalquilo C_1-C_6 , 23a) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilalquilo C_1-C_6 , 24a) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilalquilo C_1-C_6 , 25a) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilalquilo C_1-C_6 , 26a) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilalquilo C_1-C_6 , 27a) un grupo monoalquil C_1-C_6 -aminoalquilo C_1-C_6 , 28a) un grupo dialquil C_1-C_6 -aminoalquilo C_1-C_6 , en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 29a) un grupo fenilalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , 30a) un grupo fenilalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxi C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , h) un grupo alquil C_1-C_6 -tio, i) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tio, j) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilo, k) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, l) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, m) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, n) un grupo monoalquil C_1-C_6 -amino, o) un grupo dialquil C_1-C_6 -amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 31a) un grupo alcoxi C_1-C_{16} -carbonilo, 32a) un grupo alcoxi C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 33a) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 34a) un grupo alqueniil C_2-C_6 -oxicarbonilo, 35a) un grupo alquil C_1-C_6 -tiocarbonilo, 36a) un grupo monoalquilamino C_1-C_6 -carbonilo, 37a) un grupo dialquilamino C_1-C_6 -carbonilo, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 38a) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonil-alquilo C_1-C_6 , 39a) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, 40a) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, 41a) un grupo cianoalquilo C_1-C_6 , 42a) un grupo fenilalquilo C_1-C_6 , 43a) un grupo fenilalquilo C_1-C_6 sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxi C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , h) un grupo alquil C_1-C_6 -tio, i) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tio, j) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilo, k) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, l) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, m) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, n) un grupo monoalquil C_1-C_6 -amino, o) un grupo dialquil C_1-C_6 -amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxi C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , h) un grupo alquil C_1-C_6 -tio, i) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tio, j) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilo, k) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, l) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, m) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, n) un grupo monoalquil C_1-C_6 -amino, o) un grupo dialquil C_1-C_6 -amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 46a) un grupo heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxi C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , h) un grupo alquil C_1-C_6 -tio, i) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tio, j) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilo, k) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, l) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, m) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, n) un grupo monoalquil C_1-C_6 -amino, o) un grupo dialquil C_1-C_6 -amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 48a) un grupo fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxi C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , h) un grupo alquil C_1-C_6 -tio, i) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tio, j) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilo, k) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, l) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, m) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, n) un grupo monoalquil C_1-C_6 -amino, o) un grupo dialquil C_1-C_6 -amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 50a) un grupo fenoxialquil C_1-C_6 -carbonilo, 51a) un grupo fenoxialquil C_1-C_6 -carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C_1-C_6 , e) un grupo haloalquilo C_1-C_6 , f) un grupo alcoxi C_1-C_6 , g) un grupo haloalcoxi C_1-C_6 , h) un grupo alquil C_1-C_6 -tio, i) un grupo haloalquil C_1-C_6 -tio, j) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfinilo, k) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, l) un grupo alquil C_1-C_6 -sulfonilo, m) un grupo haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, n) un grupo monoalquil C_1-C_6 -amino, o) un grupo dialquil C_1-C_6 -amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios, sustituyentes iguales o

5 grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 36b) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ o 37b) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo;

10 G es 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo C₂-C₁₀, 3c) un grupo alqueno C₃-C₁₀, 4c) un grupo haloalqueno C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquino C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquino C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀, 8c) un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo alquilo C₁-C₆ y c) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 9c) un grupo cicloalqueno C₃-C₁₀, 10c) un grupo cicloalqueno C₃-C₁₀ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo alquilo C₁-C₆ y c) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ o 12c) un grupo halocicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆;

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

n es un número entero de 1-3, sus sales y ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4- carboxílico y una de sus sales.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

20 En las definiciones del derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de la fórmula (I) y el derivado sustituido de anilina de la fórmula (II) de la presente invención, "halo", "alquilo C₁-C₆", "alcoxi C₁-C₆", "alqueno C₂-C₆", "alquino C₂-C₆" o "un grupo heterocíclico" y similares en cada uno de los sustituyentes tiene el siguiente significado.

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

25 El "alquilo C₁-C₆" es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, tales como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, y similares.

El "alquilo C₁-C₈" es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 8 átomos de carbono, tales como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, i-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, 1-etilpropilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo, y similares.

30 El "alquilo C₂-C₁₀" es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 10 átomos de carbono, tales como etilo, n-propilo, i-propilo, n-butilo, 1-butilo, s-butilo, t-butilo, n-pentilo, isopentilo, neopentilo, t-pentilo, 2-metilbutilo, n-hexilo, 2-etilbutilo, 1-etilpropilo, n-heptilo, n-octilo, 2-etilhexilo, n-nonilo, n-decilo, y similares.

El "cicloalquilo C₃-C₆" es alquilo cíclico que tiene 3 a 6 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, y similares.

35 El "cicloalquilo C₃-C₈" es alquilo cíclico que tiene 3 a 8 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclooctilo, y similares.

El "cicloalquilo C₃-C₁₀" es alquilo cíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, ciclooctilo, ciclodecilo, y similares.

El "cicloalqueno C₃-C₁₀" es alqueno cíclico que tiene 3 a 10 átomos de carbono, tales como ciclopropeno, ciclobuteno, ciclopenteno, ciclohexeno, cicloocteno, ciclodeceno, y similares.

40 El "alcoxi C₁-C₃" es alcoxi, en donde su resto alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 3 átomos de carbono, tales como metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, y similares.

El "alcoxi C₁-C₆" es alcoxi, en donde su resto alquilo es el "alquilo C₁-C₆" antes mencionado, tales como metoxi, etoxi, n-propoxi, i-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, s-butoxi, t-butoxi, n-pentiloxi, isopentiloxi, neopentiloxi, t-pentiloxi, 2-metilbutoxi, 1-etilpropoxi, hexiloxi, 2-etilbutoxi, y similares.

45 El "alcoxi C₁-C₁₀" es alcoxi, en donde su resto alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 10 átomos de carbono, tales como metoxi, epoxi, n-propoxi, i-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, s-butoxi, t-butoxi, n-pentiloxi, isopentiloxi, neopentiloxi, t-pentiloxi, 2-metilbutoxi, 1-etilpropoxi, hexiloxi, 2-etilbutoxi, n-heptiloxi, n-octiloxi, 2-etilhexiloxi, n-noniloxi, n-deciloxi, y similares.

50 El "alcoxi C₁-C₁₆" es alcoxi, en donde su resto alquilo es alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 16 átomos de carbono, tales como metoxi, etoxi, n-propoxi, i-propoxi, n-butoxi, isobutoxi, s-butoxi, t-butoxi, n-pentiloxi, isopentiloxi, neopentiloxi, t-pentiloxi, 2-metilbutoxi, 1-etilpropoxi, hexiloxi, 2-etilbutoxi, n-heptiloxi, n-octiloxi, 2-etilhexiloxi, n-noniloxi, n-deciloxi, n-undeciloxi, n-dodeciloxi, n-trideciloxi, n-tetradeciloxi, n-pentadeciloxi, n-hexadeciloxi, y similares.

El "alqueno C₂-C₆" es alqueno de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 6 átomos de carbono, que tiene al menos un enlace doble tales como vinilo, 1-propeno, alilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-penteno, 2-metil-1-propeno, 2,4-pentadieno, 3-hexeno, y similares.

5 El "alqueno C₃-C₁₀" es alqueno de cadena lineal o ramificada que tiene 3 a 10 átomos de carbono, que tiene al menos un enlace doble, tales como 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 2-penteno, 2,4-pentadieno, 3-hexeno, 3-hepteno, 3-octeno, 3-noneno, 3-deceno, y similares.

El "alquino C₂-C₆" es alquino de cadena lineal o ramificada que tiene 2 a 6 átomos de carbono, que tiene al menos un enlace triple, tales como etino, 2-propino, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 2-pentino, 3-hexino, y similares.

10 El "alquino C₃-C₁₀" es alquino de cadena lineal o ramificada que tiene 3 a 10 átomos de carbono, que tiene al menos un enlace triple, tales como 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 2-pentino, 3-hexino, 3-heptino, 3-octino, 3-nonino, 3-decino, y similares.

Los números en "C₂-C₆", "C₃-C₁₀", y similares muestra el intervalo de números de átomo de carbono tales como 2 a 6 átomos de carbono y 3 a 10 átomos de carbono.

15 Más aún, las definiciones antes mencionadas se pueden aplicar a los grupos en los que los sustituyentes antes mencionados están conectados. Por ejemplo, "haloalquilo C₁-C₆" significa grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene 1 a 6 átomos de carbono, que está sustituido con uno o varios átomos de halógeno iguales o diferentes, tales como clorometilo, 2-cloroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, 3-cloropropilo, 2-cloro-1,1-dimetiletilo, 1-bromo-1-metiletilo, difluorometilo, trifluorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, perfluorohexilo, y similares.

20 "Un grupo heterocíclico" y "un heterociclilo" son grupos heterocíclicos de 5 ó 6 miembros que tienen uno o varios heteroátomos seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno incluyendo, por ejemplo, grupo piridilo, grupo piridin-N-óxido, grupo pirimidinilo, grupo furilo, grupo tetrahidrofurilo, grupo tienilo, grupo tetrahidrotienilo, grupo tetrahidropirano, grupo tetrahidropirano, grupo oxazolilo, grupo isoxazolilo, grupo oxadiazolilo, grupo tiazolilo, grupo isotiazolilo, grupo tiadiazolilo, grupo imidazolilo, grupo triazolilo y grupo pirazolilo.

25 Una sal de un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) de la presente invención incluye una sal de un metal alcalino (litio, sodio, potasio, etc.); una sal de un metal alcalinotérreo (calcio, magnesio, etc.); una sal de amonio; y una sal de una amina orgánica (metilamina, trietilamina, dietanolamina, piperidina, piridina, etc.) o una sal por adición de ácidos. La sal por adición de ácidos incluyen, por ejemplo, un carboxilato tales como acetato, propionato, oxalato, trifluoroacetato, benzoato, y similares; un sulfonato tales como metansulfonato, trifluorometansulfonato, p-toluensulfonato, y similares; una sal de ácido inorgánico tales como clorhidrato, un sulfato, un nitrato, un carbonato, y similares.

