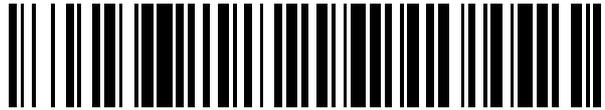


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 444 223**

51 Int. Cl.:

C07D 207/18 (2006.01)
C07D 231/06 (2006.01)
C07D 261/04 (2006.01)
C07D 263/08 (2006.01)
C07D 277/08 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
A01N 35/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.02.2010 E 10721058 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **25.12.2013 EP 2393777**

54 Título: **Compuesto de hidrazida y uso del mismo en el control de plagas**

30 Prioridad:

06.02.2009 JP 2009025839

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

24.02.2014

73 Titular/es:

**SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)
27-1, Shinkawa 2-chome Chuo-ku
Tokyo 104-8260, JP**

72 Inventor/es:

**IHARA, HIDEKI y
KUMAMOTO, KOJI**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 444 223 T3

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

DESCRIPCIÓN

Compuesto de hidrazida y uso del mismo en el control de plagas

5 Campo técnico

La presente invención se refiere a un compuesto de hidrazida y al uso del mismo en el control de plagas.

Técnica antecedente

10 Hasta ahora, se han descubierto y desarrollado compuestos que tienen actividad de control sobre plagas como ingredientes activos de composición para el control de plagas.

15 Se conoce un determinado compuesto de amida como un ingrediente activo de una composición para el control de plagas (véase, documento JP-A 2008-266293).

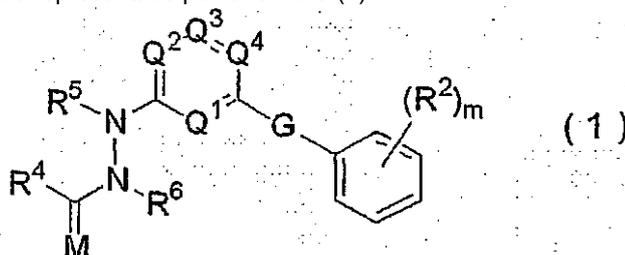
Sumario de la invención

20 Un objeto de la presente invención es proporcionar un nuevo compuesto que tenga actividad de control sobre plagas.

Los presentes inventores estudiaron intensamente para hallar un compuesto con actividad de control de plagas y, como resultado, hallaron que un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1) mostrado más abajo tiene actividad en el control de plagas. Por consiguiente, se ha completado la presente invención.

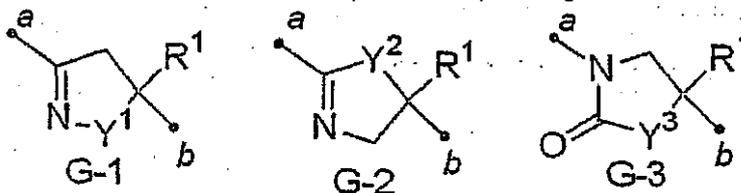
25 La presente invención proporciona:

[1] Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1):

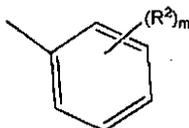


donde,

30 G representa un grupo heterocíclico de 5 miembros representado por la siguiente fórmula G-1, G-2 o G-3:



donde cada uno de a — y b — representan un enlace y el b — está unido al resto



35 en la fórmula (1),
 R^1 representa un grupo haloalquilo C1-C4,
 Y^1 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR^7 ,
 Y^2 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR^7 o un grupo metileno,
 Y^3 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR^7 o un grupo metileno,
 R^7 representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquenilo C2-C6, un grupo alquinilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo cicloalquilalquilo C4-C7, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, un grupo alquilamionocarbonilo C2-C6, un grupo dialquilamionocarbonilo C3-C9, un grupo fenilo, un grupo ciano, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, M representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,
 Q^1, Q^2, Q^3 y Q^4 representan independientemente un átomo de nitrógeno o un grupo CR^3 ,
45

R³ representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo nitro, un grupo ciano, un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, m representa un número entero de 0 a 5,

R² representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfinilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo nitro, un grupo ciano o un átomo de halógeno,

con la condición de que cuando m sea un número entero de 2 a 5, los R² puedan ser iguales o diferentes entre sí, R⁵ y R⁶ representen independientemente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo benzoílo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C12, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, R⁴ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo OR⁸, un grupo N(R⁹)R¹⁰ o un átomo de hidrógeno,

R⁸ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, o un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2,

R⁹ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, o un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, R¹⁰ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, o un átomo de hidrógeno, o

R⁹ y R¹⁰ se combinan en sus extremos para representar un grupo alcanodiílo C2-C9,

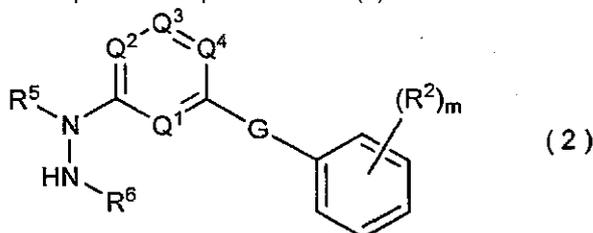
El Grupo E1 consiste en un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenilamino opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno, y

El Grupo E2 consiste en un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención);

[2] Un control para plagas que comprende el compuesto de hidrazida de acuerdo con el apartado [1] como ingrediente activo;

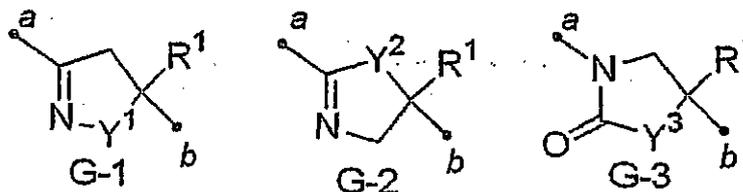
[3] Un método para controlar una plaga que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto de hidrazida de acuerdo con el apartado [1] a la plaga o al hábitat de la plaga; y

[4] Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (2):

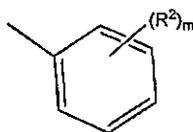


donde,

G representa un grupo heterocíclico de 5 miembros representado por la siguiente fórmula G-1, G-2 o G-3:



donde cada uno de ^a — y ^b — representa un enlace y el ^b — está enlazado al resto



en la fórmula (1),

R¹ representa un grupo haloalquilo C1-C4,

5 Y¹ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR⁷,

Y² representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR⁷ o un grupo metileno,

Y³ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR⁷ o un grupo metileno,

10 R⁷ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo alqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo cicloalquilalquilo C4-C7, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C6, un grupo dialquilaminocarbonilo C3-C9, un grupo fenilo, un grupo ciano, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ representan independientemente un átomo de nitrógeno o un grupo CR³,

15 R³ representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo nitro, un grupo ciano, un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, m representa un número entero de 0 a 5,

R² representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquilsulfinilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo nitro, un grupo ciano o un átomo de halógeno,

20 con la condición de que cuando m sea un número entero de 2 a 5, los R² puedan ser iguales o diferentes entre sí, R⁵ y R⁶ representen independientemente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo

25 Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C12, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, El Grupo E1 consiste en un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenilamino opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno, y

30 El Grupo E2 consiste en un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno.

35 El compuesto de la presente invención tiene actividad de control sobre plagas y por lo tanto es útil como ingrediente activo de una composición para el control de plagas.

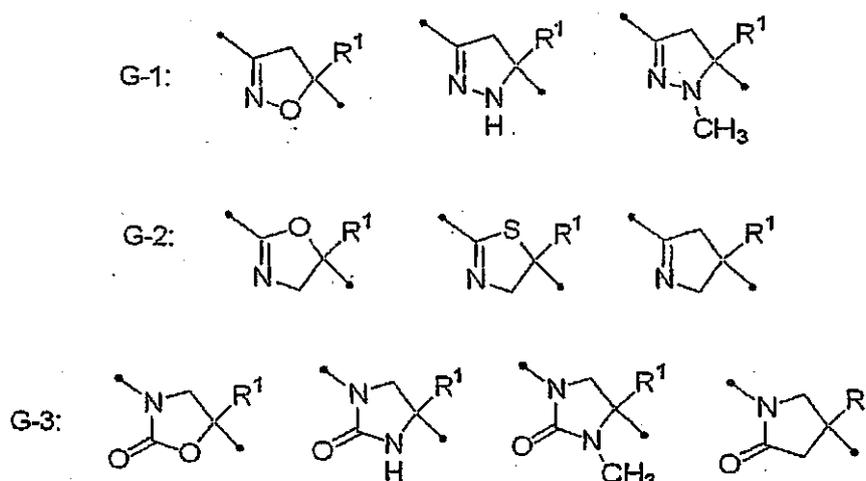
Modo para realizar la Invención

40 Como se usa en el presente documento, el átomo de halógeno significa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.

45 Como se usa en el presente documento, por ejemplo, la expresión "C2-C6" de un grupo "alquilaminocarbonilo C2-C6" significa que el número total de átomos de carbono que constituyen el grupo alquilaminocarbonilo están dentro del intervalo de 2 a 6.

Como se usa en el presente documento, se muestran a continuación ejemplos de cada uno de los sustituyentes.

50 Los ejemplos del grupo heterocíclico de 5 miembros 5 representado por la fórmula G-1, G-2 o G-3 incluyen los siguientes grupos heterocíclicos de 5 miembros.



Como se usa en el presente documento, los ejemplos del "grupo haloalquilo C1-C4" incluyen un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorofluorometilo, un grupo bromofluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 1,1-difluoroetilo, un grupo 1,1,2,2,2-pentafluoroetilo, un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropilo, y un grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo.

Los ejemplos del "grupo alquilo C1-C6" incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo *sec*-butilo, un grupo *terc*-butilo, un grupo pentilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo 3-metilbutilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1,1-dimetilpropilo, un grupo 1,2-dimetilpropilo, un grupo 2,2-dimetilpropilo, un grupo hexilo, un grupo 1-metilpentilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 1,1-dimetilbutilo, y un grupo 1,3-dimetilbutilo.

Los ejemplos del "grupo alqueno C2-C6" incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, y un grupo 5-hexenilo.

Los ejemplos del "grupo alquino C2-C6" incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 2-hexinilo, un grupo 3-hexinilo, un grupo 4-hexinilo, y un grupo 5-hexinilo.

Los ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-C6" incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dimetilciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo 1-metilciclopentilo, un grupo 2-metilciclopentilo, un grupo 3-metilciclopentilo, y un grupo ciclohexilo.

Los ejemplos del "grupo cicloalquilalquilo C4-C7" incluyen un grupo ciclopropilmetilo, un grupo 1-ciclopropiletilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo ciclobutilmetilo, un grupo ciclopentilmetilo, y un grupo ciclohexilmetilo.

Los ejemplos del "grupo alquilcarbonilo C2-C6" incluyen un grupo acetilo, un grupo propionilo, un grupo butiroilo, un grupo isobutiroilo, y un grupo pivaloilo.

Los ejemplos del "grupo alcoxicarbonilo C2-C6" incluyen un grupo metoxicarbonilo, un grupo etoxicarbonilo, un grupo isopropiloxicarbonilo, un grupo butiloxicarbonilo, un grupo *terc*-butiloxicarbonilo, y un grupo pentiloxicarbonilo.

Los ejemplos del "grupo alquilaminocarbonilo C2-C6" incluyen un grupo N-metilaminocarbonilo, un grupo N-etilaminocarbonilo, un grupo N-propilaminocarbonilo, un grupo N-butilaminocarbonilo, y un grupo N-pentilaminocarbonilo.

Los ejemplos del "grupo dialquilaminocarbonilo C3-C9" incluyen un grupo N,N-dimetilaminocarbonilo, y un grupo N,N-diethylaminocarbonilo.

Los ejemplos del "grupo alcoxi C1-C6" incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo *sec*-butoxi, un grupo *terc*-butoxi, un grupo pentiloxi, y un grupo hexiloxi.

Los ejemplos del "grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado" incluyen grupos alquilo C1-C6, tales como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo *sec*-butilo, un grupo *terc*-butilo, un grupo pentilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo 3-metilbutilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1,1-dimetilpropilo, un grupo 1,2-dimetilpropilo, un grupo 2,2-dimetilpropilo, un grupo 5 hexilo, un grupo 1-metilpentilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 1,1-dimetilbutilo, y un grupo 1,3-dimetilbutilo; y grupos haloalquilo C1-C6, tal como un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorofluorometilo, un grupo bromofluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo 1-fluoroetilo, un grupo 1,1-difluoroetilo, un grupo 1,1,2,2-pentafluoroetilo, un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropilo y un grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo.

Los ejemplos del "grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado" incluyen grupos alcoxi C1-C6, tales como un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo *sec*-butoxi, un grupo *terc*-butoxi, un grupo pentiloxi, y un grupo hexiloxi; y grupos haloalcoxi C1-C6, tales como un grupo difluorometoxi, un grupo clorofluorometoxi, un grupo clorodifluorometoxi, un grupo bromodifluorometoxi, un grupo 2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, un grupo 2-cloro-1,1,2-trifluoroetoxi, un grupo 2-bromo-1,1,2-trifluoroetoxi, un grupo 1,1,2,2-pentafluoroetoxi, un grupo 2,2-dicloro-1,1,2-trifluoroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloro-1,1-difluoroetoxi, un grupo 2-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, un grupo 2,2,3,3-tetrafluoropropiloxi, un grupo 1,1,2,3,3,3-hexafluoropropiloxi, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etoxi, un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropiloxi y un grupo 2-bromo-1,1,2,3,3,3-hexafluoropropiloxi.

Los ejemplos del grupo "alquiltio C1-C6" incluyen un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo butiltio, un grupo pentiltio, y un grupo hexiltio.

Los ejemplos del "grupo alquisulfínico C1-C6" incluyen un grupo metanosulfínico, un grupo etilsulfínico, un grupo propilsulfínico, un grupo isopropilsulfínico, un grupo butilsulfínico, un grupo pentilsulfínico, y un grupo hexilsulfínico.

Los ejemplos del "grupo alquilsulfónico C1-C6" incluyen un grupo metanosulfónico, un grupo etilsulfónico, un grupo propilsulfónico, un grupo isopropilsulfónico, un grupo butilsulfónico, un grupo pentilsulfónico, y un grupo hexilsulfónico.

Los ejemplos del "grupo cicloalquilo C3-C12" incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dimetilciclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrametilciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo 1-metilciclopentilo, un grupo 2-metilciclopentilo, un grupo 3-metilciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo 1-metilciclohexilo, un grupo 2-metilciclohexilo, un grupo 3-metilciclohexilo, un grupo 35 4-metilciclohexilo, un grupo cicloheptilo, y un grupo ciclooctilo.

Los ejemplos del "grupo alcanodiílo C2-C9" incluyen un grupo 1,2-etileno, un grupo 1,4-tetrametileno, y un grupo 1,5-pentametileno.

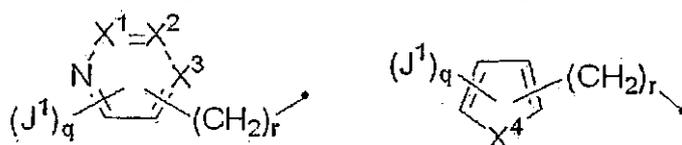
Los ejemplos del grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 como se usan en el presente documento incluyen un grupo alquilo C1-C12, un grupo alqueno C2-C12, y un grupo alquino C2-C12.