30 En los derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida representados por la fórmula (I) de la presente invención, R¹ es preferentemente 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo C₁-C₆, 3a) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 4a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilo, 5a) un grupo haloalquil C₁-C₆-carbonilo, 6a) un grupo alqueno C₂-C₆-carbonilo, 13a) un grupo alqueno C₂-C₆, 17a) un grupo alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 19a) un grupo alqueno C₂-C₆-oxialquilo C₁-C₆, 20a) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 29a) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfono, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 31a) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 32a) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 33a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-carbonilo, 34a) un grupo alqueno C₂-C₆-oxicarbonilo, 35a) un grupo alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, 42a) un grupo fenilalquilo C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfono, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfono, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfono, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfono, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 46a) un grupo heterociclilcarbonilo, 47a) un grupo heterociclilcarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un

- grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 48a) un grupo fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 50a) un grupo fenoxialquil C₁-C₆-carbonilo, 51a) un grupo fenoxialquil C₁-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 52a) un grupo fenilsulfonilo, 53a) un grupo fenilsulfonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 58a) un grupo dialquil C₁-C₆-aminotio, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquil C₃-C₆-carbonilo, 61a) un grupo alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆-carbonilo, 63a) un grupo fenilalquil C₁-C₆-carbonilo, 64a) un grupo fenilalquil C₁-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 65a) un grupo fenilcicloalquil C₃-C₆-carbonilo, 66a) un grupo fenilcicloalquil C₃-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfino, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfino, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 68a) un grupo alcoxi C₁-C₆-alquil C₁-C₆-carbonilo, 73a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilalquil C₁-C₆-carbonilo o 74a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilalquil C₁-C₆-carbonilo y, con mayor preferencia, 1a) un átomo de hidrógeno, 4a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilo, 5a) un grupo haloalquil C₁-C₆-carbonilo, 17a) un grupo alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxi C₁-C₁₆-carbonilo, 33a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-carbonilo o 68a) un grupo alcoxi C₁-C₆-alquil C₁-C₆-carbonilo.
- R² es, con preferencia, 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo de halógeno, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxi C₁-C₆ o 8b) un grupo haloalcoxi C₁-C₆ y, con mayor preferencia, 1b) un átomo de hidrógeno o 7b) un grupo alcoxi C₁-C₆.
- G es, con preferencia, 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀, 3c) un grupo alqueno C₃-C₁₀ u 11c) un grupo cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ y, con mayor preferencia, 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀.
- X es, con preferencia, 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo de halógeno, o 5d) un grupo alquilo C₁-C₆ y, con mayor preferencia, 1d) un átomo de hidrógeno.
- Z es, con preferencia, un átomo de oxígeno.
- Y¹ es, con preferencia, 2e) un grupo alquilo C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo C₁-C₆ o 4e) un grupo alqueno C₂-C₆ y, con mayor preferencia, 2e) un grupo alquilo C₁-C₆.
- Y² es, con preferencia, 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo de halógeno, 9f) un grupo alquilo C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo C₁-C₆ o 31f) un grupo alquil C₁-C₆-tio y, con mayor preferencia, 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo de halógeno, 9f) un grupo alquilo C₁-C₆ o 10f) un grupo haloalquilo C₁-C₆.
- m es, con preferencia, 2.

Además, una sal de un derivado sustituido de anilina representado por la fórmula (II) es, con preferencia, una sal por adición de ácidos que incluye, por ejemplo, un carboxilato tales como acetato, propionato, oxalato, trifluoroacetato, benzoato, y similares; un sulfonato tales como metansulfonato, trifluorometansulfonato, p-toluensulfonato, y similares; una sal de ácido inorgánico tales como un clorhidrato, un sulfato, un nitrato, un carbonato, y similares.

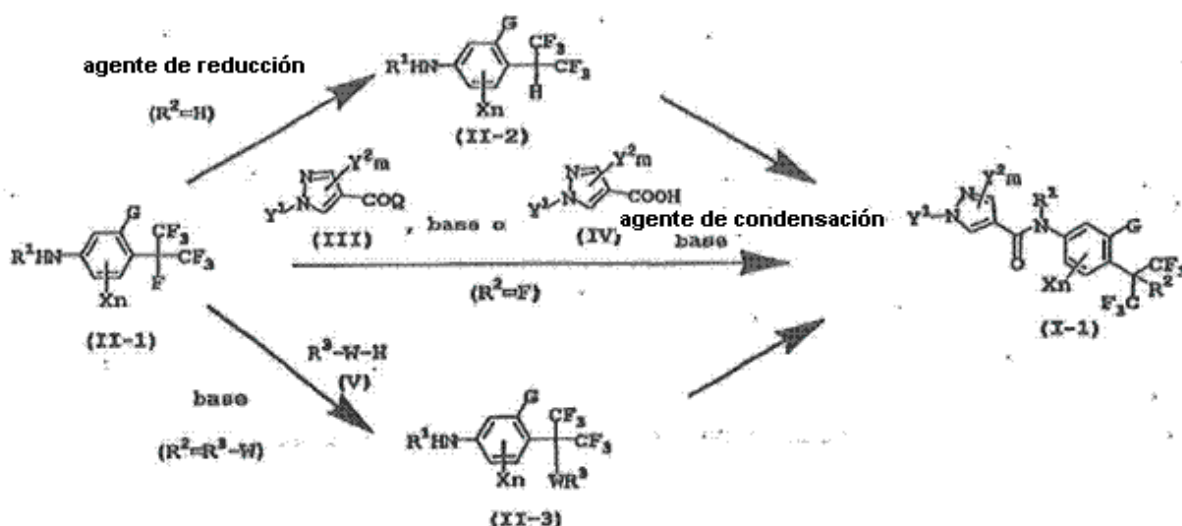
Una sal de ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico de la presente invención incluye una sal de un metal

alcalino (litio, sodio, potasio, etc.); una sal de metal alcalinotérreo (calcio, magnesio, etc.); una sal de amonio; y una sal de una amina orgánica (metilamina, trietilamina, dietanolamina, piperidina, piridina, etc.).

Un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) o uno de sus intermediarios, un derivado sustituido de anilina representado por la fórmula (II) de la presente invención puede contener uno o varios números de centros asimétricos en la fórmula estructural y otros dos o más isómeros ópticos y diastereómeros pueden estar presentes. En consecuencia, la presente invención comprende enteramente cada isómero óptico y las mezclas con cualquiera de sus relaciones. Además, un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) de la presente invención puede tener dos tipos de isómeros geométricos derivados de un enlace doble C-C en la fórmula estructural. La presente invención comprende todos los isómeros geométricos y las mezclas con ellos en cualquier proporción. Más aún, la presente invención comprende sus hidratos.

Los métodos de producción representativos para un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) y un derivado sustituido de anilina representado por la fórmula (II), como uno de sus intermediarios, se ilustran en la presente más abajo, pero la presente invención no se debe construir como limitativa.

Método de producción 1



(en donde G, R^1 , X, n, Y^1 , Y^2 y m son como se definieron con anterioridad; y R^3 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo C_1-C_4 ; W es -O-, -S- o -N(R^4)-, en donde R^4 es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 , un grupo haloalquilo C_1-C_6 , un grupo fenilo, un grupo fenilo sustituido o un grupo fenilalquilo C_1-C_4 ; y Q es un átomo de halógeno o un grupo alcoxilo C_1-C_6).

Entre un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I), un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida (I-1), en donde Z es O y R^2 es un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor o WR^3 , en donde W y R^3 son como se definieron con anterioridad, se puede producir haciendo reaccionar un derivado de anilina representado por las fórmulas (II-1) a (II-3) con un haluro pirazolcarboxílico o un éster de pirazolcarboxilato representado por la fórmula (III) en presencia o ausencia de una base en un disolvente inerte o haciendo reaccionar un derivado de anilina representado por las fórmulas (II-1) a (II-3) con un ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (IV) en presencia de un agente de condensación, en presencia o ausencia de una base, en un disolvente inerte y cualquier método de producción usual para amidas puede ser aplicable.

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

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

La fórmula (II-1) \rightarrow la fórmula (II-2)

Un ejemplo de un agente de reducción para usar en la presente reacción incluye hidruros metálicos tales como hidruro de litio y aluminio, borhidruro de litio, borhidruro de sodio, hidruro de diisobutilaluminio, hidruro de bis(2-metoxietoxi)aluminio y sodio, y similares, metal tales como litio, y similares o sales metálicas, y similares. La cantidad del agente de reducción por usar se puede seleccionar, de ser apropiado, en el intervalo de cantidad equivalente a cantidad en exceso respecto a un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1).

Un ejemplo de un disolvente inerte por usar en la presente reacción, que puede ser cualquiera siempre que no inhiba de forma significativa el progreso de la presente reacción, incluye hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, y similares; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, y similares; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, diclorobenceno, y similares; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, y similares, o dimetilsulfóxido, y similares y estos disolventes inertes se pueden usar solos o en combinación de dos o más tipos.

5

La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de temperatura ambiente a temperatura de ebullición de un disolvente inerte por usar y el tiempo de reacción puede estar en el intervalo de varios minutos a 50 horas, si bien depende de la escala de reacción y la temperatura de reacción.

10 Después de completar la reacción, el compuesto deseado se puede aislar de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado se puede producir por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., de ser necesario. El compuesto deseado también se puede someter a posterior etapa de reacción sin aislamiento de la mezcla de reacción.

La fórmula (XI-1) → la fórmula (II-3)

15 Un ejemplo de una base por usar en la presente reacción incluye hidruros metálicos tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, y similares; alcoholatos de metal tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, ter-butóxido de potasio, y similares; y metales de alquilo tales como n-butil-litio, sec-butil-litio, ter-butil-litio y similares. La cantidad de la base por usar se puede seleccionar, de ser apropiado, en el intervalo de cantidad equivalente a cantidad en exceso respecto de un derivado de anilina representado por la fórmula (II-1).

20 Como un ejemplo de un disolvente inerte por usar en la presente reacción, que puede ser cualquiera siempre que no inhiba de modo significativo el progreso de la presente reacción, incluye hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, y similares; alcoholes tales como metanol, etanol, y similares; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrahidrofurano, y similares, y otros y estos disolventes inertes se pueden usar solos o en combinación de dos o más tipos.

25 La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de -70 °C a temperatura de ebullición de un disolvente inerte por usar y el tiempo de reacción puede estar en el intervalo de varios minutos a 50 horas, si bien depende de la escala de reacción y la temperatura de reacción.

Después de completar la reacción, el compuesto deseado se puede aislar de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado se puede producir por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., de ser necesario. El compuesto deseado también se puede someter a posterior etapa de reacción sin aislamiento de la mezcla de reacción.

30

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

Un ejemplo de un agente de condensación por usar en la presente reacción incluye cianofosfato de dietilo (DEPC), carbonildiimidazol (CDI), 1,3-diciclohexilcarbodiimida (DCC), cloroformatos, yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinio, y similares.

35

Como una base por usar en la presente reacción, se incluye una base inorgánica o una base orgánica y un ejemplo de una base inorgánica incluye hidróxidos de metal alcalino tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, y similares; hidruros de metal alcalino tales como hidruro de sodio, hidruro de potasio, y similares; sales de metales alcalinos de alcohol tales como etóxido de sodio, ter-butóxido de potasio, y similares; carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio, y similares; y un ejemplo de las bases orgánicas incluye trietilamina, piridina, DBU, y similares. La cantidad de la base por usar se puede seleccionar en el intervalo de cantidad equivalente a cantidad en exceso respecto de un derivado de ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (III) o (IV).

40

Un ejemplo de un disolvente inerte por usar en la presente reacción, que puede ser cualquiera siempre que no inhiba de modo significativo el progreso de la presente reacción, incluye hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, y similares; hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, y similares; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, diclorobenceno, y similares; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, dioxano, tetrahidrofurano, y similares; ésteres tales como acetato de etilo, y similares; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, y similares; dimetilsulfóxido; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona; acetona, metiletilcetona, y similares. Estos disolventes inertes se pueden usar solos o en combinación de dos o más tipos.

45

50

Como la presente reacción es una reacción equimolar, cada reactivo se puede usar en moles iguales, sin embargo, cualquiera de los reactivos también se puede usar en exceso. La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de temperatura ambiente a temperatura de ebullición de un disolvente inerte por usar y el tiempo de reacción puede estar en el intervalo de varios minutos a 48 horas, si bien depende de la escala de reacción y la temperatura de reacción.

55

Después de completar la reacción, el compuesto deseado se puede aislar de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado se puede producir por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., de ser necesario.

- 5 Un derivado de anilina representados por la fórmula (II-1), como una materia prima de la presente reacción, se puede producir de acuerdo con un método de producción revelado en el documento JP-A-11-302233, JP-A-2001-122836 o JP-A-2006-8675.

Un derivado de ácido pirazolcarboxílico representado por las fórmulas (III) o (IV) se puede producir de acuerdo con diversos métodos descritos en las bibliografías conocidas (por ejemplo, Aust. J. Chem., 1983, 36, 135-147, Synthesis, 1986, 753-755, JP-A-52-87168, JP-A-63-45264, JP-A-1-106866, y similares).

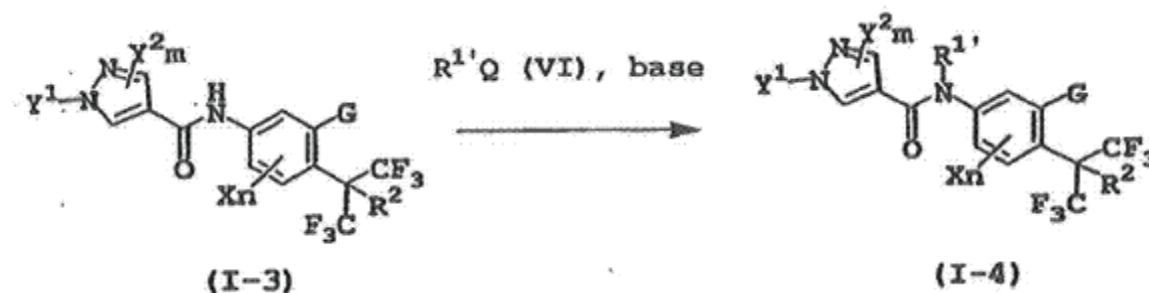
10 Método de producción 2



(en donde G, R¹, R², X, n, Y¹, Y² y m son como se definieron con anterioridad).

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

Método de producción 3



(en donde G, R², X, n, Y¹, Y², m y Q son como se definieron con anterioridad y R¹' es como se definió con anterioridad, excepto por un átomo de hidrógeno).

- 20 Entre los derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida representados por la fórmula (I), se puede producir un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida (1-4), en donde R¹' es distinto de un átomo de hidrógeno, haciendo reaccionar un derivado de amida representado por la fórmula (I-3) con un derivado de haluro o un derivado de éster representado por la fórmula (VI), en presencia o ausencia de una base, en un disolvente inerte.

- 25 Como un ejemplo de una base por usar en la presente reacción, incluye hidróxidos de metal tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, y similares; carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio, y similares; hidruros metálicos tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio, y similares; alcoholatos de metal tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, ter-butóxido de potasio, y similares; metales de alquilo tales como n-butil-litio, sec-butil-litio, ter-butil-litio, y similares. La cantidad de la base por usar se puede seleccionar, de ser apropiado, en el intervalo de cantidad equivalente a cantidad en exceso respecto de un derivado de amida representados por la fórmula (I-3).

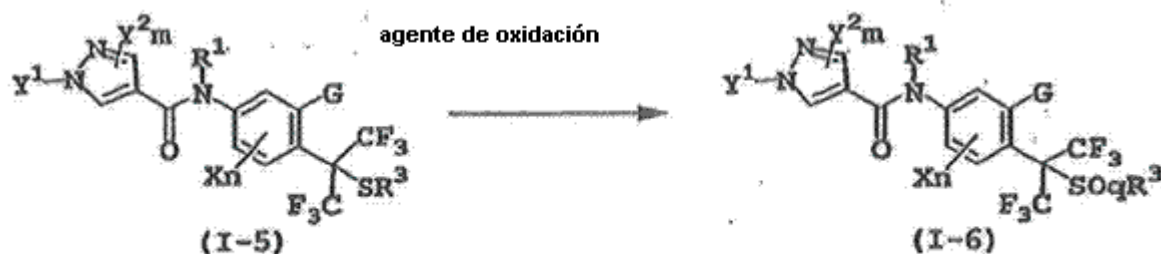
- 35 Un ejemplo de un disolvente inerte por usar en la presente reacción, que puede ser cualquiera siempre que no inhiba de modo significativo el progreso de la presente reacción, incluye hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno, xileno, y similares; alcoholes tales como metanol, etanol, y similares; éteres de cadena lineal o cíclicos tales como éter dietílico, 1,2-dimetoxietano, dioxano, tetrabidrofurano, y similares; amidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida, y similares; dimetilsulfóxido; 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, y similares. Estos disolventes inertes se

pueden usar solos o en combinación de dos o más tipos.

La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de -70 °C a temperatura de ebullición de un disolvente inerte por usar y el tiempo de reacción puede estar en el intervalo de varios minutos a 50 horas, si bien depende de la escala de reacción y la temperatura de reacción.

- 5 Después de completar la reacción, el compuesto deseado se puede aislar de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado se puede producir por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., de ser necesario.

Método de producción 4



- 10 (en donde G, R¹, R³, X, n, Y¹, Y² y m son como se definieron con anterioridad y q es 1 ó 2).

Un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I-6) se puede producir haciendo reaccionar un derivado de sulfuro representado por la fórmula (I-5) que se puede producir en el Método de producción 1 con un agente de oxidación en presencia de un disolvente inerte.

- 15 Un ejemplo de un disolvente inerte por usar en la presente reacción incluye hidrocarburos halogenados tales como cloruro de metileno, cloroformo, y similares; hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, y similares; hidrocarburos aromáticos halogenados tales como fluorobenceno, clorobenceno, diclorobenceno, y similares; ácidos tales como ácido acético, y similares; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, y similares.

- 20 Un ejemplo de un agente de oxidación incluye ácido m-peroxiclorobenzoico, ácido peracético, metaperyodato de potasio, hidrógeno-persulfato de potasio (Oxone), peróxido de hidrógeno, y similares. La cantidad de agente de oxidación por usar se puede seleccionar, de ser apropiado, en el intervalo de 0,5 a 3 equivalentes respecto de un derivado de sulfuro representado por la fórmula (I-5).

La temperatura de reacción puede estar en el intervalo de -50 °C a temperatura de ebullición de un disolvente inerte por usar y el tiempo de reacción puede estar en el intervalo de varios minutos a 24 horas, si bien depende de la escala de reacción y la temperatura de reacción.

- 25 Después de completar la reacción, el compuesto deseado se puede aislar de la mezcla de reacción por un método convencional y el compuesto deseado se puede producir por purificación usando recristalización o cromatografía en columna, etc., de ser necesario.

- 30 Los compuestos típicos de derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida representados por la fórmula (I) se ejemplifican en la Tabla 1 y la Tabla 2 y los compuestos típicos de derivados sustituidos de anilina representados por la fórmula (II) se ejemplifican en la Tabla 3 y un derivado sustituido de ácido pirazolcarboxílico representado por la fórmula (IV) se ejemplifica en la Tabla 4, sin embargo, la presente invención no debería construirse como limitativa a ellas.

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

Formula (I-4)

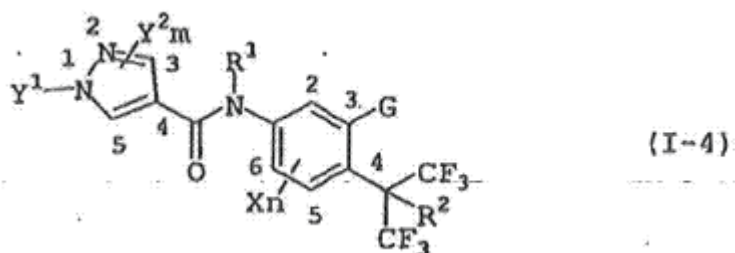


Tabla 1 (Xn =H)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)


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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)


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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

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

Tabla 1 (continuación)

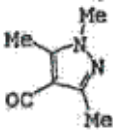
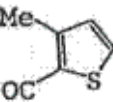
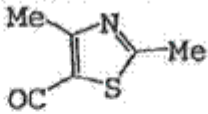
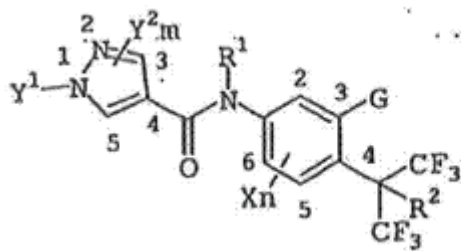
N.º	G	Y ¹	Y ² _n	R ¹	R ²	Propiedad
1-523	i-Bu	Me	3-I-5-Me	COOMe	OMe	pasta
1-524	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CO-i-Pr	OMe	pasta
1-525	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ OEt	OMe	100-103
1-526	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	100-102
1-527	i-Bu	Me	3, 5-Me ₂	CH ₂ CH=CMe ₂	OMe	81-83
1-528	CH=CMe ₂	Me	3, 5-Me ₂	H	OMe	
1-529	i-Bu	Me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

Tabla 1 (continuación)

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

Fórmula (I-4)



(I-4)

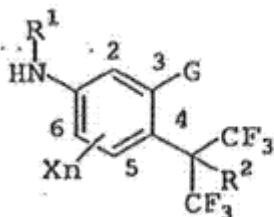
Tabla 2 (Y¹ = Me)

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

Tabla 2 (continuación)

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

Fórmula (II)

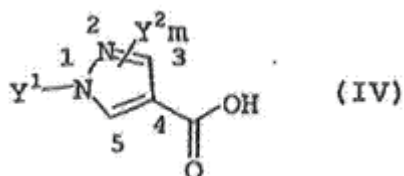


(II)

Tabla 3 (R¹ = H)