Los ejemplos del "grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1" incluyen grupos alquilo C1-C12, tales como un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo *sec*-butilo, un grupo *terc*-butilo, un grupo pentilo, un grupo 1-metilbutilo, un grupo 2-metilbutilo, un grupo 3-metilbutilo, un grupo 1-etilpropilo, un grupo 1,1-dimetilpropilo, un grupo 1,2-dimetilpropilo, un grupo 2,2-dimetilpropilo, un grupo hexilo, un grupo 1-metilpentilo, un grupo 2-metilpentilo, un grupo 1,1-dimetilbutilo, un grupo 1,3-dimetilbutilo, un grupo heptilo, un grupo octilo, un grupo nonilo, un grupo decilo, un grupo undecilo, y un grupo dodecilo; grupos alqueno C2-C12, tal como un grupo vinilo, un grupo 1-metilvinilo, un grupo 1-fenilvinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 3-metil-2-butenilo, un grupo 2-etil-2-propenilo, un grupo 1,1-dimetil-2-propenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 2-metil-2-pentenilo, un grupo 2,4-dimetil-2,6-heptadienilo y un grupo 3,7-dimetil-2,6-octadienilo;

grupos alquino C2-C12, tales como un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 1,1-dimetil-2-propinilo, y un grupo 2-hexinilo;

grupos haloalquilo C1-C12, tales como un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo yodometilo, un grupo difluorometilo, un grupo clorofluorometilo, un grupo bromofluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo diclorofluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo bromodifluorometilo, un grupo bromoclorofluorometilo, un grupo difluoroyodometilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-bromoetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-cloro-2-fluoroetilo, un grupo 2,2-dicloroetilo, un grupo 2-bromo-2-fluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 2-bromo-2,2-difluoroetilo, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 1,1,2,2,2-pentafluoroetilo, un grupo 1-cloro-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-cloro-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 1,2-dicloro-1,2,2-trifluoroetilo, un grupo 1-bromo-1,2,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-bromo-1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2-fluoropropilo, un grupo 2-cloropropilo, un grupo 2,3-dicloropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 3-bromo-3,3-difluoropropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluoropropilo, un grupo

2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo 1,1,2,3,3,3-hexafluoropropilo, un grupo 1,1,2,2,3,3,3-heptafluoropropilo, un grupo 2,3-dicloro-1,1,2,3,3-pentafluoropropilo, un grupo 2-fluoro-1-metiletilo, un grupo 2-cloro-1-metiletilo, un grupo 2-bromo-1-metiletilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etilo, un grupo 1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etilo, y un grupo 1,1,2,2,3,3,4,4,4-nonfluorobutilo; grupos haloalqueno C2-C12, tales como un grupo 2,2-fluorovinilo, un grupo 2,2-diclorovinilo, un grupo 2-fluoro-2-propenilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3-cloro-2-propenilo, un grupo 2-bromo-2-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 2,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 2,3-dibromo-2-propenilo, un grupo 2,3,3-trifluoro-2-propenilo, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propenilo, un grupo 3-cloro-2-butenilo, un grupo 3-bromo-2-butenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-butenilo, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, un grupo 3-cloro-3,4,4-trifluoro-2-butenilo, y un grupo 3-bromo-2-metil-2-propenilo; grupos haloalquino C2-C12, tales como un grupo 3-cloro-2-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, y un grupo 3-yodo-2-propinilo; grupos ciano(alquilo C1-C12), tales como un grupo cianometilo; grupos nitroalquilo C1-C12, tales como un grupo nitrometilo; grupos (dialquilamino C2-C12)-alquilo C1-C12, tales como un grupo *N,N*-dimetilaminometilo; grupos (alquilamino C1-C6)-alquilo C1-C12, tales como un grupo *N*-etilaminometilo; grupos (alcoxi C1-C6)-alquilo C1-C12, tales como metoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 2-propoxietilo, un grupo 2-isopropoxietilo, un grupo 2-butoxietilo, un grupo 2-isobutoxietilo, un grupo 2-(1-metilpropiloxi)etilo, y un grupo 2-(1,1-dimetiletoxi)etilo; grupos (alcoxicarbonil C2-C6)-alquilo C1-C12, tales como un grupo metoxicarbonilmetilo, un grupo etoxicarbonilmetilo, un grupo propoxicarbonilmetilo, un grupo isopropoxicarbonilmetilo, un grupo *tert*-butoxicarbonilmetilo; grupos (alquilcarbonil C2-C6)-alquilo C1-C12, tales como un grupo acetilmetilo y un grupo 2-acetilmetilo; grupos alquilo C1-C12 sustituidos con un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, tales como un grupo fenoximetilo, un grupo 4-clorofenoximetilo, y un grupo fenoxietilo; grupos alquilo C1-C12 sustituidos con un grupo fenilamino opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, tales como un grupo fenilaminometilo, un grupo 4-clorofenilaminometilo, y un grupo fenilaminometilo; grupos alquilo C1-C12 sustituidos con un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, tal como grupos representados por las siguientes fórmulas:



donde la totalidad de X^1 , X^2 y X^3 representa un grupo CH, o uno cualquiera de X^1 , X^2 y X^3 representa un átomo de nitrógeno y los otros dos representan un grupo CH; X^4 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NH; r representa un número entero de 1 a 12; q representa un número entero de 0 a 3; J^1 representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo o un átomo de halógeno; y grupos alquilo C1-C12 sustituidos con un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, tal como un grupo bencilo, un grupo feniletilo, un grupo 4-metilbencilo, un grupo 4-clorobencilo, un grupo 2-(ciclopropil)etilo, y un grupo ciclopropilmetilo.

Los ejemplos del "grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2" incluyen un grupo benzoilo, un grupo 2-fluorobenzoilo, un grupo 3-fluorobenzoilo, un grupo 4-fluorobenzoilo, un grupo 2-clorobenzoilo, un grupo 3-clorobenzoilo, un grupo 4-clorobenzoilo, un grupo 2-metoxibenzoilo, un grupo 3-metoxibenzoilo, un grupo 4-metoxibenzoilo, un grupo 2-cianobenzoilo, un grupo 3-cianobenzoilo, un grupo 4-cianobenzoilo, un grupo 2-nitrobenzoilo, un grupo 3-nitrobenzoilo y un grupo 4-nitrobenzoilo.

Los ejemplos del grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 como se usa en el presente documento incluyen un grupo fenilo, un grupo naftilo y un grupo cicloalquilo C3-C12.

Los ejemplos del "grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo sustituido entre el Grupo E2" incluyen un grupo fenilo;

grupos alquilfenilo, tales como un grupo 2-metilfenilo, un grupo 3-metilfenilo, y un grupo 4-metilfenilo; grupos (haloalquil)fenilo, tales como un grupo 2-(trifluorometil)fenilo, un grupo 3-(trifluorometil)fenilo, un grupo 4-(trifluorometil)fenilo, y un grupo 3,5-bis(trifluorometil)fenilo;

grupos fenilo halogenados, tales como un grupo 2-fluorofenilo, un grupo 3-fluorofenilo, un grupo 4-fluorofenilo, un grupo 2-clorofenilo, un grupo 3-clorofenilo, un grupo 4-clorofenilo, un grupo 2-bromofenilo, un grupo 3-bromofenilo, un grupo 4-bromofenilo, un grupo 2-yodofenilo, un grupo 3-yodofenilo, un grupo 4-yodofenilo, un grupo 2,6-diclorofenilo, un grupo 3,4-diclorofenilo, un grupo 3,5-diclorofenilo, un grupo 2,3,4-triclorofenilo, un grupo 2,3,5-triclorofenilo, un grupo 3,4,5-triclorofenilo, un grupo 2,4,6-triclorofenilo, un grupo 2,3-difluorofenilo, un grupo 2,4-difluorofenilo, un grupo 2,5-difluorofenilo, un grupo 2,6-difluorofenilo, un grupo 3,4-difluorofenilo, un grupo 3,5-difluorofenilo, un grupo 3,4,5-trifluorofenilo, un grupo 2,3,5,6-tetrafluorofenilo, un grupo 2,3,4,5,6-pentafluorofenilo, un grupo 2,3-diclorofenilo, un grupo 2,4-diclorofenilo, y un grupo 2,5-diclorofenilo;

grupos cianofenilo, tales como un grupo 2-cianofenilo, un grupo 3-cianofenilo, y un grupo 4-cianofenilo; grupos nitrofenilo, tales como un grupo 2-nitrofenilo, un grupo 3-nitrofenilo, y un grupo 4-nitrofenilo; grupos alcoxifenilo, tales

como un grupo 2-metoxifenilo, un grupo 3-metoxifenilo, un grupo 4-metoxifenilo, un grupo 2,3-dimetoxifenilo, un grupo 2,4-dimetoxifenilo, un grupo 2,5-dimetoxifenilo, un grupo 2,6-dimetoxifenilo, un grupo 3,4-dimetoxifenilo, y un grupo 3,5-dimetoxifenilo; grupos (haloalcoxi)fenilo, tales como un grupo 2-(trifluorometoxi)fenilo, un grupo 3-(trifluorometoxi)fenilo, y un

- 5 grupo 4-(trifluorometoxi)fenilo; grupos (alcoxicarbonil)fenilo, tales como un grupo 4-metoxicarbonilfenilo, y un grupo 4-etoxicarbonilfenilo; y grupos cicloalquilo C3-C12, tales como un grupo ciclopropilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dimetilciclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrametilciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo 1-metilciclopentilo, un grupo 2-metilciclopentilo, un grupo 3-metilciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo 1-metilciclohexilo, un grupo 2-metilciclohexilo, un grupo 3-metilciclohexilo, un grupo 4-metilciclohexilo, un grupo cicloheptilo, y un grupo ciclooctilo.
- 10

Los ejemplos del grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros como se usa en el presente documento incluyen grupos heterocíclicos de 5 miembros que tienen un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y/o un átomo de nitrógeno, tales como un grupo tetrahydrofuranilo, un grupo furanilo, un grupo tienilo, un grupo pirrolilo, un grupo imidazolilo, y un grupo isotiazolilo; y

- 15 grupos heterocíclicos de 6 miembros que tienen un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y/o un átomo de nitrógeno, tales como un grupo piperidino, un grupo morfolino, un grupo piridilo, un grupo piridazinilo, un grupo pirimidilo, y un grupo pirazinilo.
- 20

Los ejemplos del "grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2" incluyen un grupo 1-pirrolilo, un grupo 2-pirrolilo, un grupo 3-pirrolilo, un grupo 2-furanilo, un grupo 3-furanilo, un grupo 2-tienilo, un grupo 3-tienilo, un grupo 1-pirazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 4-pirazolilo, un grupo 3-isoxazolilo, un grupo 4-isoxazolilo o un grupo 5-isoxazolilo, un grupo 3-isotiazolilo, un grupo 4-isotiazolilo, un grupo 5-isotiazolilo, un grupo 1-imidazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 4-imidazolilo, un grupo 2-oxazolilo, un grupo 4-oxazolilo, un grupo 5-oxazolilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 4-tiazolilo, un grupo 5-tiazolilo, un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1-pirrolidinilo, un grupo 2-pirrolidinilo, un grupo 3-pirrolidinilo, un grupo 2-tetrahydrofuranilo, un grupo 3-tetrahydrofuranilo, un grupo 1-piperidino, un grupo 1-morfolino, un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridazinilo, un grupo 4-piridazinilo, un grupo 2-pirimidinilo, un grupo 4-pirimidinilo, un grupo 5-pirimidinilo, un grupo 2-pirazinilo, un grupo 1,2,4-triazin-3-ilo, un grupo 1,2,4-triazin-5-ilo, grupos 1,2,4-triazin-6-ilo, y un grupo 1,3,5-triazin-2-ilo.

25

30

- 35 Los ejemplos del grupo "alquilamino C1-C6" incluyen un grupo N-metilamino, un grupo N-etilamino, un N-propilamino, un grupo N-butilamino, y un grupo N-pentilamino.

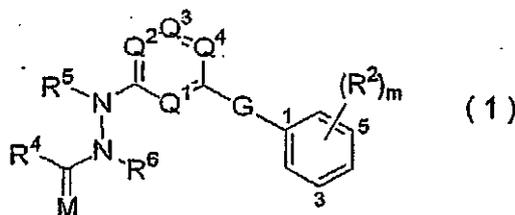
Los ejemplos del "grupo dialquilamino C2-C12" incluyen un grupo *N,N*-dimetilamino, y un grupo *N,N*-dietilamino.

- 40 Los ejemplos del grupo OR⁸ incluyen un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propoxi, un grupo isopropoxi, un grupo butoxi, un grupo isobutoxi, un grupo *sec*-butoxi, un grupo *terc*-butoxi, un grupo viniloxi, un grupo aliloxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo cianometoxi, un grupo 2-(*N,N*-dimetilamino)etoxi, un grupo 2-(*N*-metilamino)etoxi, un grupo metoxietoxi, un grupo metoxicarbonilmetoxi, un grupo acetilmetoxi, un grupo fenoxietoxi, un grupo 2-(fenilamino)etoxi, un grupo 2-piridiloxi, un grupo benciloxi, grupo fenoxi, un grupo ciclohexiloxi, un grupo furan-2-oxi, y un grupo piridin-2-oxi.
- 45

Los ejemplos del grupo N(R⁹)R¹⁰ incluyen un grupo N-metilamino, un grupo *N,N*-dimetilamino, un grupo *N*-etilamino, un grupo *N,N*-dietilamino, un grupo *N*-metil-*N*-etilamino, un grupo *N*-alilamino, un grupo *N*-(2,2,2-trifluoroetil)amino, un grupo *N*-(2-(*N,N*-dimetilamino)etil)amino, un grupo *N*-(2-(*N*-metilamino)etil)amino, un grupo *N*-(2-metoxietil)amino, un grupo *N*-(metoxicarbonilmetil)amino, un grupo *N*-(2-fenoxietil)amino, un grupo *N*-(2-(fenilamino)etil)amino, un grupo *N*-bencilamino, un grupo *N*-fenilamino, un grupo *N*-fenil-*N*-metilamino, un grupo *N*-ciclohexilamino, un *N*-ciclohexil-*N*-metilamino, un grupo pirrolidin-1-ilo, y un grupo piperidin-1-ilo.

50

- 55 Los ejemplos del compuesto de la presente invención incluyen los siguientes compuestos de hidrazida de la fórmula (1):



Un compuesto de hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la

fórmula
G-1.

- 5 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-2.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-3.
- 10 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1 e Y^1 es un átomo de oxígeno.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^1 es un grupo trifluorometilo.
- 15 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^2 , Q^3 y Q^4 son grupos CH.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es como se ha definido anteriormente.
- 20 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un grupo alquilo C1-C6.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un grupo metilo.
- 25 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un grupo etilo.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un átomo de halógeno.
- 30 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un átomo de flúor.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un átomo de cloro.
- 35 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde Q^1 , Q^3 y Q^4 son grupos CH, Q^2 es un grupo CR^3 , y R^3 es un átomo de yodo.
- 40 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde m es 2 y los R^2 representan independientemente un átomo de halógeno.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde m es 2 y los R^2 representan átomos de cloro.
- 45 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde m es 2, los R^2 son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R^2 representan átomos de cloro.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^4 es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1.
- 50 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^4 es un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2.
- 55 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^4 es un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^4 es un grupo OR^8 , y R^8 es como se ha definido anteriormente.
- 60 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^4 es un grupo $N(R^9)R^{10}$, y R^9 y R^{10} son como se han definido anteriormente.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^5 es un átomo de hidrógeno.
- 65 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R^5 es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1.

- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁵ es un grupo metilo.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁵ es un grupo alcoxicarbonilo C2-C6.
- 5 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁵ es un grupo alquilcarbonilo C2-C6.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁵ es un grupo acetilo.
- 10 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁵ es un grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁵ es un grupo benzoilo.
- 15 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁶ es un átomo de hidrógeno.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁶ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1.
- 20 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde R⁶ es un grupo metilo.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, y R¹ es un grupo trifluorometilo.
- 25 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, y Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH.
- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R² son átomos de cloro.
- 30 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. y R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1.
- 35 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.
- 40 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, R⁵ es un átomo de hidrógeno, y R⁶ es un grupo metilo.
- 45 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, R² son átomos de cloro, R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, R⁵ es un grupo metilo, y R⁶ es un átomo de hidrógeno.
- 50 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son grupos CH, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, R² son átomos de cloro, R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, R⁵ es un grupo metilo, y R⁶ es un grupo metilo.
- 55 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, y R³ es como se ha definido anteriormente.
- 60 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es como se ha definido anteriormente. m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R² son átomos de cloro.
- 65

- Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R²ⁱ son átomos de cloro.
- 5 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un grupo metilo, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R²ⁱ son átomos de cloro.
- 10 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un grupo etilo, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R²ⁱ son átomos de cloro.
- 15 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de halógeno, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R²ⁱ son átomos de cloro.
- 20 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de flúor, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R²ⁱ son átomos de cloro.
- 25 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, y los R²ⁱ son átomos de cloro.
- 30 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es como se ha definido anteriormente. m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, R² son átomos de cloro, y R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1.
- 35 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.
- 40 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁵ es un grupo metilo, y
- 45 R⁶ es un átomo de hidrógeno.
- 50 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁵ es un grupo acetilo, y R⁶ es un átomo de hidrógeno.
- 55 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁵ es un grupo benzoílo, y R⁶ es un átomo de hidrógeno.
- 60 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.
- 65 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo cíclico C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo

E1, y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.

5 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2. y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.

10 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo OR⁸, R⁸ es como se ha definido anteriormente, y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.

15 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo N(R⁹)R¹⁰, R⁹ y R¹⁰ son como se han definido anteriormente. y R⁵ y R⁶ son átomos de hidrógeno.

20 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, R⁵ es un grupo metilo, y R⁶ es un átomo de hidrógeno.

25 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, R⁵ es un grupo acetilo, y R⁶ es un átomo de hidrógeno.

30 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, R¹ es un grupo trifluorometilo, Q¹, Q³ y Q⁴ son grupos CH, Q² es un grupo CR³, R³ es un átomo de cloro, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, R⁵ es un grupo benzóilo, y R⁶ es un átomo de hidrógeno.

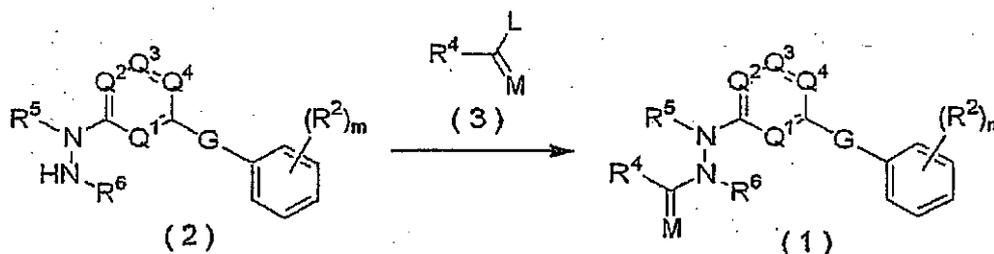
35 Un compuesto hidrazida de la fórmula (1), donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1, Y¹ es un átomo de oxígeno, M representa un átomo de oxígeno, R¹ es, un grupo trifluorometilo, Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son respectivamente grupos CR³, R³ es un grupo alquilo C1-C6 o un átomo de halógeno, m es 2, los R² son sustituyentes en las posiciones 3 y 5, los R² son átomos de cloro. R⁴ es un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo fenilo opcionalmente sustituido con un grupo nitro o metoxi, un grupo piridilo, un grupo (alcoxi C1-C4)metilo, un grupo (alquil C1-C4)amino, un grupo di-(alquil C1-C4)amino, un grupo amino, un grupo alquenoilo C2-C4, un grupo vinilo sustituido con fenilo o un átomo de hidrógeno, R⁵ y R⁶ son respectivamente un alquilo C1-C4, un grupo (alcoxi C1-C4)carbonilo, un grupo alquilcarbonilo, un grupo fenilcarbonilo, o un átomo de hidrógeno.

Después, se explica un proceso para producir el compuesto de la presente invención.

50 En lo sucesivo en el presente documento, un compuesto representado por la fórmula (a) (a = símbolo arbitrario) puede denominarse un "compuesto (a)".

(Procedimiento de producción 1)

El compuesto de la presente invención puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (2) con el compuesto (3):



55 donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², R⁴, R⁵, R⁶, G, M, y m so como se han definido anteriormente, y L representa un grupo

hidroxilo o un átomo de cloro.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

5 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *terc*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

10

Cuando L es un átomo de cloro, la reacción se realiza habitualmente en presencia de una base.

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

15

Cuando L es un grupo hidroxilo, la reacción se realiza habitualmente en presencia de un agente de condensación.

Los ejemplos del agente de condensación incluyen dicitohexilcarbodiimida y clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida.

20

La cantidad del compuesto (3) que debe usarse en la reacción es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2).

25

La cantidad de la base o agente de condensación que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2).

La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

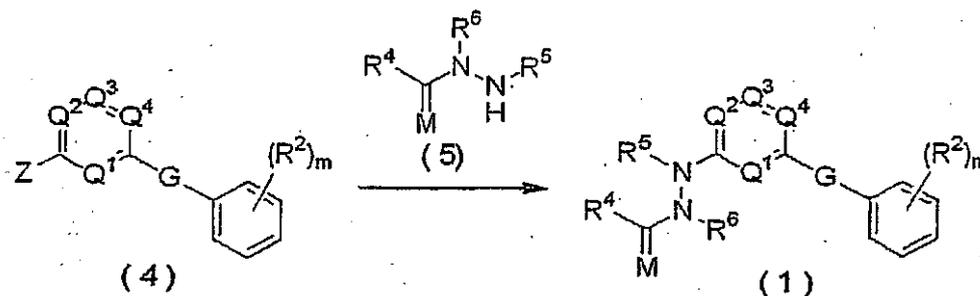
30

Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado de la presente invención puede purificarse adicionalmente por cromatografía, recristalización o similares.

35

(Procedimiento de producción 2)

El compuesto de la presente invención también puede prepararse haciendo reaccionar el compuesto (4) con el compuesto (5):



40

donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², R⁴, R⁵, R⁶, G, M y m son como se han definido anteriormente, y Z representa un grupo saliente, tal como un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metanosulfonilo, un grupo *p*-toluenosulfonilo o un grupo trifluorometanosulfonilo.

45

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *terc*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

50

La reacción puede realizarse en presencia de una base, si fuera necesario.

55

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

- 5 La cantidad del compuesto (5) que debe usarse en la reacción es habitualmente de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto (4). La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto (4).

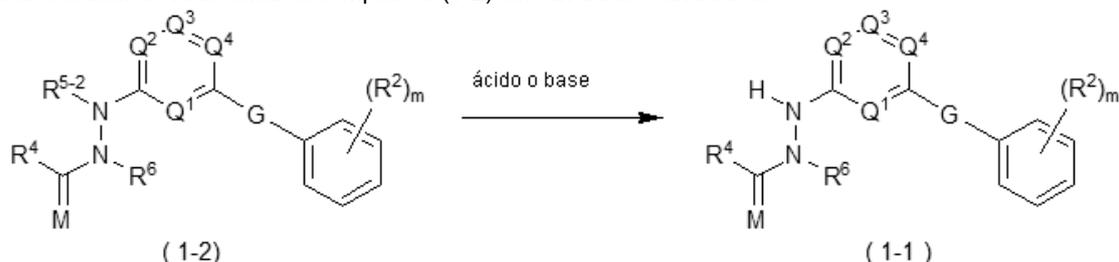
La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 10 Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado de la presente invención puede purificarse adicionalmente por cromatografía, recristalización o similares.

- 15 La reacción también puede realizarse en condiciones para reacción de acoplamiento general usando catalizador de metal de transición como se describe en la bibliografía, por ejemplo, *Org. Lett.*, 3, 3803-3805 (2001).

(Procedimiento de producción 3)

- 20 Entre los compuestos de la presente invención, el compuesto (1-1), donde R⁵ es un átomo de hidrógeno, puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (1-2) con un ácido o una base:



- 25 donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², R⁴, R⁶, G, M y m son como se han definido anteriormente, y R⁵ representa un grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, o un grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

La reacción puede realizarse en un disolvente, si fuera necesario.

- 30 Los ejemplos de disolvente incluyen agua; éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *terc*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; alcoholes, tales como metanol, etanol, y *n*-propanol; y sus mezclas.

- 35 Los ejemplos del ácido incluyen ácidos orgánicos, tales como ácido acético, y ácido trifluoroacético; y ácidos inorgánicos, tales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, y ácido sulfúrico.

- 40 Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

La cantidad del ácido que debe usarse en la reacción es habitualmente de 1 a 100 moles por 1 mol del compuesto (1-2).

- 45 La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 100 moles por 1 mol del compuesto (1-2).

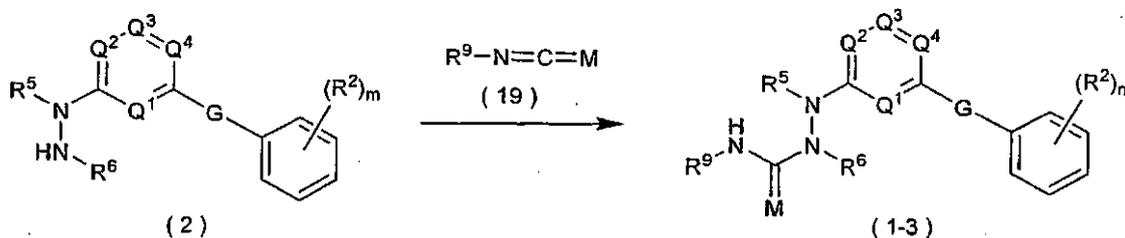
La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 50 Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado de la presente invención puede purificarse adicionalmente por cromatografía, recristalización o similares.

55

(Procedimiento de producción 4)

Entre los compuestos de la presente invención, el compuesto (1-3) donde R^4 es un grupo $N(R^9)R^{10}$ y R^{10} es un átomo de hidrógeno pueden producirse haciendo reaccionar el compuesto (2) con el compuesto (19):



5 donde $Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, R^2, R^5, R^6, R^9, G, M$ y m son como se han definido anteriormente.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente. Si fuera necesario, la reacción también puede realizarse en presencia de una base.

10 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

Los ejemplos de la base incluyen carbonatos, tales como carbonato potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina, imidazol, y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-7-undeceno.

20 La cantidad de del compuesto (19) que debe usarse es habitualmente de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto (2).

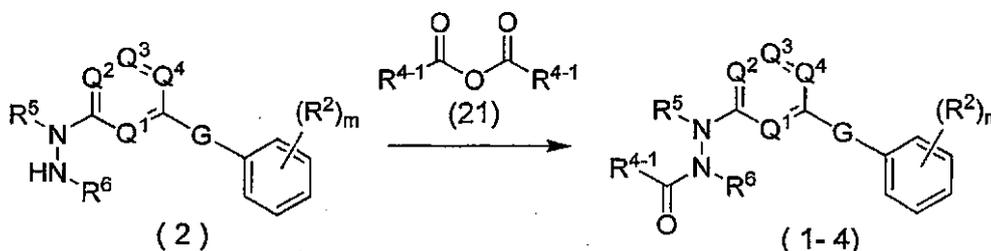
Si la base se usa en la reacción, la cantidad de base es habitualmente de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto (2).

25 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

30 Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado de la presente invención puede purificarse adicionalmente por cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción 5)

35 Entre los compuestos de la presente invención, el compuesto (1-4), donde R^4 es R^{4-1} y M es un átomo de oxígeno, puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (2) con el compuesto (21):



40 donde $Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, R^2, R^5, R^6, G,$ y m so como se han definido anteriormente, y R^{4-1} representa un grupo hidrocarburo de C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, o un grupo OR^8 , y R^8 es como se ha definido anteriormente.

La reacción puede realizarse en un disolvente. si fuera necesario.

45 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus

mezclas.

Si fuera necesario, la reacción también puede realizarse en presencia de una base.

5 Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina, e imidazol.

La cantidad de del compuesto (21) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2).

10 Si la base se usa en la reacción, la cantidad de base es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2).

La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

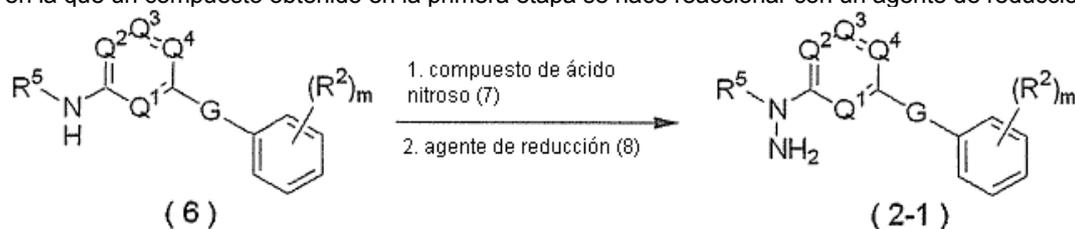
15 Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado de la presente invención puede purificarse adicionalmente por cromatografía, recristalización o similares.

20 Como se ha descrito anteriormente, el compuesto representado por la fórmula (2) es útil como intermedio para la producción del compuesto de la presente invención. El compuesto representado por la fórmula (2) entra dentro de la presente invención. Los ejemplos específicos y preferidos del compuesto incluyen los compuestos de la fórmula (2) en donde cada sustituyente es igual que el de los compuestos de la presente invención que se han descrito anteriormente de manera específica.

A continuación, se explica un procedimiento para producir un intermedio usado para la preparación del compuesto de la presente invención.

30 (Procedimiento de producción de referencia 1)

Entre los compuestos (2), el compuesto (2-L) donde R⁶ es un átomo de hidrógeno pueden producirse realizando la primera etapa, en la que el compuesto (6) se hace reaccionar con un compuesto de ácido nitroso (7), y la segunda etapas en la que un compuesto obtenido en la primera etapa se hace reaccionar con un agente de reducción (8):



35 donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², R⁵, G y m son como se han definido anteriormente,

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

40 Los ejemplos de disolvente incluyen agua; éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *terc*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; hidrocarburo aromático, tal como tolueno y xileno; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

45 Los ejemplos del compuesto de ácido nitroso (7) incluyen sales nitrito, tales como nitrito sódico; y ésteres de nitrito, tales como etil nitrito.

Los ejemplos del agente de reducción (8) incluyen sales sulfito, tales como sulfito sódico; metales, tales como cinc; y cloruro de estaño (II).