No	G	Xn	R ²	¹ H-NMR[CDCl ₃ /TMS, valor δ (ppm)]
3-1	n-Pr	6-Me	F	7.09(s, 1H), 6.54(s, 1H), 3.76(bs, 2H), 2.63(m, 2H), 2.13(s, 3H), 1.58(m, 2H), 0.96(t, 3H)
3-2	n-Pr	6-Me	H	7.18(s, 1H), 6.54(s, 1H), 4.45-4.20(br, 2H), 4.27(m, 1H), 2.50(dd, 2H), 2.14(s, 3H), 1.57(m, 2H), 0.98(t, 3H)
3-3	n-Pr	6-Me	OMe	7.10(s, 1H), 6.66(s, 1H), 3.72(bs, 2H), 3.42(s, 3H), 2.84(m, 2H), 2.14(s, 3H), 1.61(m, 2H), 1.00(t, 3H)
3-4	Et	6-Me	F	7.09(s, 1H), 6.56(s, 1H), 3.78(bs, 2H), 2.71(m, 2H), 2.14(s, 3H), 1.19(td, 3H)
3-5	Et	6-Me	OMe	7.10(s, 1H), 6.68(s, 1H), 3.75(bs, 2H), 3.41(s, 3H), 2.91(dd, 2H), 2.15(s, 3H), 1.22(t, 3H)
3-6	Et	H	O-n-Pr	7.22(d, 1H), 6.67(d, 1H), 6.52(dd, 1H), 3.80(br, 2H), 3.46(t, 2H), 2.92(dd, 2H), 1.69(dd, 2H), 1.21(t, 3H), 0.94(t, 3H)
3-7	n-Pr	H	O-n-Pr	7.22(d, 1H), 6.66(d, 1H), 6.51(dd, 1H), 3.78(br, 2H), 3.47(t, 2H), 2.85(m, 2H), 1.70(dd, 2H), 1.60(m, 2H), 1.00(t, 3H), 0.94(t, 3H)
3-8	i-Bu	H	O-n-Pr	7.24(d, 1H), 6.70(d, 1H), 6.53(dd, 1H), 3.79(bs, 2H), 3.47(t, 2H), 2.81(d, 2H), 2.10(m, 1H), 1.70(m, 2H), 0.95(t, 3H), 0.91(d, 6H)

Fórmula (IV)



5 Tabla 4

N.º	Y ¹	Y ² m	punto de fusión (°C)
4-1	Me	3-Me-5-CF ₃	124-125.5

Tabla 5

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

Tabla 5 (continuación)

N.º	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, valor δ (ppm)]
1-421	7.40 (d, 1H), 7.16 (m, 2H), 5.30 (s, 2H), 3.61 (t, 2H), 3.59 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.87 (m, 1H), 1.59 (m, 2H), 1.37 (m, 2H), 0.91 (t, 3H), 0.76 (d, 6H)
1-422	7.39 (d, 1H), 7.18 (m, 2H), 5.31 (s, 2H), 3.91 (m, 1H), 3.59 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.87 (m, 1H), 1.22 (d, 6H), 0.77 (d, 6H)
1-424	7.39 (d, 1H), 7.23 (m, 2H), 5.23 (s, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.07 (s, 6H), 1.89 (m, 1H), 1.26 (s, 9H), 0.78 (d, 6H)
1-425	7.39 (d, 1H), 7.17 (m, 2H), 5.43 (d, 1H), 5.22 (d, 1H), 3.68 (m, 1H), 3.59 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.08 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.87 (m, 1H), 1.46-1.63 (m, 2H), 1.20 (d, 3H), 0.89 (t, 3H), 0.77 (dd, 6H)
1-426	7.42 (d, 1H), 7.10 (m, 2H), 5.43 (s, 1H), 4.14 (q, 2H), 3.58 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.05 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.85 (m, 1H), 0.76 (d, 6H)
1-427	7.40 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 7.13 (d, 1H), 5.87-5.98 (m, 1H), 5.32 (s, 2H), 5.29 (dd, 1H), 5.20 (dd, 1H), 4.16 (d, 2H), 3.59 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.87 (m, 1H), 0.76 (d, 6H)
1-428	7.39 (d, 1H), 7.15 (m, 2H), 5.30 (s, 2H), 3.60 (t, 2H), 3.59 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.80 (d, 2H), 2.09 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.88 (m, 1H), 1.60 (m, 2H), 1.27 (m, 10H), 0.88 (t, 3H), 0.77 (d, 6H)
1-429	7.49 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 3.68 (s, 3H), 3.46 (m, 1H), 3.46 (s, 3H), 2.88 (d, 2H), 2.40 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.84-2.11 (m, 5H), 0.80 (d, 6H)
1-448	7.49 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.98 (m, 1H), 3.64 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 2.86 (d, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.95 (m, 1H), 1.38 (s, 9H), 0.76 (d, 6H)
1-452	7.49 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.13 (m, 1H), 4.31 (s, 2H), 3.71 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 2.88 (d, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.03 (m, 1H), 0.79 (d, 6H)
1-514	7.53 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 2.92 (d, 2H), 2.88 (m, 1H), 2.43 (s, 3H), 2.07 (m, 1H), 1.21 (d, 6H), 0.84 (d, 6H)
1-515	7.41 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.92 (m, 1H), 3.63 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 2.82 (d, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.94 (m, 1H), 1.21 (d, 6H), 0.79 (d, 6H)
1-516	7.55 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.16 (dd, 1H), 3.79 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 2.94 (d, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.14 (m, 1H), 0.92 (d, 6H)

Tabla 5 (continuación)

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

Tabla 5 (continuación)

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

El agente agrohortícola, en particular, insecticidas o acaricidas agrohortícolas, con un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) o una sal, de la presente invención, como un ingrediente activo, son adecuados para controlar varias plagas de insectos tales como las plagas de insectos agrohortícolas, las plagas de insectos de los granos almacenados, las plagas de insectos sanitarios, nematodos, etc., que son dañinos para el arroz con cáscara, los árboles frutales, las verduras, otros cultivos, las flores y plantas ornamentales, etc. Estos tienen un marcado efecto insecticida, por ejemplo, sobre los LEPIDÓPTEROS incluyendo polilla de la piel (*Capua Adoxophyes orana fasciata*), polilla pequeña del té (*Adoxophyes sp.*), polilla de la fruta de Manchuria (*Grapholita inopinata*), polilla oriental del durazno (*Grapholita molesta*), barrenador de vainas de soja (*Leguminivora glycinivorella*), insecto que arruga las hojas de la morera (*Olethreutes mori*), insecto que arruga las hojas del té (*Caloptilia thevivora*), *Caloptilia sp.* (*Caloptilia zachrysa*), barrenador de las hojas del manzano (*Phyllonorycter ringoniella*), barrenador de la corteza del peral (*Spulerrina astaurota*), blanco común (*Piers rapae crucivora*), gusano de las yemas del tabaco (*Heliothis sp.*), polilla de las manzanas verdes (*Laspeyresia pomonella*), polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*), polilla de la fruta del manzano (*Argyresthia conjugella*), polilla de la fruta del durazno (*Carposina niponensis*), barrenador de los tallos del arroz (*Chilo suppressalis*), insecto que arruga las hojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), polilla del tabaco (*Ephestia elutella*), pirálida de la morera (*Glyphodes pyloalis*), barrenador del arroz amarillo (*Scirpophaga incertulas*), mariposa del arroz (*Parnara guttata*), oruga del arroz (*Pseudaletia separata*), barrenador del clavel (*Sesamia inferens*), oruga podadora común (*Spodoptera litura*), oruga de la remolacha (*Spodoptera exigua*), etc.;

HEMÍPTEROS incluyendo el saltador de hojas de áster (*Macrostelus fascifrons*), saltador de hojas de arroz verde (*Nephotettix cincticeps*), saltador de plantas de arroz moreno (*Nilaparvata lugens*), saltador de plantas de arroz, de dorso blanco (*Sogatella furcifera*), citrus psylla (*Diaphorina citri*), mosca blanca de la uva (*Aleuolobus taonabae*), mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), mosca blanca de invernadero (*Trialeurodes vaporariorum*), áfido del nabo (*Lipaphis erysimi*), áfido del durazno verde (*Myzus persicae*), cochinilla de cera india (*Ceroplastes ceriferus*), cochinilla de cítricos algodonosos (*Pulvinaria aurantii*), cochinilla del alcanfor (*Pseudaonidia duplex*), cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciosus*), cochinilla de punta de flecha (*Unaspis yanonensis*), etc.;

COLEÓPTEROS incluyendo el escarabajo de la soja (*Anomala rufocuprea*), escarabajo japonés (*Popillia japonica*), escarabajo del tabaco (*Lasioderma serricornis*), escarabajo pulverizador (*Lyctus brunneus*), mariquita de veintiocho puntos (*Epilachna vigintiotopunctata*), gorgojo del poroto azuki (*Callosobruchus chinensis*), gorgojo de las verduras (*Listroderes costirostris*), gorgojo del maíz (*Sitophilus zeae mays*), gorgojo de las cápsulas (*Anthonomus grandis grandis*), gorgojo del agua del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), escarabajo de las hojas de la calabaza (*Aulacophora femoralis*), escarabajo de las hojas del arroz (*Oulema oryzae*), escarabajo pulga rayado (*Phyllotreta striolata*), escarabajo de los brotes del pino (*Tomicus piniperda*), escarabajo de la papa de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata*), escarabajo del poroto mexicano (*Epilachna varivestis*), gusano de las raíces del maíz (*Diabrotica sp.*), etc.;

DÍPTEROS incluyendo la mosca del melón (*Dacus (Zeugodacus) cucurbitae*), mosca de la fruta oriental (*Dacus (Bactrocera) dorsalis*), barrenador de las hojas del arroz (*Agnomyza oryzae*), cresa de la cebolla (*Delia antiqua*), cresa del trigo de siembra (*Delia platura*), jején de agallas de las hojas de soja (*Asphondylia sp.*), etc.;

TILÉNQUIDOS incluyendo el nematodo de la lesión de las raíces (*Pratylenchus sp.*), nematodo de quistes de la papa (*Globodera rostochiensis*), nematodo de las agallas de las raíces (*Meloidogyne sp.*), nematodo de los cítricos (*Tylenchulus semipenetrans*), *Aphelenchus sp.* (*Aphelenchus avenae*), foliar del crisantemo (*Aphelenchoides ritzemabosi*), etc.; y

ÁCAROS incluyendo el ácaro rojo (*Panonychus citri*), araña roja de los frutales (*Panonychus ulmi*), arañita roja del algodónero (*Tetranychus cinnabarinus*), arañuela de Kanzawa (*Tetranychus Kanzawai Kishida*), ácaro de dos puntos (*Tetranychus urticae Koch*), ácaro rosado (*Acaphylla these*), ácaro del moho del cítrico japonés (*Aculops pelekassi*),

ácaro púrpura (*Calacarus carinatus*), ácaro agamuzado del peral (*Epirimerus pyri*), etc.

Un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) o sus sales de la presente invención se usa preferentemente como insecticida o acaricida agrohortícola. Sin embargo, el compuesto exhibe un excelente efecto de control contra varias plagas de insectos, tales como plagas de insectos para el bosque y la madera, plagas de insectos para el ganado, plagas de insectos sanitarias, etc., y se pueden usar como agentes de control de plagas en varios campos. Ejemplos de plagas de insectos incluyen: Tabanidae tales como *Tabanus rufidens* Bigot; Muscidae tales como la mosca doméstica (*Musca domestica vicina* MACQUART); Gasterofilidae tales como la mosca gasterófila de los caballos (*Gasterophilus intestinalis*); Hypodermatidae tales como la miasis de los bovinos (*Hypoderma bovis* L.); Phoridae tales como *Megaselia spiracularis*; Culicidae tales como el mosquito común (*Culex pipiens pallens*), *Anopheles sinensis*, el mosquito tigre (*Aedes albopictus*) y el *Aedes japonicus*; Pulicidae tales como la pulga felina (*Ctenocephalides felis*), la pulga canina (*Ctenocephalides canis*), la pulga del hombre (*Pulex irritans*); Ixodidae tales como *Ixodes ovatus* Neumann; Linantriidae tales como *Euproctis similis*; Rhynchophoridae tales como el gorgojo del maíz (*Sitophilus zeae mays*); Vespidae tales como *Vespa simillima xanthoptexa* Camaron; Blattellidae tales como la cucaracha alemana (*Blattella germanica*); Blattidae tales como la cucaracha americana (*Periplaneta americana*) y la *Periplaneta Japonica*; Ptiridae tales como los piojos del pubis (*Phthirus pubis*); Termitidae tales como la termita japonesa (*Reticulitermes speratus*) y la termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus*); y los Ixodidae tales como *Ixodes persulcatus*; y Macronissidae tales como el ácaro tropical de los ratones (*Ornitorissus bacoti*).

El agente agrohortícola, en particular, los insecticidas o acaricidas agrohortícolas, con un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representados por la fórmula (I) o sus sales de la presente invención como un ingrediente activo tiene un marcado efecto de control sobre las plagas de insectos arriba ilustrados, que son dañinos para los cultivos de los campos de arroz, los cultivos de las tierras altas, los árboles frutales, las verduras y otros cultivos, las flores y las plantas ornamentales, y similares. Por lo tanto, el efecto deseado de los insecticidas agrohortícolas de la presente invención puede ser exhibido aplicando los agentes a campos de arroz, campos, árboles frutales, verduras, otros cultivos, semillas de flores y plantas ornamentales, al agua de los campos de arroz, a tallos y hojas, o al suelo, en una estación en la que se espera que aparezcan las plagas de insectos, antes de su aparición o en el momento en que se confirma su aparición. Las plantas, para las cuales se puede usar un agente agrohortícola de la presente invención, no están limitadas específicamente e incluyen, por ejemplo, las plantas que se muestran a continuación: Cereales (por ejemplo, arroz (*Oryza sativa*), cebada (*Hordeum vulgare*), trigo (*Triticum aestivum* L.), centeno (*Secale cereale*), avena (Avena), maíz (*Zea mays* L.), kaoliang, etc.); legumbres (porotos de soja, porotos adzuki, porotos fava, porotos, maní, etc.); árboles frutales y frutas (manzana; frutas cítricas, pera, uva, durazno, ciruela, cereza, nuez, almendra, banana, frutilla, etc.); verduras (col, tomate, espinaca, brócoli, lechuga, cebolla, cebolla de verdeo, pimiento verde, etc.); verduras de raíz (zanahoria, papa, batata, rabanito, raíz de loto, nabo, etc.); cultivos para procesamiento (algodón, lino (*Linum usitatissimum*), papel de morera (*Broussonetia kasinoki* Sieb), árbol de papel (*Edgeworthia papyrifera*), colza (*Brassica napus* L.), remolacha (*Beta vulgaris*), lúpulo, caña de azúcar (*Saccharum officinarum*), remolacha azucarera (*Beta vulgaris* var. *saccharifera*), olivo, caucho, café, tabaco, té, etc.); calabazas (zapallo, pepino, sandía, melón, etc.); pastos (pasto ovillo, sorgo, pasto Timothy, trébol, alfalfa, etc.); pastos (césped de Corea, césped para canchas de golf, etc.); cultivos para especias (lavanda (*Lavandula officinalis* Chaix), romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.); y flores (crisantemo, rosa, orquídea, etc.).

Recientemente, cultivos de genes recombinantes (cultivos resistentes a los herbicidas, cultivos resistentes a las plagas de insectos a los que se incorporó un gen que genera una toxina insecticida, cultivos resistentes a enfermedades a los que se incorporó un gen que produce un inductor de la resistencia a enfermedades, cultivos que mejoran el sabor, cultivos que mejoran la preservación, cultivos con rendimiento mejorado, etc.), feromona sexual de los insectos (productos químicos de interrupción de feromonas para las polillas que enrollan las hojas, oruga de la col, etc.), tecnología IPM (manejo integrado de las plagas) usando insectos enemigos naturales han avanzado y composiciones de plaguicidas de la presente invención se pueden usar en combinación o por sistematización con tales tecnologías.

El agente agrohortícola de la presente invención se prepara generalmente en formas que se pueden usar convenientemente de acuerdo con una manera común para la formulación de los agroquímicos.

Es decir, el derivado sustituido de pirazolcarboxanilida representado por la fórmula (I) o una sal de la presente invención y, opcionalmente, un adyuvante se mezclan con un vehículo inerte adecuado en una proporción adecuada y se prepara en una forma de formulación adecuada tal como una suspensión, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, un polvo humectable, gránulos dispersables en agua, gránulos, polvo, comprimidos, un pack o similar mediante la disolución, dispersión, suspensión, mezclado, impregnación, adsorción o adhesión.

El vehículo inerte que se puede usar en la presente invención puede ser o bien sólido o líquido. Como un material que se puede usar como el vehículo sólido, se puede ejemplificar la harina de soja, harina de cereales, harina de madera, harina de corteza, aserrín, tallos de tabaco en polvo, cáscaras de nueces en polvo, salvado, celulosa en polvo, residuo de extracción de vegetales, resinas tales como polímeros sintéticos en polvo y similares, arcillas (por ejemplo, caolín, bentonita y arcilla ácida), talcos (por ejemplo, talco y pirofilita), polvo o copos de sílice (por ejemplo, tierra de diatomeas, arena de sílice, mica y carbón blanco (ácido silícico de alta dispersión, sintético, denominado también sílice hidratada finamente dividida o ácido silícico hidratado, algunos productos que se pueden obtener comercialmente contienen silicato de calcio como el principal componente), polvos inorgánicos o minerales, tales como carbón activado, azufre en polvo, piedra pómez, tierra de diatomeas calcinada, ladrillo molido, ceniza fina, arena, carbonato de calcio, fosfato

de calcio y similares, vehículos plásticos tales como polietileno, polipropileno, poli(vinilideno cloruro) y similares, fertilizantes químicos (por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, urea y cloruro de amonio) y compost. Estos vehículos se pueden usar solos o como una mezcla de dos o más tipos de estos.

5 Un material que se puede usar como el vehículo líquido es seleccionado entre materiales que tienen solubilidad en sí mismos o que, aún sin tal solubilidad, son capaces de dispersar un ingrediente activo con la ayuda de un adyuvante. Los siguientes son ejemplos típicos de vehículos líquidos y se pueden usar solos o como una mezcla de dos o más tipos de estos: agua, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol y etilenglicol), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutilcetona, diisobutilcetona y ciclohexanona), éteres (por ejemplo, éter etílico, dioxano, Cellosolve, éter dipropílico y tetrahidrofurano), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, querosén y aceites minerales), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, nafta solvente y alquilnaftalenos), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, cloroformo, tetracloruro de carbono y clorobenceno), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo y ftalato de dioctilo), amidas (por ejemplo, dimetilformamida, dietilformamida y dimetilacetamida), nitritos (por ejemplo, acetonitrilo) y dimetilsulfóxido.

10 Los siguientes son ejemplos típicos del adyuvante, que se usan dependiendo de los propósitos y se usan solos o en combinación de dos o más tipos o en algunos casos, no necesitan ser usados.

15 Para emulsionar, dispersar, disolver y/o humectar un compuesto como ingrediente activo, se usa un tensioactivo. Como el tensioactivo, se puede ejemplificar, éteres alquílicos de polioxietileno, éteres alquilarílicos de polioxietileno, ésteres de ácidos grasos superiores de polioxietileno, resinatos de polioxietileno, monolaurato de polioxietilensorbitano, monooleato de polioxietilensorbitano, sulfonatos de alquilarilo, productos de condensación de ácido naftalensulfónico, ligninasulfonatos y ésteres sulfato de alcoholes superiores.

20 Además, para estabilizar la dispersión de un compuesto como ingrediente activo, adherirlo y/o ligarlo, se pueden usar los adyuvantes ilustrados más abajo, a saber, se pueden usar también adyuvantes tales como caseína, gelatina, almidón, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, goma arábiga, alcohol poli(vinílico), aguarrás, aceite de salvado, bentonita y ligninasulfonatos.

25 Para mejorar la fluidez de un producto sólido, se pueden usar también los siguientes adyuvantes, a saber, se pueden usar adyuvantes tales como ceras, estearatos, fosfatos de alquilo, etc.

Los adyuvantes tales como los productos de condensación del ácido naftalenoulfónico y policondensados de fosfatos se pueden usar como un peptizador para productos dispersables.

30 Los adyuvantes tales como los aceites de silicona también se puede usar como un agente antiespumante. Los adyuvantes tales como 1,2-benzisotiazolin-3-ona, p-cloro-m-xilenol, p-hidroxibenzoato de butilo también pueden ser agregados como un conservante. Además, si es necesario, se pueden agregar también agentes dispersantes funcionales, intensificadores de activos, tales como el inhibidor de la descomposición metabólica, como butóxido de piperonilo, agentes anticongelantes, tales como propilenglicol, antioxidantes tales como BHT, absorbedores de rayos ultravioletas y los otros aditivos.

35 El contenido del compuesto como ingrediente activo se puede variar como se requiera, y el compuesto como ingrediente activo se puede usar en una proporción elegida adecuadamente en el rango de 0,01 a 90 partes en peso por 100 partes de los agentes agrohortícolas. Por ejemplo, en polvos o gránulos, el contenido adecuado del compuesto como ingrediente activo es del 0,01 al 50% en peso. En polvos humectables o concentrados emulsionables, es también del 0,01 al 50% en peso. El agente agrohortícola de la presente invención se usa para controlar una variedad de plagas de insectos de la siguiente manera: se aplica a un cultivo en el cual se espera que aparezcan las plagas de insectos o un sitio en el cual es indeseable la aparición o el crecimiento de las plagas de insectos, tal cual o después de haber sido diluido adecuadamente con, o suspendido en, agua o similar, en una cantidad efectiva para el control de las plagas de insectos. La dosificación a aplicar del agente agrohortícola de la presente invención varía dependiendo de varios factores tales como el propósito, las plagas de insectos a ser controladas, un estado de crecimiento de una planta, la tendencia de las plagas de insectos, el aspecto, el tiempo, las condiciones ambientales, una forma de formulación, un método de aplicación, un sitio de aplicación y el tiempo de aplicación. Se puede elegir adecuadamente en el rango de 0,001 g a 10 kg, preferentemente 0,01 g a 1 kg, (en términos del compuesto como ingrediente activo) por 10 áreas dependiendo de los fines.