50 La cantidad de del compuesto de ácido nitroso (7) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6).

55 La cantidad del agente de reducción (8) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6).

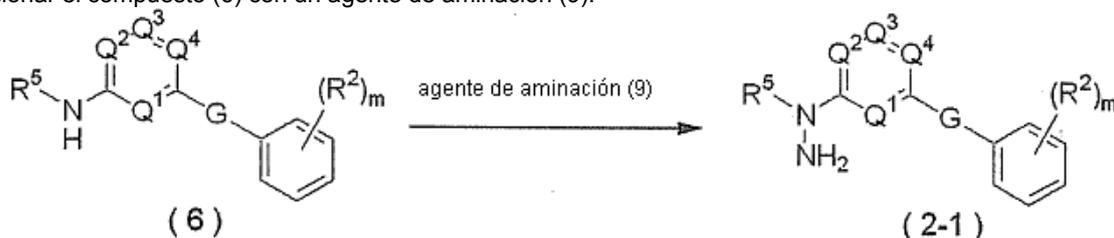
La temperatura de reacción en la primera etapa está habitualmente en el intervalo de -20 a 30 °C, y el tiempo de reacción en la primera etapa está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

5 La mezcla de reacción obtenida en la primera etapa puede usarse según está en la segunda etapa, donde se hace reaccionar con el agente de reducción (8). La temperatura de reacción en la segunda etapa está habitualmente en el intervalo de -20 a 50 °C, y el tiempo de reacción en la segunda etapa es habitualmente de hasta 24 horas.

10 Después de que se complete la reacción, el compuesto (2-1) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (2-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 2)

15 Entre los compuestos (2), el compuesto (2-1), donde R⁶ es un átomo de hidrógeno también puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (6) con un agente de aminación (9):



donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², R⁵, G y m son como se han definido anteriormente,

20 La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

Los ejemplos de disolvente incluyen agua; éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; hidrocarburo aromático, tal como tolueno y xileno; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

25 La reacción se realiza habitualmente en presencia de una base.

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido potásico; hidróxidos metálicos, tales como hidróxido sódico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

Los ejemplos del agente de aminación (9) incluyen cloroaminas, tales como cloramina; O-acilhidroxilaminas, tales como O-mesitoilhidroxilamina; O-sulfonilhidroxilamina; y ácido hidroxilamin-O-sulfónico.

35 En lugar de añadir el agente de aminación (9), pueden añadirse materiales para dicho agente de aminación al sistema de reacción para realizar la síntesis del agente de aminación (9) y la reacción del compuesto (6) con el agente de aminación (9) simultáneamente. Por ejemplo, pueden añadirse hipoclorito sódico y amoníaco al sistema de reacción en lugar de añadir cloramina como el agente de aminación (9).

40 La cantidad del agente de aminación (9) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6).

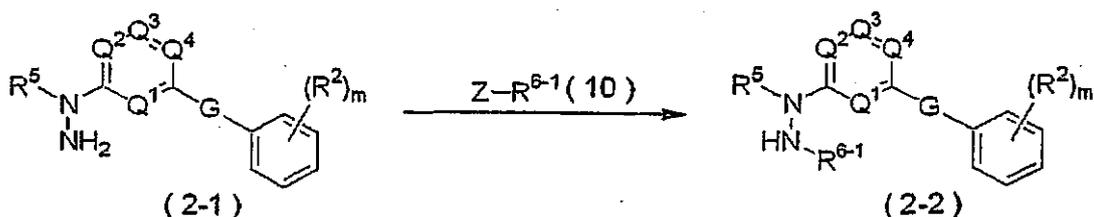
La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6).

45 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

50 Después de que se complete la reacción, el compuesto (2-1) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (2-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 3)

55 Entre los compuestos (2), el compuesto (2-2), donde R⁶ es R⁶⁻¹ puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (2-1) con el compuesto (10):



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^2 , R^5 , G , Z y m so como se han definido anteriormente, y R^{6-1} representa un grupo hidrocarburo de C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcóxicarbonilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C12 o un grupo formilo.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

La reacción se realiza habitualmente en presencia de una base.

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxidos potásicos; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

La cantidad de del compuesto (10) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2-1).

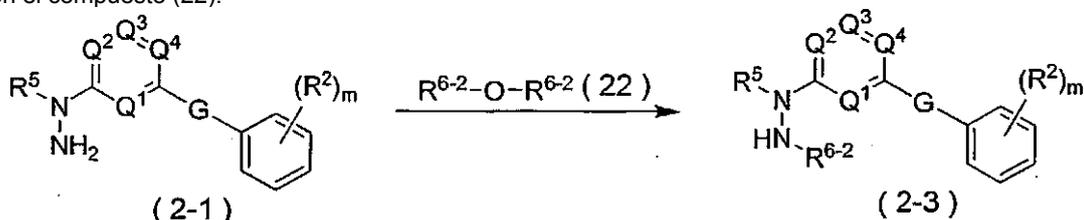
La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2-1).

La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (2-2) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (2-2) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 4)

Entre los compuestos (2), el compuesto (2-3) donde R^6 es R^{6-2} puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (2-1) con el compuesto (22):



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^2 , R^5 , G , y m so como se han definido anteriormente, y R^6 representa un grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, o un grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

La reacción puede realizarse en un disolvente. si fuera necesario.

Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

Si fuera necesario, la reacción también puede realizarse en presencia de una base.

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina, e imidazol.

5 La cantidad de del compuesto (22) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2-1).

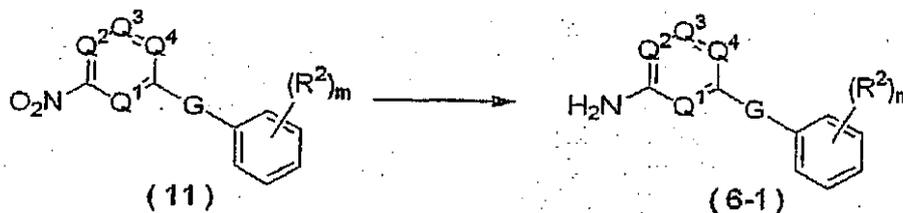
Si la base se usa en la reacción, la cantidad de base es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (2-1).

10 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (2-3) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (2-3) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

15 (Procedimiento de producción de referencia 5)

Entre los compuestos (6), el compuesto (6-1) donde R⁵ es un átomo de hidrógeno puede producirse reduciendo el compuesto (11) por uno cualquiera de los siguientes métodos (i) a (iii).



20 donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², G y m son como se han definido anteriormente,

(i) Método que comprende una reacción con gas hidrógeno en presencia de un catalizador de metal de transición

La reacción se realiza en un disolvente.

25 Los ejemplos del disolvente incluyen ésteres, tales como acetato de etilo; alcoholes, tales como etanol y metanol; agua, ácido acético, ácido clorhídrico, y sus mezclas.

Los ejemplos de catalizador de metal de transición incluyen níquel Raney, paladio-carbono y dióxido de platino.

30 La cantidad de catalizador de metal de transición que debe usarse es habitualmente de 0,01 a 0,5 moles por 1 mol del compuesto (11).

La cantidad de gas de hidrógeno que debe usarse es habitualmente de 0,01 a 100 moles por 1 mol del compuesto (11).

35 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 80 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,1 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (6-1) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (6-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

40 (ii) Método que comprende una reacción con una hidrazina en presencia de una base

La reacción se realiza en un disolvente.

45 Los ejemplos del disolvente incluyen éteres, tales como dietilenglicol y trietilenglicol; agua; y sus mezclas.

Los ejemplos de la base incluyen hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido potásico.

Los ejemplos de la hidrazina incluyen hidratos de hidrazina.

50 La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (11).

La cantidad de hidrazina que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (11).

55 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (6-1) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (6-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(ii) Método que comprende una reacción con metal en presencia de un ácido

5

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

Los ejemplos del disolvente incluyen alcoholes, tales como etanol; agua; y sus mezclas.

10 Los ejemplos del metal incluyen hierro, cinc, estaño y cloruro de estaño (II).

Los ejemplos del ácido incluyen ácido acético, ácido clorhídrico y ácido sulfúrico.

La cantidad de metal que debe usarse en la reacción es habitualmente de 2 a 20 moles por 1 mol del compuesto (11).

15

La cantidad del ácido que debe usarse es habitualmente de 0,1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (11).

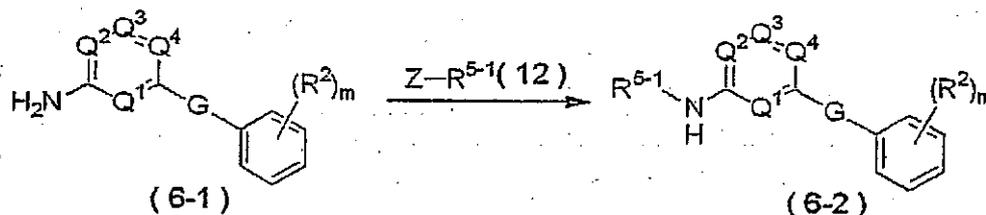
La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 12 horas.

20

Después de que se complete la reacción, el compuesto (6-1) puede aislarse por filtración y, si fuera necesario, pos-tratamiento, tal como extracción de disolvente orgánico, secado y concentración. El compuesto aislado (6-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

25 (Procedimiento de producción de referencia 6)

Entre los compuestos (6), el compuesto (6-2), donde R⁵ es R⁵⁻¹ puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (6-1) con el compuesto (12):



30 donde Q¹, Q², Q³, Q⁴, R², G, Z y m so como se han definido anteriormente, y R⁵⁻¹ representa un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12

opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo benzilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C12 o un grupo formilo.

35

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

Los ejemplos de disolvente usado en la reacción incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

40

La reacción se realiza habitualmente en presencia de una base.

45

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

50 La cantidad de del compuesto (12) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6-1).

La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6-1).

La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

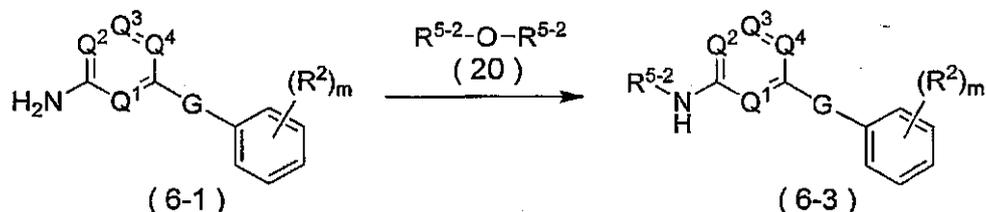
55

Después de que se complete la reacción, el compuesto (6-2) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto

aislado (6-2) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 7)

- 5 Entre los compuestos (6), el compuesto (6-3), donde R^5 es R^{5-2} puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (6-1) con el compuesto (20):



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^2 , G y m son como se han definido anteriormente, y R^5 representa un grupo benzilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2. un grupo alquilcarbonilo C2-C6, o un grupo alcóxicarbonilo C2-C6,

La reacción puede realizarse en un disolvente. si fuera necesario.

- 15 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno y xileno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido y sulfolano; hidrocarburos halogenados, tales como 1,2-dicloroetano, cloroformo y clorobenceno; y sus mezclas.

- 20 Si fuera necesario, la reacción también puede realizarse en presencia de una base.

Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina, e imidazol.

La cantidad de del compuesto (20) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6-1).

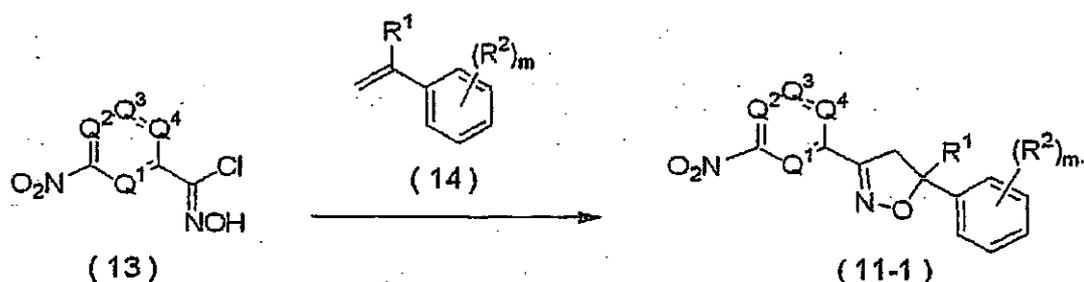
Si la base se usa en la reacción, la cantidad de base es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (6-1).

- 30 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 100 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (6-3) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (6-3) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 8)

- 40 Entre los compuestos (11), el compuesto (11-1) donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-1 e Y^1 es un átomo de oxígeno, puede producirse realizando la primera etapa, donde el compuesto (13) se hace reaccionar con una base y la segunda etapa, donde el producto obtenido en la primera etapa se hace reaccionar con el compuesto (14):



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^1 , R^2 y m son como se han definido anteriormente.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácido, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos, tales como tolueno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; y sus mezclas.

5 Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

10 La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (13).

La cantidad del compuesto (14) que debe usarse en la reacción es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (13).

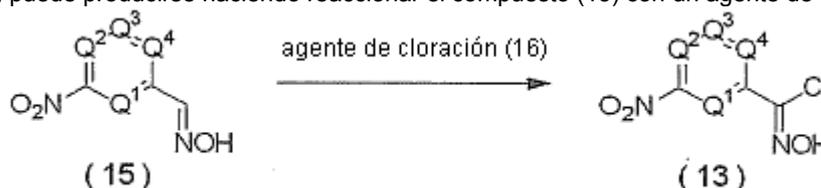
15 La temperatura de reacción en la primera etapa está habitualmente en el intervalo de 0 a 80 °C, y el tiempo de reacción en la primera etapa está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

La mezcla de reacción obtenida en la primera etapa puede usarse en la segunda etapa sin purificación. La temperatura de reacción en la segunda etapa está habitualmente en el intervalo de 0 a 80 °C, y el tiempo de reacción en la segunda etapa está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (11-1) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (11-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

25 (Procedimiento de producción de referencia 9)

El compuesto (13) puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (15) con un agente de cloración (16):



30 donde Q¹, Q², Q³ y Q⁴ son como se han definido anteriormente.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

35 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; hidrocarburos, tales como tolueno; ésteres, tales como acetato de etilo; amidas de ácido, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; y sus mezclas.

Los ejemplos del agente de cloración (16) incluyen un gas de cloro y *N*-clorosuccinimida.

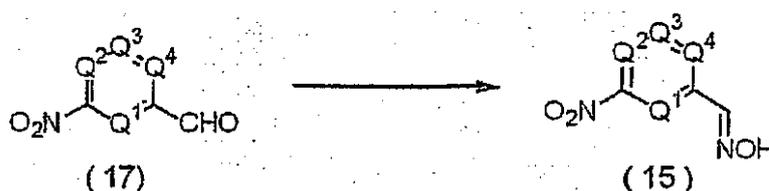
40 La cantidad del agente de cloración (16) que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (15).

La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de -20 a 80 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

45 Después de que se complete la reacción, el compuesto (13) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (13) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 10)

50 El compuesto (15) puede producirse haciendo reaccionar el compuesto (17) con hidroxilamina:



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 y Q^4 son como se han definido anteriormente.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

5 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; hidrocarburos, tales como tolueno; ésteres, tales como acetato de etilo; amidas de ácido, tales como *N,N*-dimetilformamida; alcoholes, tales como etanol y metanol; nitrilos, tales como acetonitrilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; agua y sus mezclas.

10 Los ejemplos de la hidroxilamina incluyen sales capaces de producir hidroxilamina en el sistema de reacción. Los ejemplos de la sal incluyen sales de hidroxilamina con ácido mineral, tales como clorhidrato de hidroxilamina y sulfato de hidroxilamina.