40 El agente agrohortícola de la presente invención se puede usar en mezcla con otros insecticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, plaguicidas bióticos agrohortícolas, o similares, para expandir el espectro de la especie de plaga de insecto controlable y el período de tiempo cuando es posible la aplicación efectiva o para reducir la dosificación. Además, el insecticida agrohortícola de la presente invención se puede usar mezclado con herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, fertilizantes o similares, dependiendo de las situaciones de aplicación.

45 Como los otros insecticidas, acaricidas y nematocidas agrohortícolas, que se usan para el fin anterior, se pueden ejemplificar insecticidas, acaricidas y nematocidas agrohortícolas tales como Etion, Triclorfon, Metamidofos, Acefato, Diclorvos, Mevinfos, Monocrotofos, Malation, Dimetoato, Formotion, Mecarbam, Vamidotion, Tiometon, Disulfoton, Oxideprofos, Naled, Hetilparation, Fenitroton, Cianofos, Propafos, Fention, Protiofos, Profenofos, Isofenfos, Temefos, Fentoato, Dimetilvinfos, Clorfenvinfos, Tetraclorvinfos, Foxim, Isoxation, Piraclfos, Metidation, Clorpirifos,

Clorpirifos-metilo, Piridafention, Diazinona, Pirimifosmetilo, Fosadona, Fosmet, Dioxabenzofos, Quinalfos, Terbufos, Etoprofos, Cadusafos, Mesulfenfos, Espirodiclofeno, Metaflumizona, Flubendiamida, DPS (NK-0795), Fosfocarb, Fenamifos, Isoamidofos, Fostiazato, Isazofos, Etoprofos, Fention, Fostietano, Diclofention, Tionazina, Sulprofos, Fensulfotion, Diamidafos; Piretrina, Alettrina, Praletrina, Resmetrina, Permetrina, Teflutrina, Bifentrina, Fenpropatrina, Cipermetrina, α -Cipermetrina, Cihalotrina, X-Cihalotrina, Deltametrina, Acrinatrina, Fenvalerato, Esfenvalerato, Cicloprotrina, Etofenprox, Halfenprox, Silafluofeno, Flucitrinato, Fluvalinato, Metomilo, Oxamilo, Tiodicarb, Aldicarb, Alanicarb, Cartap, Metolcarb, Xililcarb, Propoxur, Fenoxicarb, Fenobucarb, Etiofencarb, Fenotiocarb, Bifenazato, BPMC, Carbarilo, Pirimicarb, Carbofurano, Carbosulfano, Furatiocarb, Benfuracarb, Aldoxicarb, Diafentiurona, Diflubenzurona, Teflubenzurona, Hexaflumurona, Novalurona, Lufenurona, Flufenoxurona, Clorfluazurona, Óxido de fenbutatina, Hidróxido de triciclohexilestaño, Oleato de sodio, Oleato de potasio, Metopreno, Hidropreno, Binapacril, Amitraz, Dicofol, Kerseno, Clorobencilato, Bromopropilato, Tetradifon, Bensultap, Benzoximato, Tebufenozida, Metoxifenozida, Piridalilo, Cromafenozida, Propargita, Acequinosilo, Endosulfano, Diofenolano, Clorfenapilo, Fenpiroximato, Tolfenpirad, Fipronil, Tebufenpirad, Triazamato, Etoxazol, Hexitiazox, Sulfato de nicotina, Nitenpiram, Acetamiprida, Tiacloprida, Imidacloprida, Tiametoxam, Clotianidina, Dinotefurano, Fluazinam, Piriproxifeno, Hidrametilnona, Pirimidifeno, Piridabeno, Cromazina, TPIC (isocianurato de tripropilo), Pimetozina, Clofentezila, Buprofedina, Tiociclam, Fenazaquina, Quinometionato, Indoxacarb, complejos de polinactina, Milbemectina, Abamectina, Benzoato de emamectina, Espinosad, BT (*Bacillus thuringiensis*), Azadiractina, Rotenona, Hidroxipropilalmidón, Clorhidrato de levamisol, Metam-sodio, Tartrato de morantel, Dazomet, Triclamida, *Pasteuria penetrans*, *Monacrosporium-phymatophagum*, etc.

Como los fungicidas agrohortícolas usados para el mismo fin anterior, se pueden ejemplificar fungicidas agrohortícolas tales como Azufre, sulfuro de cal, Sulfato de cobre básico, Iprobenfos, Edifenfos, Tolclofos-metilo, Tiram, Policarbamato, Zineb, Maneb, Mancozeb, Propineb, Tiofanato, Tiofanato metilo, Benomil, Acetato de iminocadina, Albecilato de iminocadina, Mepronil, Flutolanil, Pencicurona, Furametpil, Tifluzamida, Metalaxilo, Oxadixilo, Carpropamida, Diclofluanida, Flusulfamida, Clorotalonil, Kresoxim-metilo, Fenoxanil, Himexazol, Etridiazol, Fluoroimida, Procimidona, Vinclozolan, Iprodiona, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizol, Ipconazol, Fluconazol, Propiconazol, Difenconazol, Miclobutanilo, Tetraconazol, Hexaconazol, Tebuconazol, Tiadinilo, Imibenconazol, Procloraz, Pefurazoato, Ciproconazol, Isoprotilano, Fenarimol, Pirimetanil, Mepanipirim, Pirifenox, Fluazinam, Triforina, Diclomezina, Azoxistrobina, Thiadiazina, Captan, Probenazol, Acibenzolar-S-metilo, Ftalida, Triciclazol, Piroquilon, Quinometionat, Ácido oxolínico, Ditianona, Kasugamicina, Validamicina, Polioxina, Blastidina, Estreptomocina, etc.

De modo similar, como los herbicidas, se pueden ejemplificar herbicidas tales como Glifosato, Sulfosato, Glifosinato, Bialafos, Butamifos, Esprocarb, Prosulcarb, Bentiocarb, Piributicarb, Asulam, Linuron, Dimron, Isouron, Bensulfuron metilo, Ciclosulfamuron, Cinosulfuron, Pirazosulfuron etilo, Azimsulfuron, Imazosulfuron, Tenilclor, Alaclor, Pretilaclor, Clomeprop, Etobenzanida, Mefenacet, Pendimetalina, Bifenox, Acifluorfen, Lactfeno, Cihalofop-butilo, Ioxinilo, Bromobutide, Aloxidim, Setoxidim; Napropamida, Indanofan, Pirazolato, Benzofenap, Piraflufen-etilo, Imazapilo, Sulfentrazona, Cafenstrol, Bentoxazona, Oxadiazona, Paraquat, Diquat, Piriminobac, Simazina, Atrazin, Dimetametrina, Triaziflam, Benflesato, Flutiacet-metilo, Quizalofop-etilo, Bentazona, Peróxido de calcio, etc.

Con respecto a los plaguicidas bióticos, se puede esperar el mismo efecto que el indicado más arriba usando el agente agrohortícola de la presente invención mezclado con, por ejemplo, formulaciones virales obtenidas del virus de polihedrosis viral (NPV), virus de la granulosis (GV), virus de la polihedrosis citoplasmática (CPV), virus entomopox (EPV), etc.; plaguicidas microbianos utilizados como insecticidas o nematocidas, tales como *Monacrosporium phymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai*, *Pasteuria penetrans*, etc.; plaguicidas microbianos utilizados como fungicidas, tales como *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, no patógenos *Erwinia carotovora*, *Bacillus subtilis*, etc.; y plaguicidas bióticos utilizados como herbicidas, tales como *Xanthomonas campestris*, etc.

Además, el agente agrohortícola de la presente invención se puede usar en combinación con plaguicidas bióticos incluyendo enemigos naturales, tales como la avispa parasitoide (*Encarsia formosa*), avispa parásita de pulgones (*Aphidius colemani*), mosquito cecidómido (*Aphidoletes aphidimyza*), avispa parasitoide de orugas (*Diglyphus isaea*), avispa parasitoide del minador de hojas (*Dacnusa sibirica*), ácaro depredador (*Phytoseiulus persimilis*), ácaro depredador (*Amblyseius cucumeris*), escarabajo depredador (*Orius sauteri*), etc.; plaguicidas microbianos tales como *Beauveria brongniartii*, etc.; y feromonas tales como acetato de (Z)-10-tetradecenilo, acetato de (E,Z)-4,10-tetradecadienilo, acetato de (Z)-8-dodecenilo, acetato de (Z)-11-tetradecenilo, (Z)-13-icosen-10-ona, 14-metil-1-octadeceno, etc.

Ejemplos

Los derivados sustituidos de pirazolcarboxanilida representados por la fórmula (I) y el derivado sustituido de anilina representados por la fórmula (II) y el ácido pirazolcarboxílico sustituido representado por la fórmula (IV), que por ello son intermedarios, se explican a continuación haciendo referencia a los Ejemplos, que no se construyen como limitativos.

Ejemplo 1 Producción de ácido 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (compuesto N.º 4-1)

5 El 4-Yodo-1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol (8,7 g, 30 mmol) se disolvió en tetrahidrofurano (87 ml) y se añadió una solución (1,6 M, 28 ml) de n-butil-litio en hexano lentamente bajo una atmósfera de argón con enfriamiento con hielo seco-acetona (no superior a -60 °C). Después de agitación a -70 °C durante 30 min, la mezcla se calentó de forma gradual hasta temperatura ambiente mientras se insuflaba en dióxido de carbono. La mezcla de reacción se vertió en agua, la capa orgánica se eliminó y la capa acuosa se acidificó con ácido clorhídrico. La capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. Los cristales crudos obtenidos se lavaron con hexano para dar el compuesto deseado (4,67 g) en forma de cristales.

10 Rendimiento 74%.

Propiedad: punto de fusión 124 - 125,5 °C

Ejemplo 2 Producción de N-(3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil)-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-211)

15 El ácido 1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxílico (2,09 g, 10 mmol) se disolvió en cloruro de tionilo y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 hr. La mezcla se concentró a presión reducida para dar cloruro de 1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carbonilo. Esto se añadió a una solución de 3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (3,29 g, 10 mmol) y trietilamina (3,03 g, 30 mmol) en tetrahidrofurano (30 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 2 hr. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio. Después de concentrar a presión reducida, el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:1) para dar el compuesto deseado (3,64 g) en forma de cristales.

20

Rendimiento 70%.

Propiedad: punto de fusión 138-139 °C

25 Ejemplo 3 Producción de N-metoximetil-N-(3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil)-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-222)

30 El hidruro de sodio (32 mg, 60%, 0,8 mmol) se suspendió en tetrahidrofurano (10 ml) y se añadió una solución de N-(3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil)-1,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-4-carboxamida (250 mg, 0,48 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) gota a gota. Después de agitación a temperatura ambiente durante 30 min, se añadió una solución de éter clorometilmetílico (64 mg, 0,8 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) y la mezcla se agitó durante 5 hr. La mezcla de reacción se vertió en ácido clorhídrico diluido y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 2:1) para dar el compuesto deseado (238 mg).

35 Rendimiento: 88%

Propiedad: n_D 1,4669 (22,4 °C)

Ejemplo 4 Producción de 2-metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto N.º 31)

40 5-n-Propil-2-metil-anilina (14,9 g, 0,1 mol) se diluyó en un solvente mixto (300 ml) de éter terc-butilmetílico-agua (1:1) y se añadieron sucesivamente yoduro de heptafluoroisopropilo (29,6 g, 0,1 mol), hidrógeno-sulfato de tetrabutilamonio (3,4 g, 0,01 mol), hidrógeno-carbonato de sodio (9,4 g, 0,1 mol) y ditionito de sodio (17,30 g, 0,1 mol). La mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó en hexano, se lavó dos veces con ácido clorhídrico 3 N y se lavó con hidrógeno-carbonato de sodio acuoso y salmuera saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (hexano:acetato de etilo 5:1) para dar el compuesto deseado (28,5 g).

45 Rendimiento: 90%

Propiedad: $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor δ (ppm)] 7,09 (s, 1H), 6,54 (s, 1H), 3,76 (bs, 2H) 2,63 (m, 2H), 2,13 (s, 3H), 1,58 (m, 2H), 0,96 (t, 3H).

Ejemplo 5 Producción de 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propil-anilina (compuesto N.º 3-3)

50 2-Metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-trifluorometil]etil]anilina (1,6 g, 5 mmol) se disolvió en una solución al 28% (9,6 g) de metóxido de sodio en metanol y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 hr. Después de dejar enfriar, la mezcla de reacción se vertió en agua helada y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en

columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 5:1) para dar el compuesto deseado (1,31 g).

Rendimiento: 79%

Propiedad: $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor δ (ppm)] 7,10 (s, 1H), 6,66 (s, 1H), 3,72 (bs, 2H), 3,42 (s, 3H), 2,84 (m, 2H), 2,14 (s, 3H), 1,61 (m, 2H), 1,00 (t, 3H)

5 Ejemplo 6 Producción de 2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (compuesto N.º 3-2)

2-Metil-5-n-propil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (1,6 g, 5 mmol) se disolvió en dimetilsulfóxido (20 ml), se añadió borhidruro de sodio (378 mg, 10 mmol) en pequeñas porciones y la mezcla se agitó a 60 °C durante 5 hr. Se añadió hielo a la mezcla de reacción en pequeñas porciones y luego se añadió ácido acético gota a gota. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y la capa orgánica se lavó 4 veces con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida para dar el compuesto deseado (1,47 g).

Rendimiento: 99%

Propiedad: $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor δ (ppm)] 7,18 (s, 1H), 6,54 (s, 1H), 4,45-4,20 (br, 2H), 4,27 (m, 1H), 2,50 (dd, 2H), 2,14 (s, 3H), 1,57 (m, 2H), 0,98 (t, 3H)

15 Ejemplo 7 Producción de N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 2-15)

Cloruro de 1,3,5-trimetilpirazol-4-carbonilo (172 mg, 1 mmol), 4-(1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil)-2-metil-5-n-propilfenil (329 mg, 1 mmol) y trietilamina (303 mg, 3 mmol) se disolvieron en tetrahidrofurano (10 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 hr. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. El residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:2) para dar el compuesto deseado (360 mg).

Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 132-134 °C

25 Ejemplo 8 Producción de N-acetil-N-{4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 2-16)

Hidruro de sodio (32 mg, 60%, 0,8 mmol) se suspendió en tetrahidrofurano (10 ml) y se añadió una solución de N-{4-(1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil)-2-metil-5-n-propilfenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (250 mg, 0,53 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) gota a gota. Después de agitación a temperatura ambiente durante 30 min, se añadió una solución de anhídrido acético (80 mg, 0,78 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) y la mezcla se agitó durante un día. La mezcla de reacción se vertió en ácido clorhídrico diluido y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:3) para dar el compuesto deseado (139 mg).

Rendimiento: 52%

Propiedad: n_D 1,4905 (25,9 °C)

Ejemplo 9 Producción de N-{2-metil-5-n-propil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 2-13)

40 De la misma manera que en el Ejemplo 7 excepto porque se usó 2-metil-5-n-propil-4-(2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil)anilina en lugar de 4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]-2-metil-5-n-propilfenil, la reacción se lleva a cabo durante 3 hr para dar el compuesto deseado.

Rendimiento: 66%

45 Propiedad: punto de fusión 128-131 °C

Ejemplo 10 Producción de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-155)

Cloruro de 1,3,5-trimetilpirazol-4-carbonilo (3,93 g, 22,8 mmol),

3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (5,0 g, 15,2 mmol) y trietilamina (3,07 g, 30,4 mmol) se disolvieron en tetrahidrofurano (100 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 5 hr. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. Los cristales crudos obtenidos se lavaron con éter para dar el compuesto deseado (5,62 g).

5 Rendimiento: 80%

Propiedad: punto de fusión 189-190 °C

Ejemplo 11 Producción de N-etoximetil-N-(3-isobutil-4-(1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil)fenil)-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-145)

10 El hidruro de sodio (29 mg, 60%, 0,73 mmol) se suspendió en tetrahidrofurano (10 ml) y se añadió una solución de N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (260 mg, 0,48 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) gota a gota. Después de agitación a temperatura ambiente durante 30 min, se añadió una solución de éter clorometilético (70 mg, 0,73 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) y la mezcla se agitó durante un día. La mezcla de reacción se vertió en ácido clorhídrico diluido y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:3) para dar el compuesto deseado (200 mg).

Rendimiento: 69%

Propiedad: n_D 1,4892 (22,4 °C)

20 Ejemplo 12 Producción de N-isobutiloxicarbonil-N-(3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil)-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-152)

25 El hidruro de sodio (29 mg, 60%, 0,73 mmol) se suspendió en tetrahidrofurano (10 ml) y se añadió una solución de N-{3-isobutil-4-(1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil)fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (260 mg, 0,48 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) gota a gota. Después de agitación a temperatura ambiente durante 30 min, se añadió una solución de clorocarbonato de isobutilo (100 mg, 0,73 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) y la mezcla se agitó durante un día. La mezcla de reacción se vertió en ácido clorhídrico diluido y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:1) para dar el compuesto deseado (280 mg).

Rendimiento: 91%

Propiedad: n_D 1,4829 (22,3 °C)

Ejemplo 13 Producción de N-((3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil)-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-123)

35 Cloruro de 1,3,5-trimetilpirazol-4-carbonilo (2,09 g, 10,0 mmol), 3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]anilina (2,0 g, 6,69 mmol) y trietilamina (1,35 g, 13,4 mmol) se disolvieron en tetrahidrofurano (60 ml) y la mezcla se calentó a reflujo durante 5 hr. La mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:3) para dar el compuesto deseado (2,41 g).

40 Rendimiento: 77%

Propiedad: punto de fusión 148-151 °C

Ejemplo 14 Producción de N-acetil-N-(3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil)-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (compuesto N.º 1-125)

45 El hidruro de sodio (38 mg, 60%, 0,96 mmol) se suspendió en tetrahidrofurano (10 ml) y se añadió una solución de N-{3-isobutil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}-1,3,5-trimetilpirazol-4-carboxamida (300 mg, 0,64 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) gota a gota. Después de agitación a temperatura ambiente durante 30 min, se añadió una solución de cloruro de acetilo (75 mg, 0,96 mmol) en tetrahidrofurano (2 ml) y la mezcla se agitó durante un día. La mezcla de reacción se vertió en ácido clorhídrico diluido y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida y el residuo obtenido se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice (hexano:acetato de etilo = 1:3) para dar el compuesto deseado (90 mg).

Rendimiento: 28%

Propiedad: n_D 1,5021 (22,5 °C)

Producción del Ejemplo de referencia de 1 4-yodo-1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol

5 El yodo (30 g) se disolvió en ácido sulfúrico al 60% (fumante, 80 g) y se añadió 1,3-dimetil-5-trifluorometilpirazol (13,12 g, 80 mmol) lentamente bajo enfriamiento con hielo. La mezcla se agitó a 0 °C durante 2 hr. La mezcla de reacción se vertió en agua helada y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con tiosulfato de sodio acuoso y salmuera saturada, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. Los cristales crudos obtenidos se lavaron con hexano para dar el compuesto deseado (20 g) en forma de cristales.

Rendimiento 86%

Propiedad: $^1\text{H-RMN}$ [CDCl_3/TMS , valor δ (ppm)] 3,98 (s, 3H), 2,26 (s, 3H)

10 Típicos ejemplos de formulación y ejemplo de prueba de la presente invención se describen más abajo, pero no se deberían construir como limitativos del alcance de la invención.

Como se usan en los ejemplos, los términos "parte" y "partes" son en peso.

Ejemplo de formulación 1

	Cada compuesto enumerado en la Tabla 1 o la Tabla 2	10 partes
15	Xileno	70 partes
	N-metilpirrolidona	10 partes
	Mezcla de éter polioxietilen-nonilfenílico	10 partes
	y alquilbencensulfonato de calcio	

20 Un concentrado emulsionable se preparó mezclando de modo uniforme los ingredientes anteriores para efectuar la disolución.

Ejemplo de formulación 2

	Cada compuesto enumerado en la Tabla 1 o la Tabla 2	3 partes
	Arcilla en polvo	82 partes
	Tierra de diatomeas en polvo	15 partes

25 Se preparó un polvo mezclando de modo uniforme y moliendo los ingredientes anteriores.

Ejemplo de formulación 3

	Cada compuesto enumerado en la Tabla 1 o la Tabla 2	5 partes
	Polvo mixto de bentonita y arcilla	90 partes
	Ligninsulfonato de calcio	5 partes

30 Se prepararon gránulos mezclando los ingredientes anteriores de modo uniforme y amasando la mezcla resultante junto con una cantidad apropiada de agua, seguido de granulación y secado.