15 La cantidad de la hidroxilamina que debe usarse en la reacción es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (17).

Cuando se usa una sal de hidroxilamina con un ácido inorgánico, la reacción se realiza en presencia de una base.

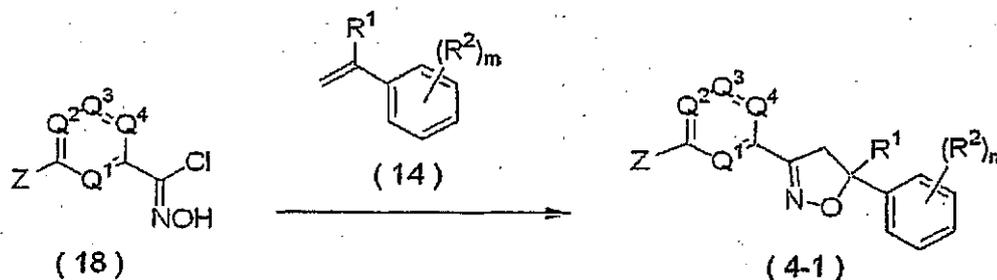
20 Los ejemplos de la base incluyen aminas orgánicas, tales como trietilamina; carbonatos, tales como carbonato sódico; e hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido sódico.

La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol de la sal de hidroxilamina con ácido orgánico.

25 La temperatura de reacción está habitualmente en el intervalo de 0 a 80 °C, y el tiempo de reacción está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

30 Después de que se complete la reacción, el compuesto (15) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (15) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares. (Procedimiento de producción de referencia 11)

35 Entre los compuestos (4), el compuesto (4-1) donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por G-1 e Y^1 es un átomo de oxígeno puede producirse realizando una etapa I donde el compuesto (18) se hace reaccionar con una base y una etapa II donde el compuesto obtenido en la etapa I se hace reaccionar con el compuesto (14):



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^1 , R^2 , Z y m son como se han definido anteriormente.

La reacción se realiza habitualmente en un disolvente.

40 Los ejemplos de disolvente incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, éter dietílico, *tert*-butil metil éter, dimetil éter de etilenglicol y 1,4-dioxano; amidas de ácido, tales como *N,N*-dimetilformamida; nitrilos, tales como acetonitrilo; hidrocarburos, tales como tolueno; ésteres, tales como acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; y sus mezclas.

45 Los ejemplos de la base incluyen hidruros de metal alcalino, tales como hidruro sódico; carbonatos, tales como carbonato potásico; alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido potásico; y aminas orgánicas, tales como trietilamina y piridina.

50 La cantidad del compuesto (14) que debe usarse en la reacción es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (18).

La cantidad de base que debe usarse es habitualmente de 1 a 10 moles por 1 mol del compuesto (18).

55 La temperatura de reacción en la etapa I está habitualmente en el intervalo de 0 a 80 °C, y el tiempo de reacción en la

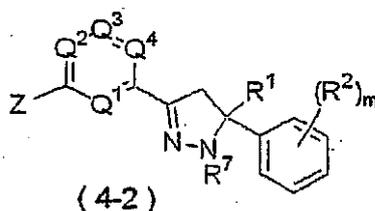
etapa I está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

La mezcla de reacción obtenida en la etapa I puede usarse en la etapa 11 sin purificación. La temperatura de reacción en la etapa II está habitualmente en el intervalo de 0 a 80 °C, y el tiempo de reacción en la etapa II está habitualmente en el intervalo de 0,5 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto (4-1) puede aislarse mediante pos-tratamiento, por ejemplo, por extracción de la mezcla de reacción con un disolvente orgánico, secado y después concentración. El compuesto aislado (4-1) puede purificarse adicionalmente mediante cromatografía, recristalización o similares.

(Procedimiento de producción de referencia 12)

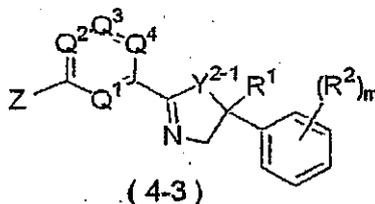
Entre los compuestos (4), puede producirse el compuesto (4-2) donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por G-1 e Y^1 es un grupo NR^7 , por ejemplo, de acuerdo con un método descrito en el documento WO 2007/123855.



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^1 , R^2 , R^7 , Z y m son como se han definido anteriormente.

(Procedimiento de producción de referencia 13)

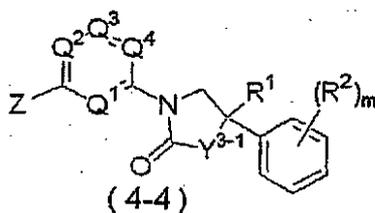
Entre los compuestos (4), puede producirse el compuesto (4-3) donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-2 e Y^2 es un Y^{2-1} , por ejemplo, de acuerdo con un método descrito en el documento JP-A 2007-91708..



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^1 , R^2 , Z y m representan lo mismo que se ha definido anteriormente, e Y^{2-1} representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo metileno.

(Procedimiento de producción de referencia 14)

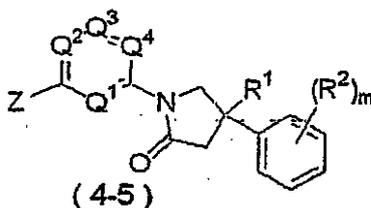
Entre los compuestos (4), puede producirse el compuesto (4-4) donde G es un anillo heterocíclico de 5 miembros representado por la fórmula G-3 e Y^3 es Y^{3-1} , por ejemplo, de acuerdo con un método descrito en el documento WO 2007/123853.



donde Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , R^1 , R^2 , Z y m so como se han definido anteriormente, Y^{3-1} representa un átomo de oxígeno o NR^7 , y R^7 es como se ha definido anteriormente.

(Procedimiento de producción de referencia 15)

Entre los compuestos (4), puede producirse el compuesto (4-5) donde G es G-3 e Y^3 es un grupo metileno, por ejemplo, de acuerdo con un método descrito en el documento JP-A 2008-110971..



donde $Q^1, Q^2, Q^3, Q^4, R^1, R^2, Z$ y m son como se han definido anteriormente.

- 5 Los ejemplos de plagas en las que el compuesto de la presente invención exhibe eficacia incluyen plagas de artrópodos tales como insectos dañinos y ácaros dañinos, y nematelmintos tales como nematodos y , más específicamente, están incluidas las siguientes plagas.

Hemípteros:

- 10 Pulgas de plantas (*Delphacidae*), tales como la pulga de plantas pequeña marrón (*Laodelphax striatellus*), la pulga de plantas marrón (*Nilaparvata lugens*), y la pulga del arroz de dorso blanco (*Sogatella furcifera*); pulgas de hojas (*Deltocephalidae*), tales como la pulga verde de la hoja del arroz (*Nephotettix cincticeps*), la pulga verde de la hoja del arroz (*Nephotettix virescens*), y la pulga del té verde (*Empoasca onukii*); áfidos (*Aphididae*) tales como el áfido del algodón (*Aphis gossypii*), áfido verde del melocotón (*Myzus persicae*), áfido del repollo (*Brevicoryne brassicae*), pulgón verde de los cítricos (*Aphis spiraecola*), áfido de la patata (*Macrosiphum euphorbiae*), áfido dedalera (*Aulacorthum solani*), pulgón de la avena (*Rhopalosiphum padi*), áfido de los cítricos tropicales (*Toxoptera citricidus*), y pulgón del cituelo arinoso (*Hyalopteruspruni*); chinches (*Pentatomidae*), tales como pulgón del arroz verde (*Nezara antennata*), pulgón de la habichuela (*Riptortus clavetus*), chinche del arroz (*Leptocorisa chinensis*), chinche espinoso de motas blancas (*Eysarcoris parvus*), y chinche marrón marmórea (*Halyomorpha mista*); moscas blancas (*Aleyrodidae*), tales como mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*), mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), mosca blanca de la hoja plateada (*Bemisia argentifolii*), mosca blanca de los cítricos (*Dialeurodes citri*), y mosca blanca espinosa de los cítricos (*Aleurocanthus spiniferus*); cochinillas (*Coccidae*), tales como cochinilla roja de California (*Aonidiella aurantii*), cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciosa*), cochinilla de los cítricos (*Unaspis citri*), cochinilla roja (*Ceroplastes rubens*), cochinilla acanalada (*Icerya purchasi*), chinche harinosa japonesa (*Planococcus kraunhiae*), chinche arinosa Cosmstock (*Pseudococcus longispinus*), y cochinilla blanca del melocotón (*Pseudaulacaspis pentagona*); chinches de encaje (*Tingidae*); psílidos (*Psyllidae*), etc.;
- 20 como mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*), mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*), mosca blanca de la hoja plateada (*Bemisia argentifolii*), mosca blanca de los cítricos (*Dialeurodes citri*), y mosca blanca espinosa de los cítricos (*Aleurocanthus spiniferus*); cochinillas (*Coccidae*), tales como cochinilla roja de California (*Aonidiella aurantii*), cochinilla de San José (*Comstockaspis perniciosa*), cochinilla de los cítricos (*Unaspis citri*), cochinilla roja (*Ceroplastes rubens*), cochinilla acanalada (*Icerya purchasi*), chinche harinosa japonesa (*Planococcus kraunhiae*), chinche arinosa Cosmstock (*Pseudococcus longispinus*), y cochinilla blanca del melocotón (*Pseudaulacaspis pentagona*); chinches de encaje (*Tingidae*); psílidos (*Psyllidae*), etc.;
- 25 Lepidópteros:

- 30 Pirálidos (*Pyralidae*), tales como barrenador del arroz (*Chilo suppressalis*), perforados amarillo del tallo del arroz (*Tryporyza incertulas*), enrollador de las hojas del arroz (*Cnaphalocrocis medinalis*), enrollador de las hojas del algodón (*Notarcha derogata*), polilla indica de la harina (*Plodia interpunctella*), *Ostrinia furnacalis*, gusano de la col (*Hellula undalis*), y oruga de la grama de los prados (*Pediasia teterrellus*); mariposas nocturnas (*Noctuidae*), tales como gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*), la gardama (*Spodoptera exigua*), oruga del corte del arroz (*Pseudaletia separata*), noctuido de la col (*Mamestra brassicae*), malduelme (*Agrotis ipsilon*), gusano de la remolacha (*Plusia nigrisigna*), *Thoricoplusia spp.*, *Heliothis spp.*, y *Helicoverpa spp.*; mariposas blancas (*Pieridae*), tales como blanquita de la col (*Pieris rapae*); enrolladores de hoja (*Tortricidae*), tales como *Adoxophyes spp.*, polilla oriental de los frutales (*Grapholita molesta*), perforador de la vaina de soja (*Leguminivora glycinivorella*), perforador de la vaina de la judía azuki (*Matsumuraeses azukivora*), capua (*Adoxophyes orana fasciata*), tórtido menor del té (*Adoxophyes sp.*), tórtido oriental del té (*Homona magnanima*), enrollador de las hojas de la manzana (*Archips fuscocupreanus*), y carpocapsa (*Cydia pomonella*); minadores de hojas (*Gracillariidae*), tales como minadora de las hojas del té (*Caloptilia theivora*), y minadora de las hojas del manzano (*Phyllonorycterringoneella*); *Carposinidae*, tales como polilla del melocotón (*Carposina niponensis*); polillas minadoras de hojas (*Lyonetiidae*), tales como *Lyonetia spp.*; polillas de las hierba (*Lymantriidae*), tales como *Zymantria spp.*, y *Euproctis spp.*; polillas hipomeútidas (*Yponomeutidae*), tales como polilla de la col (*Plutella xylostella*); polillas gelequíidas (*Gelechiidae*), tales como gusano rosado del algodón (*Pectinophora gossypiella*), y polilla de la patata (*Phthorimaea operculella*); polillas tigre y aliados (*Arctiidae*), tales como gusano telarañero (*Hyphantria cunea*); polillas de la ropa (*Tineidae*), tales como polilla de la ropa formadora de envuelta, (*Tinea translucens*), y polilla tejedora de la ropa (*Tineola bisselliella*), etc.;
- 40
- 45

Tisanópteros:

- 50 Trips occidental de las flores (*Frankliniella occidentalis*), trips del melón (*Thrips palmi*), trips amarillo del té (*Scirtothrips dorsalis*), trips de la cebolla (*Thrips tabaci*), trips de las flores (*Frankliniella intonsa*), etc.;

Dípteros:

- 55 Mosca doméstica (*Musca domestica*), mosquito común (*Culex pipiens pallens*), tábano (*Tabanus trigonus*), mosca de la cebolla (*Hylemya antiqua*), mosca de las semillas del maíz (*Hylemya platura*), *Anopheles sinensis*, mosca minadora de las hojas del arroz (*Agromyza oryzae*),

minadora de las hojas del arroz pequeña (*Hydrellia griseola*), gusano del tallo del arroz (*Chlorops oryzae*), mosca del melón (*Dacus cucurbitae*), mosca de la fruta (*Ceratitis capitata*), minadora de las hojas de legumbres (*Liriomyza trifolii*), minadora de las hojas del tomate (*Liriomyza sativae*), minadora de las hojas del guisante (*Chromatomyia horticola*), etc.;

5

Coleópteros:

Mariquita de veintiocho puntos (*Epilachna vigintioctopunctata*), escarabajo de las hojas de las curcubitáceas (*Aulacophora femoralis*), escarabajo pulga rayado (*Phyllotreta striolata*), escarabajo de las hojas del arroz (*Oulema oryzae*), gorgojo del arroz (*Echinocnemus squameus*), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), picudo del algodón (*Anthonomus grandis*), gorgojo sureño del frijol (*Callosobruchus chinensis*), escarabajo calzador (*Sphenophorus venatus*), escarabajo Japonés (*Popillia japonica*), escarabajo cuproso (*Anomala cuprea*), gusano de las raíces del maíz (*Diabrotica spp.*), escarabajo de la patata (*Leptinotarsa decemlineata*), gusanos del alambre (*Agriotes spp.*), barrenillo del tabaco (*Lasioderma serricorne*), gorgojo de las alfombras (*Anthrenus verbasci*), gorgojo castaño de la harina (*Tribolium castaneum*), carcoma (*Lyctus brunneus*), escarabajo longicornio de manchas blancas (*Anoplophora malasiaca*), escarabajo de los brotes del pino (*Tomicus piniperda*), etc.;

10

15

Ortópteros:

Langosta migratoria (*Locusta migratoria*), grillotopo (*Gryllotalpa africana*), saltamontes del arroz (*Oxya yezoensis*), saltamontes del arroz (*Oxya japonica*), etc.;

20

Himenópteros:

Avispa de la remolacha (*Athalia rosae*), hormiga cortadora (*Acromyrmex spp.*), hormiga de fuego (*Solenopsis spp.*), etc.; Nematodos:

25

Nematodo de punta blanca del arroz (*Aphelenchoides besseyi*), nematodo de los brotes de la fresa (*Nothotylenchus acris*), el nematodo del nudo de la raíz de la batata (*Meloidogyne incognita*), nematodo del nudo de la raíz del norte (*Meloidogyne hapla*), nematodo del nudo de la raíz Javanese (*Meloidogyne javanica*), nematodo quístico de la semilla de soja (*Heterodera glycines*), nematodo dorado de la patata (*Globodera rostochiensis*), nematodo lesionado de la raíz del cafeto (*Pratylenchus coffeae*), nematodo lesionado de la raíz de California (*Pratylenchus neglectus*), etc.;

30

Blatodeos:

Cucaracha alemana (*Blattella germanica*), cucaracha café (*Periplaneta fuliginosa*), cucaracha americana (*Periplaneta americana*), *Periplaneta brunnea*, cucaracha oriental (*Blatta orientalis*), etc.;

35

Ácaros:

Ácaros araña (*Tetranychidae*), tales como arañuela roja (*Tetranychus urticae*), ácaro araña de Kanzawa (*Tetranychus kanzawai*), ácaro rojo de los cítricos (*Panonychus citri*), ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi*), y *Oligonychus spp.*; ácaros etiófidos (*Eriophyidae*), tales como ácaro rosa del pardeamiento de los cítricos (*Aculops pelekassi*), *Phyllocoptruta citri*, ácaro bronceador del tomate (*Aculops lycopersici*), ácaro púrpura del té (*Calacarus carinatus*), ácaro rosado de la herrumbre del té (*Acaphylla theavagran*), y *Eriophyes chibaensis*; ácaros tarosonémidos (*Tarsonemidae*), tales como ácaro ancho (*Polyphagotarsonemus latus*); arañitas falsas (*Tenuipalpidae*), tales como *Brevipalpus phoenicis*; *Tuckerellidae*; garrapatas (*Ixodidae*), tales como *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Dermacentor taiwanicus*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Boophilus microplus*, y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros acáridos (*Acaridae*), tales como ácaro del moho (*Tyrophagus putrescentiae*), y *Tyrophagus similis*; ácaros del polvo domésticos (*Pyroglyphidae*), tales como *Dermatophagoides farinae*, y *Dermatophagoides pteronyssinus*; ácaros queilétidos (*Cheyletidae*), tales como *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis*, y *Cheyletus moorei*; ácaros rojos de las aves de corral, etc.