Ejemplo de formulación 4

	Cada compuesto enumerado en la Tabla 1 o la Tabla 2	20 partes
	Mezcla de caolín y ácido silícico sintético en alta dispersión	75 partes

35	Mezcla de éter polioxietilen-nonilfenílico y alquilbencensulfonato de calcio	5 partes
----	--	----------

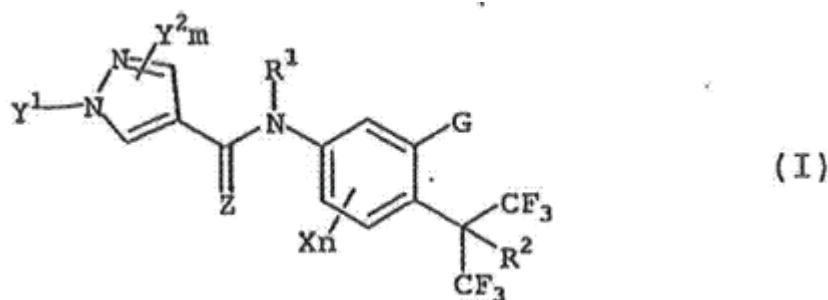
Se preparó un polvo humectable mezclando de modo uniforme y moliendo los ingredientes anteriores.

Ejemplo de prueba 1: Acción acaricida sobre el ácaro de dos puntos (*Tetranychus urticae*)

40 Un disco de una hoja de poroto alubia con un diámetro de 2 cm se colocó sobre el papel de filtro humedecido. Luego se inocularon diez hembras adultas del ácaro de dos puntos en cada disco de hoja, y se rociaron con 50 ml de solución de prueba, preparada diluyendo una formulación con cada compuesto indicado en la Tabla 1 o la Tabla 2 como un

REIVINDICACIONES

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



en donde

- 5 R¹ es 1a) un átomo de hidrógeno, 2a) un grupo alquilo C₁-C₈, 3a) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 4a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilo, 5a) un grupo haloalquil C₁-C₆-carbonilo, 6a) un grupo alquenal C₂-C₆-carbonilo, 7a) un grupo haloalquenal C₂-C₆-carbonilo, 8a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonil-alquilo C₁-C₆, 9a) un grupo cicloalquilo C₃-C₆, 10a) un grupo halocicloalquilo C₃-C₆, 11a) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 12a) un grupo halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 13a) un grupo alquenal C₂-C₆, 14a) un grupo haloalquenal C₂-C₆, 15a) un grupo alquino C₂-C₆, 16a) un grupo haloalquino C₂-C₆, 17a) un grupo alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 19a) un grupo alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 22a) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 23a) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinil-alquilo C₁-C₆, 24a) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, 25a) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonil-alquilo C₁-C₆, 26a) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, 27a) un grupo monoalquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, 28a) un grupo dialquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 29a) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 30a) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 31a) un grupo alcoxi C₁-C₁₆-carbonilo, 32a) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 33a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-carbonilo, 34a) un grupo alquenal C₂-C₆-oxicarbonilo, 35a) un grupo alquil C₁-C₆-tiocarbonilo, 36a) un grupo monoalquilamino C₁-C₆-carbonilo, 37a) un grupo dialquilamino C₁-C₆-carbonilo, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 38a) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonil-alquilo C₁-C₆, 39a) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, 40a) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, 41a) un grupo cianoalquilo C₁-C₆, 42a) un grupo fenilalquilo C₁-C₆, 43a) un grupo fenilalquilo C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 44a) un grupo fenilcarbonilo, 45a) un grupo fenilcarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 46a) un grupo heterociclicarbonilo, 47a) un grupo heterociclicarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 48a) un grupo fenoxicarbonilo, 49a) un grupo fenoxicarbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 50a) un grupo fenoxialquil C₁-C₆-carbonilo, 51a) un grupo fenoxialquil C₁-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo

uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 36b) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ o 37b) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo;

G es 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀, 2c) un grupo haloalquilo C₂-C₁₀, 3c) un grupo alqueno C₃-C₁₀, 4c) un grupo haloalqueno C₃-C₁₀, 5c) un grupo alquino C₃-C₁₀, 6c) un grupo haloalquino C₃-C₁₀, 7c) un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀, 8c) un grupo cicloalquilo C₃-C₁₀ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo alquilo C₁-C₆ y c) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 9c) un grupo cicloalqueno C₃-C₁₀, 10c) un grupo cicloalqueno C₃-C₁₀ sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes, seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo alquilo C₁-C₄ y c) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 11c) un grupo cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ o 12c) un grupo halocicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆;

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

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

Y¹ es 1e) un átomo de hidrógeno, 2e) un grupo alquilo C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 4e) un grupo alqueno C₂-C₆, 5e) un grupo haloalqueno C₂-C₆, 6e) un grupo alquino C₂-C₆, 7e) un grupo haloalquino C₂-C₆, 8e) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 9e) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, 10e) un grupo alquil C₁-C₆-carboniloxialquilo C₁-C₆, 11e) un grupo cicloalquilo C₃-C₆, 12e) un grupo halocicloalquilo C₃-C₆, 13e) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 14e) un grupo halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 15e) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, 16e) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, 17e) un grupo alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 18e) un grupo haloalquil C₁-C₆-tioalquilo C₁-C₆, 19e) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, 20e) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, 21e) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, 22e) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, 23e) un grupo monoalquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, 24e) un grupo dialquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 25e) un grupo fenilo, 26e) un grupo fenilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo;

Y² puede ser igual o diferente y es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo de halógeno, 3f) un grupo ciano, 4f) un grupo nitro, 5f) un grupo hidroxilo, 6f) un grupo mercapto, 7f) un grupo amino, 8f) un grupo carboxilo, 9f) un grupo alquilo C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo C₁-C₆, 11f) un grupo alqueno C₂-C₆, 12f) un grupo haloalqueno C₂-C₆, 13f) un grupo alquino C₂-C₆, 14f) un grupo haloalquino C₂-C₆, 15f) un grupo trialquil C₁-C₆-sililalquino C₂-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 16f) un grupo fenilalquino C₂-C₆, 17f) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 18f) un grupo hidroxialquilo C₁-C₆, 19f) un grupo alquil C₁-C₆-carboniloxialquilo C₁-C₆, 20f) un grupo cicloalquilo C₃-C₆, 21f) un grupo halocicloalquilo C₃-C₆, 22f) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 23f) un grupo halocicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, 24f) un grupo alcoxi C₁-C₆, 25f) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, 26f) un grupo alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, 27f) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, 28f) un grupo fenilalcoxi C₁-C₆, 29f) un grupo alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 30f) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 31f) un grupo alquil C₁-C₆-tio, 32f) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, 33f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, 31f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, 35f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, 36f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, 37f) un grupo alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 38f) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, 39f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, 40f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, 41f) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, 42f) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, 43f) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, 44f) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 45f) un grupo fenilamino, 46f) un grupo monoalquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, 47f) un grupo dialquil C₁-C₆-aminoalquilo C₁-C₆, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 48f) un grupo fenilo, 49f) un grupo fenilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 50f) un grupo fenoxi, 51f) un grupo fenoxi sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo

- alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 58a) un grupo dialquil C₁-C₆-aminotio, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes, 59a) un grupo cicloalquil C₃-C₆-carbonilo, 61a) un grupo alquil C₁-C₆-cicloalquil C₃-C₆-carbonilo, 63a) un grupo fenilalquil C₁-C₆-carbonilo, 64a) un grupo fenilalquil C₁-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfirilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 65a) un grupo fenilcicloalquil C₃-C₆-carbonilo, 66a) un grupo fenilcicloalquil C₃-C₆-carbonilo sustituido que tiene, en el anillo, uno o varios sustituyentes, iguales o diferentes seleccionados de a) un átomo de halógeno, b) un grupo ciano, c) un grupo nitro, d) un grupo alquilo C₁-C₆, e) un grupo haloalquilo C₁-C₆, f) un grupo alcoxi C₁-C₆, g) un grupo haloalcoxi C₁-C₆, h) un grupo alquil C₁-C₆-tio, i) un grupo haloalquil C₁-C₆-tio, j) un grupo alquil C₁-C₆-sulfinilo, k) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, l) un grupo alquil C₁-C₆-sulfonilo, m) un grupo haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, n) un grupo monoalquil C₁-C₆-amino, o) un grupo dialquil C₁-C₆-amino, en donde los grupos alquilo son iguales o diferentes y p) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilo, 68a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilo, 73a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilalquil C₁-C₆-carbonilo o 74a) un grupo alcoxi C₁-C₆-carbonilalquil C₁-C₆-carbonilo o una de sus sales.
3. El derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en donde R² es 1b) un átomo de hidrógeno, 2b) un átomo de halógeno, 6b) un grupo hidroxilo, 7b) un grupo alcoxi C₁-C₆ o 8b) un grupo haloalcoxi C₁-C₆ o una de sus sales.
4. El derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde G es 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀, 3c) un grupo alqueno C₃-C₁₀ u 11c) un grupo cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆ o una de sus sales.
5. El derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde X es 1d) un átomo de hidrógeno, 2d) un átomo de halógeno o 5d) un grupo alquilo C₁-C₆ o una de sus sales.
6. El derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en donde Z es un átomo de oxígeno;
- Y¹ es 2e) un grupo alquilo C₁-C₆, 3e) un grupo haloalquilo C₁-C₆ o 4e) un grupo alqueno C₂-C₆; e
- Y² es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo de halógeno, 9f) un grupo alquilo C₁-C₆, 10f) un grupo haloalquilo C₁-C₆ o 31f) un grupo alquil C₁-C₆-tio o una de sus sales.
7. El derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R¹ es 1a) un átomo de hidrógeno, 4a) un grupo alquil C₁-C₆-carbonilo, 5a) un grupo haloalquil C₁-C₆-carbonilo, 17a) un grupo alcoxi C₁-C₁₀-alquilo C₁-C₆, 18a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, 31a) un grupo alcoxi C₁-C₁₆-carbonilo, 33a) un grupo haloalcoxi C₁-C₆-carbonilo o 68a) un grupo alcoxi C₂-C₆-alquil C₁-C₆-carbonilo;
- R² es 1b) un átomo de hidrógeno o 7b) un grupo alcoxi C₁-C₆;
- G es 1c) un grupo alquilo C₂-C₁₀;
- Z es un átomo de oxígeno;
- X es 1d) un átomo de hidrógeno;
- Y¹ es 2e) un grupo alquilo C₁-C₆; e
- Y² puede ser igual o diferente y es 1f) un átomo de hidrógeno, 2f) un átomo de halógeno, 9f) un grupo alquilo C₁-C₆ o 10f) un grupo haloalquilo C₁-C₆,
- o una de sus sales.
8. Un agente agrohortícola que comprende un derivado sustituido de pirazolcarboxanilida de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 o una de sus sales como un ingrediente activo.
9. El agente agrohortícola de acuerdo con la reivindicación 8, que es un insecticida o acaricida agrohortícola.
10. Un método de usando un agente agrohortícola, que comprende el tratamiento de una planta o suelo objeto con una

cantidad efectiva de un agente agrohortícola de acuerdo con la reivindicación 8 ó 9 para controlar los organismos nocivos de las plantas útiles.