40

45

50

Aunque la composición para el control de plagas de la presente invención puede ser el compuesto de la presente invención en sí mismo, la composición para el control de plagas de la presente invención contiene normalmente el compuesto de la presente invención como un ingrediente activo y toma forma de una formulación, tal como un concentrado emulsionable, una solución en aceite, un polvo, un gránulo, un polvo humectable, una formulación fluidificable, una formulación en microcápsulas, una formulación en aerosol, un fumigante, un cebo de veneno, o una formulación en resina.

55

60

La formulación contiene habitualmente del 0,01 al 95% en peso del compuesto de la presente invención.

La formulación puede producirse habitualmente mezclando el compuesto de la presente invención con un vehículo inerte, y si fuera necesario, con un tensioactivo u otros auxiliares de formulación.

65

Los ejemplos del transportador inerte incluyen un transportador sólido, un transportador líquido, y un transportador gaseoso.

5 Los ejemplos del transportador sólido incluyen polvo dividido finamente y gránulos de arcilla [por ejemplo, arcilla de caolina, tierra de diatomeas, bentonita, arcilla de agalmatolita (arcilla Fubasami), o arcilla ácida], óxido de silicio hidratado sintético, talco, cerámicas, otros minerales inorgánicos (por ejemplo, sericita, cuarzo, azufre, carbón activado, carbonato cálcico, o silicio hidratado), y fertilizantes químicos (por ejemplo, sulfato amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, cloruro de amonio, o urea).

10 Los ejemplos del vehículo líquido incluyen, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropil alcohol, butanol, hexanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol, fenoxietanol, etc.), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, tolueno, xileno, etilbenceno, dodecilbenceno, fenilxilietano, metilnaftaleno, etc.), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, hexano, ciclohexano, queroseno, gasoleo, etc.), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, acetato de butilo, miristato de isopropilo, oleato de etilo, adipato de diisopropilo, adipato de diisobutilo, mono-metil éter acetato de propileno, etc.), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo, isobutironitrilo, etc.), éteres (por ejemplo, éter diisopropílico, 1,4-dioxano, dimetil éter de etilenglicol, dimetil éter de dietilenglicol, monometil éter de dietilenglicol, monometil éter de propilenglicol, monometil éter de dipropilenglicol, 3-metoxi-3-metil-1-butanol, etc.), amidas de ácidos (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida, etc.), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, diclorometano, tricloroetano, tetracloruro de carbono, etc.), sulfóxidos (por ejemplo, dimetilsulfóxido, etc.), y carbonato de propileno, y aceites vegetales (por ejemplo, aceite de soja, aceite de semilla de algodón, etc.).

25 Los ejemplos del transportador gaseoso incluyen fluorocarbono, gas butano, gas de petróleo licuado (LPG), éter dimetílico, y gas de dióxido de carbono.

Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos no iónicos, tales como alquil éteres de polioxietileno, alquil aril éteres de polioxietileno, y ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; y tensioactivos aniónicos, tales como sales alquil sulfonato, sales alquil-benceno sulfonato, y sales alquil sulfato.

30 Los ejemplos de otros auxiliares de para formulación incluyen un aglutinante, un dispersante, un agente de coloración, y un estabilizador, y los ejemplos específicos de los mismos incluyen caseína, gelatina, sacáridos (por ejemplo, almidón, goma arábiga, derivados de celulosa, ácido algínico, etc.), derivados de lignina, bentonita, polímeros sintéticos solubles en agua (por ejemplo, alcohol polivinílico, polivinil pirrolidona, ácidos poliacrílicos, etc.), PAP (fosfato de ácido isopropílico), BHT (2,6-di-*t*-butil-4-metilfenol), y BHA (una mezcla de 2-*terc*-butil-4-metoxifenol y 3-*terc*-butil-4-metoxifenol).

El procedimiento de control de plagas de la presente invención comprende aplicar una cantidad eficaz del compuesto de la presente invención a una plaga o a un hábitat de una plaga.

40 En el método de control de plagas de la presente invención, puede usarse una formulación del compuesto de la presente invención en lugar de usar el compuesto de la presente invención. La formulación puede aplicarse a una plaga o a un hábitat de una plaga.

45 Los ejemplos de una plaga incluyen arrozales, tierras de cultivo, huertos, tierras no de cultivo, y casas.

La aplicación del compuesto de la presente invención o una formulación del mismo a una plaga o al hábitat de una plaga puede conseguirse por un método convencional siempre y cuando permita que la plaga se ponga en contacto con, o ingiera el compuesto de la presente invención.

50 Los ejemplos del método de aplicación incluyen tratamiento por rociado, tratamiento del suelo, tratamiento de la semilla, y tratamiento del medio de cultivo de agua.

55 El tratamiento por rociado como se usa en el presente documento, significa un método de tratamiento que comprende el tratamiento de la superficie de la planta o de la plaga en sí misma con el ingrediente activo (es decir, el compuesto de la presente invención) para producir un efecto de control sobre la plaga. Los ejemplos específicos del tratamiento de rociado incluyen tratamiento de rociado del follaje, y tratamiento de rociado del tronco del árbol.

60 El tratamiento del suelo es un método de tratamiento que comprende tratar el suelo o un líquido de irrigación con el ingrediente activo con el propósito de permitir que el ingrediente activo impregne y se transfiera al interior del cuerpo de la planta de un cultivo que quiere protegerse de daños, tales como ingestión por una plaga a través de la parte de la raíz o similar de la planta, y proteger por tanto al cultivo del daño por plaga. Los ejemplos específicos de tratamiento del suelo incluyen tratamiento del hoyo de plantación (por ejemplo, rociado en los hoyos de plantación, incorporación de semilla después de tratamiento del hoyo de plantación), tratamiento del pie de planta (por ejemplo, rociamiento del pie de planta, incorporación de semilla después del tratamiento del pie de planta, irrigación en el pie de planta, tratamiento del suelo de la planta en una etapa de crecimiento de la siembra posterior), tratamiento del surco de plantación (por ejemplo, rociamiento del surco de plantación, incorporación al suelo después del tratamiento del surco de plantación),

tratamiento de filas de plantación (por ejemplo, rociamiento de fila de plantación, incorporación al suelo después del tratamiento de filas de plantación, rociamiento de fila de plantación en una etapa de crecimiento), tratamiento de fila de plantación en el momento de la siembra (por ejemplo, rociamiento de la fila de plantación en el momento de la siembra, incorporación al suelo después del tratamiento de la fila de plantación en el momento de la siembra), tratamiento por difusión (por ejemplo, rociamiento global de la superficie del suelo, incorporación global al suelo), otro tratamiento por rociamiento del suelo (por ejemplo, rociamiento de una formulación granular sobre hojas en una etapa de crecimiento, rociamiento bajo una cubierta o alrededor del tronco de un árbol, rociamiento sobre la superficie del suelo, incorporación de suelo a la superficie, rociamiento en hoyos de semillas, rociamiento sobre las superficies o surcos de la tierra, rociamiento entre plantas), otro tratamiento de empapado (por ejemplo, empapado del suelo, empapado en la etapa de aumento de la siembra, tratamiento por inyección química, empapado del pie de la planta, irrigación por goteo químico, quimigación), tratamiento de la caja de cultivo (por ejemplo, rociamiento en una caja de cultivo, irrigación de una caja de cultivo), tratamiento de una bandeja de cultivo (por ejemplo, rociamiento sobre una bandeja de cultivo, irrigación de una bandeja de cultivo), tratamiento de semillero (por ejemplo, rociamiento sobre un semillero, irrigación de un semillero, rociamiento en un vivero de arroz en una vega, inmersión de plántulas), tratamiento por incorporación de suelo a semillero (por ejemplo incorporación de suelo a semillero, incorporación de suelo a semillero antes del sembrado), y otro tratamiento (por ejemplo, incorporación al suelo de cultivo, arado, incorporación al suelo de la superficie, incorporación al suelo en el lugar donde caen gotas desde una cobertura, tratamiento en una posición de plantación, rociamiento de una formulación en gránulos sobre un grupo de flores, incorporación al suelo de una pasta fertilizante).

El tratamiento de las semillas es un método de tratamiento que comprende tratar directamente una semilla, un tubérculo semilla o un bulbo de un cultivo que quiera protegerse del daño, tal como ingestión por una plaga de, o la periferia de, la semilla, tubérculo semilla o bulbo con el ingrediente activo, y por tanto puede producir un efecto de control en una plaga. Los ejemplos específicos del tratamiento de semillas incluyen tratamiento por rociamiento, un tratamiento por embadurnado, un tratamiento por inmersión, un tratamiento por impregnación, un tratamiento por revestimiento, un tratamiento por revestimiento con película, y un tratamiento por revestimiento con microgránulos.

El tratamiento del medio de cultivo de agua es un método de tratamiento que comprende tratar un medio de cultivo de agua o similar con el ingrediente activo con el propósito de permitir que el ingrediente activo impregne y se transfiera al interior del cuerpo de la planta de un cultivo que quiere protegerse de daños, tales como ingestión por una plaga a través de la parte de la raíz o similar de la planta, y proteger por tanto al cultivo del daño por plaga. Los ejemplos específicos de tratamiento del medio de cultivo de agua incluyen el mezclado de un medio de cultivo de agua, y la incorporación en un medio de cultivo de agua.

Cuando el compuesto de la presente invención se usa para el control de plagas en el campo de la agricultura, la cantidad de aplicación del mismo es habitualmente de 1 a 10.000 g por 10.000 m².

Cuando el compuesto de la presente invención se formula en concentrado emulsionable, un polvo humectable o una formulación fluida, la formulación se aplica habitualmente después de diluirse con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención de vuelva de 0,01 a 10.000 ppm. Cuando el compuesto de la presente invención se formula en un gránulo o un polvo, la formulación se aplica normalmente según está.

Dicha formulación o disolución en agua de la misma puede rociarse directamente a una plaga o a una planta, tal como un cultivo que quiera protegerse de una plaga. Alternativamente, el suelo de una tierra cultivada puede tratarse con la formulación o una disolución en agua de la misma para controlar una plaga que habite el suelo.

Una formulación de resina del compuesto de la presente invención puede procesarse para dar una lámina o un cordón. Dicha formulación de resina pueden aplicarse envolviendo un cultivo con una lámina o un cordón de la formulación de resina, poniendo un cordón de la formulación de resina alrededor de un cultivo de manera que el cultivo esté rodeado por el cordón, o colocando una lámina de la formulación de resina sobre la superficie de suelo próxima a la raíz de un cultivo.

Cuando el compuesto de la presente invención se usa para controlar plagas que viven en una casa (por ejemplo, moscas, mosquitos, cucarachas), la cantidad de aplicación del mismo es habitualmente de 0,01 a 1.000 mg por 1 m² en el caso de un tratamiento sobre una superficie plana, y es habitualmente de 0,01 a 500 mg por 1 m³ en caso de tratamiento de un espacio.

Cuando el compuesto de la presente invención se formula en concentrado emulsionable, un polvo humectable o una formulación fluida, la formulación se aplica habitualmente después de diluirse con agua de manera que la concentración del compuesto de la presente invención se vuelve de 0,01 a 1.000 ppm. Cuando el compuesto de la presente invención se formula en una preparación de aceite, una formulación en aerosol, un fumigante o un cebo venenoso, la formulación se aplica normalmente según está.

El compuesto de la presente invención puede usarse como un pesticida para tierras de cultivo, tales como tierras cultivadas, arrozales, césped o huertas, o tierras no de cultivo. El compuesto de la presente invención puede controlar plagas en tierras de cultivo, donde las plantas que incluyen cultivos y similares enumerados a continuación se cultivan

sin provocar daño farmacológico a los cultivos, en algunos casos.

Cultivos agrícolas: maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, sarracina, remolacha azucarera, semilla de colza, girasol, caña de azúcar, tabaco, etc.;

- 5 Vegetales: Vegetales solanaceos (berenjena, tomate, pimiento verde, pimiento picante, patata, etc.), Vegetales cucurbitáceos (pepino, calabaza, calabacín, calabacín, melón etc.), Vegetales crucíferos (rábano Japonés, nabo, rábano picante, colirrábano, col china, col, mostaza marrón, brócoli, coliflor, etc.), Vegetales compuestos (bardana, crisantemo de Garland, alcachofa, lechuga, etc.), Vegetales liliáceos (cebolla Welsh, cebolla, ajo, espárrago, etc.),
 10 Vegetales umbelíferos (zanahoria, perejil, apio, chirivía, etc.), Vegetales quenopodiáceos (espinaca, acelgas, etc.), Vegetales dicotiledóneos (albahaca japonesa, menta, albahaca, etc.), fresa, batata, boniato, aroideos, etc.;

Flores y plantas ornamentales;

- 15 Plantas de follaje;

Árboles frutales: frutas pomáceas (manzana, pera común, pera japonesa, membrillo chino, membrillo, etc.), frutas carnosas con huso (melocotón, ciruela, nectarina, albaricoque japonés, cereza, albaricoque, pasa, etc.), plantas cítricas (mandarina Satsuma, naranja, limón, lima, pomelo, etc.), nueces (castaña, nuez, avellana, almendra, pistacho, nuez de Cajú, nuez de Macadamia, etc.), bayas (arándano negro, arándano rojo, mora, frambuesa, etc.), uva, caqui, oliva, níspero, banana, café, dátil, coco, etc.;

20 Árboles distintos de los frutales: té, mora, árboles y arbustos con flor, árboles de calle (fresno, abedul, cornejo, eucalipto, ginko, lila, arce, roble, álamo, cercis, gomero dulce chino, plátano, zelkova, arbol de la vida japonés, abeto, cicuta japonesa, junípero de aguja, pino, picea, tejo) etc.

30 Las plantas de cultivo antes descritas incluyen plantas de cultivo que tienen resistencia a herbicidas tales como inhibidores de HPPD (por ejemplo, isoxaflutol), inhibidores de ALS (por ejemplo, imazetapir y tifensulfuronmetilo), inhibidores de de enzimas sintetizadoras de EPSP, inhibidores de enzimas sintetizadoras de glutamina, y bromoxinilo, cuya resistencia es impartida por un método de cultivo clásico o una técnica de ingeniería genética.

35 Los ejemplos de plantas de cultivo con resistencia a herbicidas impartida por un método clásico de cultivo incluyen canola Clearfield (marca registrada) resistente a un herbicida imidazolinona tal como imazetapir, y poroto de soja STS resistente a un herbicida sulfonilurea inhibidores de ALS tal como tifensulfuronmetilo.

Los ejemplos de planta de cultivo que tienen resistencia a herbicida impartida por una técnica de ingeniería genética incluyen cultivares de maíz que tienen resistencia a glifosato o glifosinato. Algunos de dichos cultivares de maíz se venden con el nombre comercial de RoundupReady (marca registrada), LibertyLink (marca registrada), y similares.

40 Las plantas de cultivo antes mencionadas incluyen plantas de cultivo que tienen capacidad para producir una toxina insecticida, por ejemplo una toxina selectiva originada de *Bacillus*, cuya capacidad es impartida por una técnica de ingeniería genética.

45 Los ejemplos de toxinas insecticidas producidas en dichas plantas obtenidas por ingeniería genética incluyen proteínas insecticidas derivadas de *Bacillus cereus* y *Bacillus popilliae*; proteínas insecticidas tales como δ -endotoxinas derivadas de *Bacillus turingiensis* (por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 y Cry9C), VIP 1, VIP 2, VIP 3 y VIP 3A; proteínas insecticidas derivadas de nematodos; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpión, toxinas de araña, toxinas de abeja y toxinas nerviosas específicas de insectos; toxinas fúngicas; lectina vegetal; aglutinina; inhibidores de proteasa tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, inhibidores de patatina, cistatina y papaína; proteínas inactivadas de ribosoma (RIP) tales como ricina, RIP de maíz, abrina, saporina, briodina; enzimas metabolizadoras de esteroides tales como 3-hidroxiesteroideoxidasas, ecdiesteroides-UDP-glucosiltransferasa y colesteroloxidasas; inhibidores de ecdisona; HMG-CoA-reductasa; inhibidores de canales iónicos tales como inhibidores de canales de sodio e inhibidores de canales de calcio; hormonaesterasa juvenil; receptores de hormona diurética; estilbenosintasa; bibencilosintasa; quitinasa; y glucanasa.

60 Las toxinas producidas en dichas plantas obtenidas por ingeniería genética también incluyen toxinas híbridas, toxinas parcialmente deficientes y toxinas modificadas de proteínas insecticidas tales como proteínas de δ -endotoxina (por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 y Cry9C), VIP1, VIP2, VIP3, y VIP3A. La toxina híbrida se obtiene al combinar diferentes dominios de las proteínas insecticidas obtenidas por ingeniería genética. Un ejemplo de toxina parcialmente deficiente incluye Cry1Ab en el cual una parte de los aminoácidos está eliminada. Un ejemplo de la toxina modificada incluye una toxina en la cual uno o varios aminoácidos de una toxina que se encuentra en la naturaleza están sustituidos.

65 Los ejemplos de toxina insecticida y de la planta de cultivo obtenida por ingeniería genética que tiene capacidad para producir la toxina insecticida se describen, por ejemplo, en el documento EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO

95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A- 451878, o WO 03/052073.

La planta de cultivo obtenida por ingeniería genética que tiene capacidad para producir la toxina insecticida tiene particularmente resistencia al ataque por una plaga de coleópteros, una plaga de dípteros o una plaga de lepidópteros.

5 También se conocen plantas obtenidas por ingeniería genética que tienen uno o varios genes de resistencia a plagas y así producen una o varias toxinas insecticidas, y algunas de ellas están disponibles en el mercado. Los ejemplos de dichas plantas obtenidas por ingeniería genética incluyen YieldGard (marca registrada) (un cultivar de maíz que expresa la toxina Cry1Ab), YieldGard Rootworm (marca registrada) (un cultivar de maíz que expresa la toxina Cry3Bb1), YieldGard Plus (marca registrada) (un cultivar de maíz que expresa las toxinas Cry1Ab y Cry3Bb1), Herculex I (marca registrada) (un cultivar de maíz que expresa la toxina Cry1Fa2 y fosfinotricin-N-acetiltransferasa (PAT) para impartir resistencia a glufosinato), NuCOTN33B (marca registrada) (un cultivar de algodón que expresa la toxina Cry1Ac), Bollgard I (marca registrada) (cultivar de algodón que expresa la toxina Cry1Ac), Bollgard II (marca registrada) (cultivar de algodón que expresa las toxinas Cry1Ac y Cry2Ab), VIPCOT (marca registrada) (cultivar de algodón que expresa la toxina VIP), NewLeaf (marca registrada) (cultivar de papa que expresa la toxina Cry3A), NatureGard Agrisure GT Advantage (marca registrada) (carácter de resistencia a GA21 glifosato), Agrisure CB Advantage (marca registrada) (carácter de perforador de maíz Bt11 (CB)) y Protecta (marca registrada).

20 Las plantas de cultivo antes descritas incluyen las que tienen capacidad para producir una sustancia antipatogénica, cuya capacidad es impartida por una técnica de ingeniería genética.

25 Los ejemplos de sustancia antipatogénica incluyen proteínas PR (PRP, descritas en el documento EP-A-0 392 225); inhibidores de canales iónicos tales como inhibidores de canales de sodio e inhibidores de canales de calcio (por ejemplo, toxinas KP1, KP4, o KP6 producidas por virus); estilbenosintasa; bibencilosintasa; quitinasa; glucanasa; y sustancias producidas por microorganismos tales como antibióticos peptídicos, antibióticos que contienen heterociclos, y factores proteicos que intervienen en la resistencia a enfermedades vegetales (descritos en el documento WO 03/000906). Dichas sustancias antipatogénicas y las plantas obtenidas por ingeniería genética que producen las sustancias antipatogénicas se describen en los documentos EP-A-0 392 225, WO 05/33818, o EP-A-0 353 191.

30 La composición de control de plagas de la presente invención puede contener otros insecticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, sinergistas, fertilizantes, acondicionantes del suelo, o alimentación animal.

35 El compuesto de la presente invención se puede mezclar con otros insecticidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, agentes fitohormonales, reguladores del crecimiento de plantas, herbicidas, sinergistas, agentes que alivian el daño provocado por los fármacos, pigmentos, fertilizantes, o similares para preparar una formulación mixta, que puede usarse en el tratamiento de pulverización, tratamiento del suelo o tratamiento del medio de cultivo acuoso.

40 Los ejemplos del ingrediente activo de los insecticidas incluyen:

(1) compuestos organofosfóricos:

45 acefato, fosfuro de aluminio, butatiofos, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cianofos:CYAP, diazinona, DCIP(éter diclorodiisopropílico), diclofentona:ECP, diclorvos: DDVP, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, etrinfos, fentiona:MPP, fenitrotona: MEP, fostiazato, formotona, fosfuro de hidrógeno, isofenfos, isoxationa, malationa, mesulfenfos, metidatona:DMTP, monocrotofos, naled:BRP, oxideprofos:ESP, parationa, fosalona, fosmet:PMP, pirimifos-metilo, piridafentona, quinalfos, fentoato:PAP, profenofos, propafos, protiofos, piraclorfos, salitiona, sulprofos, tebupirimfos, temefos, tetraclorvinfos, terbufos, tiometona, triclorfona:DEP, vamidotona, etc.;

(2) compuestos de carbamato:

55 alanicarb, bendiocarb, benfuracarb, BPMC, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxicarb, furatiocarb, isoprocarb:MIPC, metolcarb, metomilo, metiocarb, NAC, oxamilo, pirimicarb, propoxur:PHC, XMC, tiodicarb, xililcarb, etc.;

(3) compuestos piretroides sintéticos:

60 acrinatrina, aletrina, benflutrina, beta-ciflutrina, bifentrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flufenoprox, flumetrina, fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, permetrina, praletrina, piretrinas, resmetrina, sigma-cipermetrina, silafluofeno, teflutrina, tralometrina, transflutrina, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, (EZ)-(1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-prop-1-enilciclopropanocarboxilato de 2,3,5,6-tetrafluoro-4-metilbencilo y (1RS,3RS;1RS,3SR)-2,2-dimetil-3-(2-metil-1-propenil)ciclopropano carboxilato de

2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)bencilo, etc.;

(4) compuestos de nereistoxina:

5 cartap, bensultap, tiociclam, monosultap, bisultap, etc.;

(5) compuestos neonicotinoides:

imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiametoxam, tiacloprid, dinotefurano, clotianidina, etc.;

10

(6) compuestos de benzoilurea:

clorfluzaron, bistrifluron, diafentiuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloخورon), flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron, triflumuron, etc.;

15

(7) compuestos de fenilpirazol:

acetoprol, etiprol, fipronilo, vaniliprol, piriprol, pirafuprol, etc.;

20

(8) insecticidas de toxina Bt:

esporas vivas o toxinas cristalinas originadas de *Bacillus thuringiensis* y una mezcla de las mismas;

25

(9) compuestos de hidrazina:

cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, etc.;

(10) compuestos de organocloro:

30

aldrina, dieldrina, dienocloro, endosulfano, metoxicloro, etc.;

(11) insecticidas naturales:

35

aceite de máquina, sulfato de nicotina, etc.; y

(12) otros insecticidas:

40

avermectina-B, bromopropilato, buprofenzina, clorfenapir, ciromazina, D-D(1,3-Dicloropropeno), benzoato de emamectina, fenazaquina, flupirazofos, hidropreno, indoxacarb, metoxadiazona, milbemicina-A, pimetrozina, piridalilo, piriproxifeno, espinosad, sulfluramida, tolfenpirad, triazamato, flubendiamida, SI-0009, ciflumetofeno, ácido arsénico, benclotiaz, cianamida de calcio, polisulfuro de calcio, clordano, DDT, DSP, flufenerim, flonicamida, flurimfen, formetanato, metam-amonio, metam-sodio, bromuro de metilo, nidinotefurano, oleato potásico, protrifenbute, espiromesifeno, azufre, metaflumizona, espirotetramat, etc.

45

Los ejemplos del ingrediente activo del acaricida incluyen acequinocilo, amitraz, benzoximato, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, CPCBS (clorfenson), clofentezina, celtano (dicofol), etoxazol, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenpiroximato, fluaciriprim, fluproxifeno, hexitiazox, propargita:BPPS, polinactinas, piridabeno, pirimidifeno, tebufenpirad, tetradifona, espirodiclofeno, amidoflumet, bifenazato y ciflumetofeno.

50

Los ejemplos del ingrediente activo del nematocida incluyen DCIP, fostiazato, levamisol, metilisocianato, y tartarato de morantel.

Ejemplos

55

En lo sucesivo en el presente documento, la presente invención se describe en mayor detalle por medio de Ejemplos de Producción, Ejemplos de Formulación y Ejemplos de Ensayo. Sin embargo, la presente invención no se limita a estos Ejemplos.

En primer lugar, se muestran los Ejemplos de Producción del compuesto de la presente invención.

60

Ejemplo de producción 1

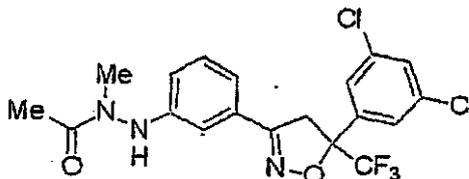
65

A una solución de 1,39 g de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 6 como se describe más adelante y 330 mg de trietilamina en 12 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 257 mg de cloruro de acetilo a 0 °C, seguido de agitación a 0 °C durante 1 hora y después dejando reposar a temperatura ambiente durante 13 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía

Ejemplo de producción 4

A 324 mg del compuesto de la presente invención (3) se le añadieron 5 ml de ácido trifluoroacético a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 30 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 290 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (4)).

10 Compuesto de la presente invención (4)

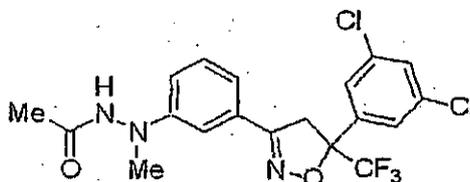


Punto de fusión: 88 °C

15 Ejemplo de producción 5

A una solución de 1,00 g de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 10 como se describe más adelante y 180 mg de trietilamina en 3 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 139 mg de cloruro de acetilo a 0 °C, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 498 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (5)).

25 Compuesto de la presente invención (5)

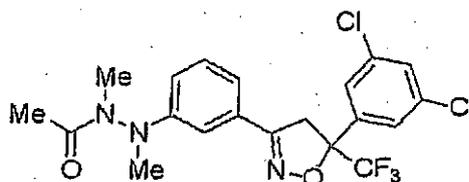


Punto de fusión: 87 °C

30 Ejemplo de producción 6

A una solución de 248 mg del compuesto de la presente invención (5) en 2 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadieron 92 mg de carbonato sódico y 87 mg de yoduro de metilo a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 5 minutos de agitación, se añadieron al mismo 20 ml de *tert*-butil metil éter y se filtró un precipitado. El filtrado se concentró a presión reducida, y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 140 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (6)).

40 Compuesto de la presente invención (6)

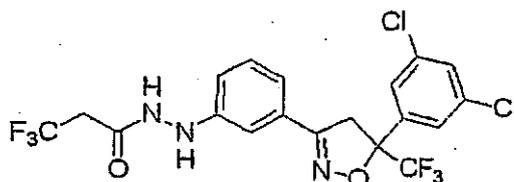


Punto de fusión: 151 °C

Ejemplo de producción 7

A una solución de 1,04 g de un compuesto en bruto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 3 como se describe más adelante 269 mg de trietilamina en 5 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 391 mg de cloruro de 3,3,3-trifluoropropionilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 639 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (7)).

Compuesto de la presente invención (7)

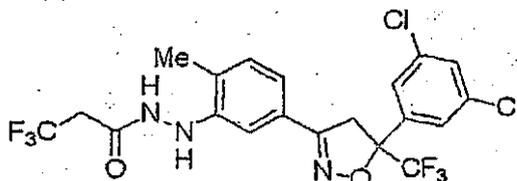


15 Punto de fusión: 75 °C

Ejemplo de producción 8

A una solución de 220 mg de un compuesto en bruto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 14 como se describe más adelante 43 mg de piridina en 2 ml de acetato de etilo se le añadieron gota a gota 80 mg de cloruro de 3,3,3-trifluoropropionilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 162 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (8)).

Compuesto de la presente invención (8)

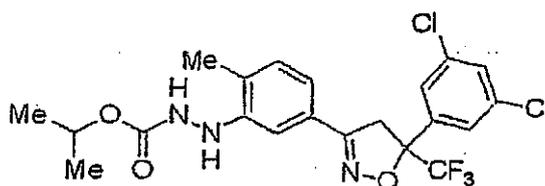


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,01-7,96 (1H, m a), 7,48-7,42 (3H, m), 7,15-7,04 (3H, m), 6,11-6,00 (1H, m), 4,04-4,00 (1H, m), 3,63 (1H, d, J = 17,1 Hz), 3,25-3,19 (2H, m), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de producción 9

A una solución de 220 mg de un compuesto en bruto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 14 como se describe más adelante y 43 mg de piridina en 2 ml de acetato de etilo, se le añadieron gota a gota 80 mg de cloroformiato de isopropilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 127 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (9)).

Compuesto de la presente invención (9)

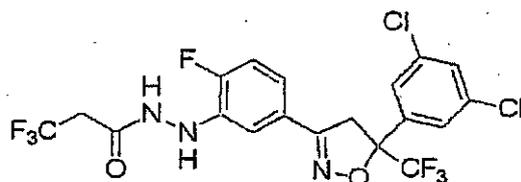


45 Punto de fusión: 71 °C

Ejemplo de producción 10

A una solución de 412 mg de un compuesto en bruto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 18 como se describe más adelante 102 mg de trietilamina en 6 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 148 mg de cloruro de 3,3,3-trifluoropropionilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 4 horas. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 167 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (10)).

Compuesto de la presente invención (10)

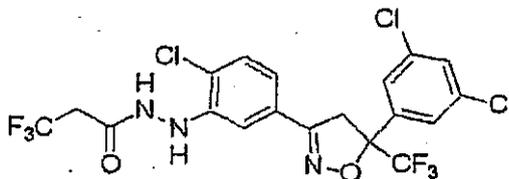


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,89-7,55 (1H, m), 7,46-7,42 (3H, m), 7,28 (1H, dd, J = 7,9, 1,8 Hz), 7,18-7,00 (2H, m), 6,39-6,29 (1H, m), 4,03-3,98 (1H, m), 3,65-3,60 (1H, m), 3,21 (2H, c, J = 10,3 Hz).

Ejemplo de producción 11

A una solución de 510 mg de un compuesto en bruto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante 123 mg de trietilamina en 6 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 179 mg de cloruro de 3,3,3-trifluoropropionilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2,5 horas. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 175 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (11)).

Compuesto de la presente invención (11)

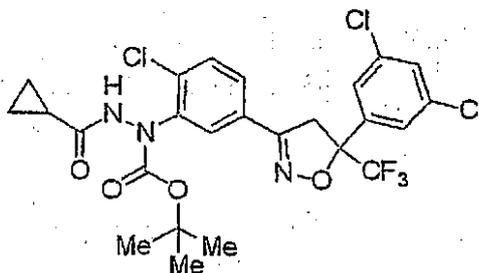


Punto de fusión: 173 °C

Ejemplo de producción 12

A una solución de 110 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 22 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 23 mg de cloruro de ciclopropanocarbonilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 101 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (12)).

Compuesto de la presente invención (12)



Punto de fusión: 180 °C

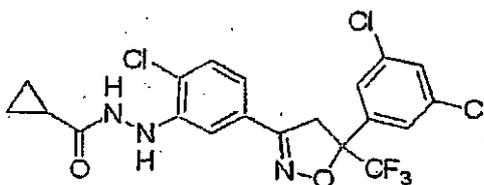
5

Ejemplo de producción 13

A 272 mg del compuesto de la presente invención n(12) se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético as temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavaró con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 214 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (13)).

10

15 Compuesto de la presente invención (13)



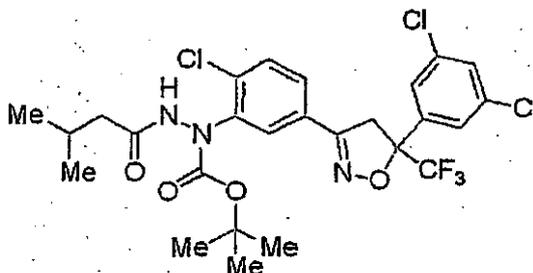
Punto de fusión: 100 °C

20 Ejemplo de producción 14

A una solución de 262 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 61 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 72 mg de cloruro isovalerilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 9 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 280 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (14)).

25

30 Compuesto de la presente invención (14)



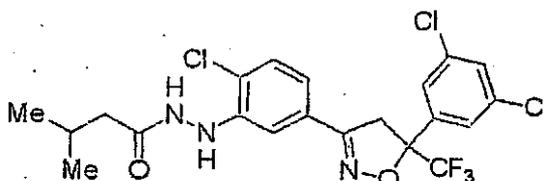
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,82-7,70 (3H, m), 7,48-7,44 (4H, m), 4,08-4,04 (1H, m), 3,71-3,66 (1H, m), 2,18-2,10 (3H, m), 1,45 (9H, d, J = 52,9 Hz), 0,98 (6H, d, J = 6,1 Hz).

35

Ejemplo de producción 15

A 280 mg del compuesto de la presente invención n(14) se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético as temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 222 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (15)).

10 Compuesto de la presente invención (15)



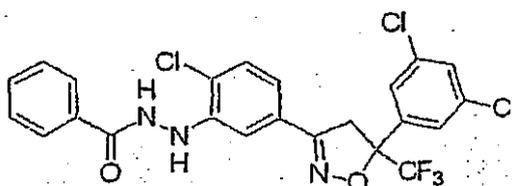
Punto de fusión: 84 °C

15 Ejemplo de producción 16

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 1,5 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 79 mg de cloruro de benzoilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 220 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (16)).

25 Compuesto de la presente invención (16)

25



Punto de fusión: 105 °C

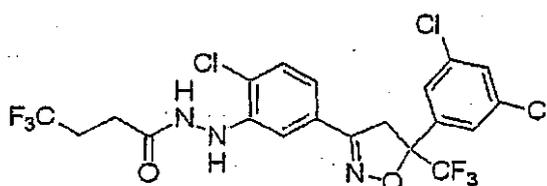
Ejemplo de producción 17

30

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante 57 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 90 mg de cloruro de 4,4,4-trifluorobutirilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 201 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (17)).

35 Compuesto de la presente invención (17)

35



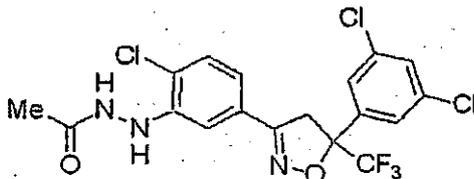
40

Punto de fusión: 82 °C

Ejemplo de producción 18

5 A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 44 mg de cloruro de acetilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 168 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (18)).

10 Compuesto de la presente invención (18)

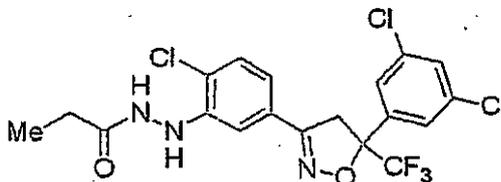


Punto de fusión: 94 °C

15 Ejemplo de producción 19

20 A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 52 mg de cloruro de propionilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 195 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (19)).

25 Compuesto de la presente invención (19)

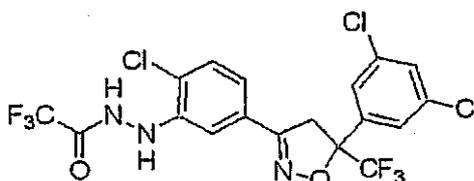


Punto de fusión: 92 °C

30 Ejemplo de producción 20

35 A una solución de 260 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 60 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 150 mg de anhídrido trifluoroacético a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 175 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (20)).

Compuesto de la presente invención (20)

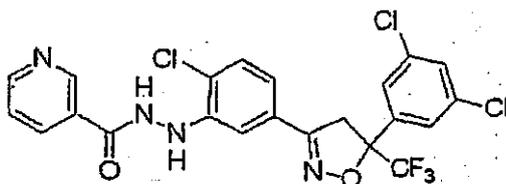


40 Punto de fusión: 64 °C

Ejemplo de producción 21

5 A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 95 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 84 mg de clorhidrato de cloruro de nicotinoilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concntró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 198 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (21)).

10 Compuesto de la presente invención (21)



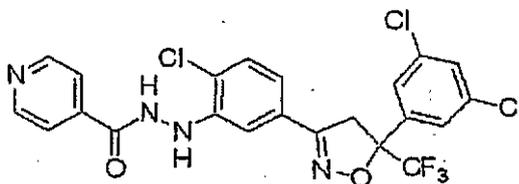
Punto de fusión: 205 °C

15 Ejemplo de producción 22

20 A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 95 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 84 mg de clorhidrato de cloruro de isonicotinoilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concntró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 169 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (22)).

25 Compuesto de la presente invención (22)

25

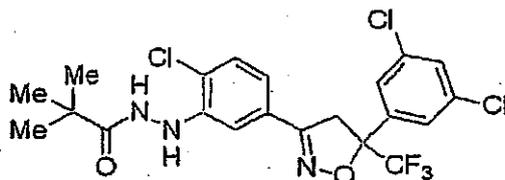


Punto de fusión: 115 °C

Ejemplo de producción 23

30 A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 52 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 62 mg de cloruro de pivaloilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concntró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 198 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (23)).

35 Compuesto de la presente invención (23)



40

Punto de fusión: 106 °C

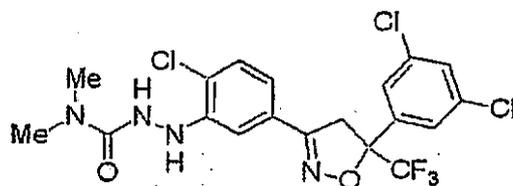
Ejemplo de producción 24

45 A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 67 mg de cloruro de

dimetilcarbamato a 0 °C, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 70 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (24)).

5

Compuesto de la presente invención (24)



Punto de fusión: 212 °C

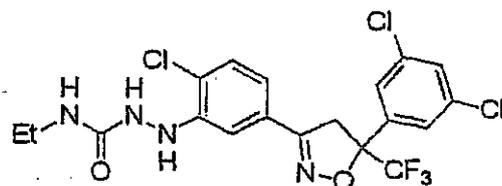
10

Ejemplo de producción 25

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 51 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 37 mg de isocianato de etilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 149 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (25)).

15

20 Compuesto de la presente invención (25)



Punto de fusión: 102 °C

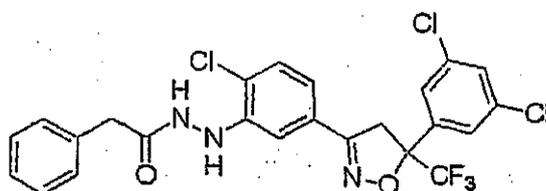
Ejemplo de producción 26

25

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 79 mg de cloruro de fenilacetilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 211 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (26)).

30

Compuesto de la presente invención (26)



35 Punto de fusión: 173 °C

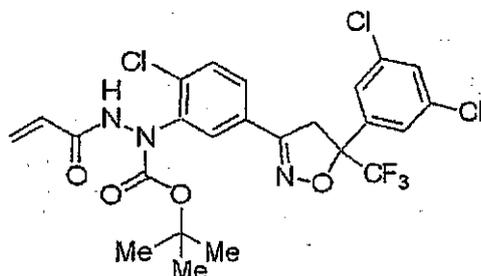
Ejemplo de producción 27

A una solución de 500 mg de un compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante 122 mg de ácido acrílico en 2 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadieron 319 mg de clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil) carbodiimida a temperatura ambiente, seguido a agitación durante 3 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 384 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado

40

el compuesto de la presente invención (27)).

Compuesto de la presente invención (27)

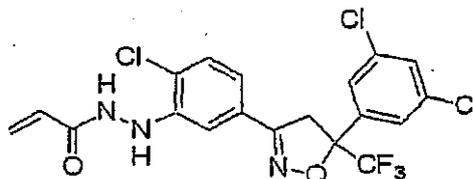


5 Punto de fusión: 119 °C

Ejemplo de producción 28

10 A 309 mg del compuesto obtenido por el Ejemplo de producción 27 se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 238 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (28)).

Compuesto de la presente invención (28)

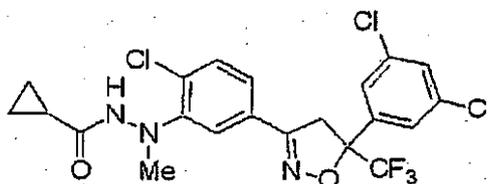


20 Punto de fusión: 90 °C

Ejemplo de producción 29

25 A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 28 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 2,0 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 58 mg de cloruro de ciclopropanocarbonilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 30 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 225 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (29)).

30 Compuesto de la presente invención (29)



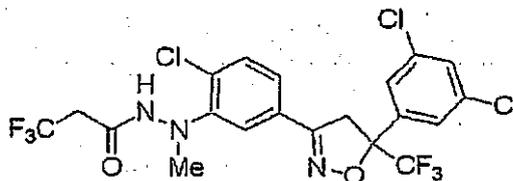
35 Punto de fusión: 176 °C

Ejemplo de producción 30

40 A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 28 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 2,0 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 81 mg de cloruro de 3,3,3-trifluoropropionilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 30 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 241 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (30)).

45

Compuesto de la presente invención (30)



Punto de fusión: 81 °C

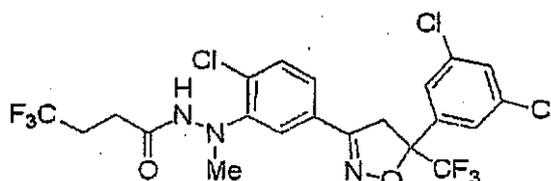
5

Ejemplo de producción 31

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 28 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 2,0 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 88 mg de cloruro de 4,4,4-trifluorobutirilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 258 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (31)).

10

15 Compuesto de la presente invención (31)



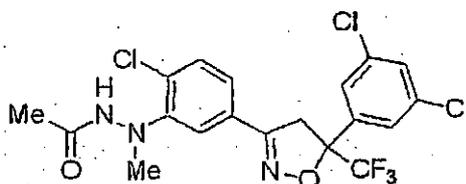
Punto de fusión: 77 °C

20 Ejemplo de producción 32

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 28 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 2,0 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 43 mg de cloruro de acetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 204 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (32)).

25

Compuesto de la presente invención (32)



30

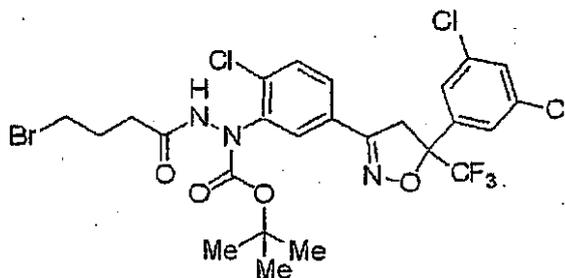
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,88-7,24 (7H, m), 4,09-4,04 (1H, m), 3,70-3,66 (1H, m), 3,29-3,07 (3H, m), 2,17-1,91 (3H, m).

Ejemplo de producción 33

A una solución de 525 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 121 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 223 mg de cloruro de 4-bromobutirilo a temperatura ambiente, seguido a agitación durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 699 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (33)).

40

Compuesto de la presente invención (33)



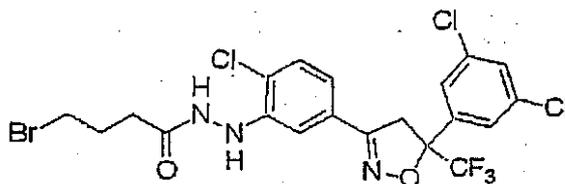
Ejemplo de producción 34

5

A 309 mg del compuesto de la presente invención (33) se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 573 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (34)).

10

Compuesto de la presente invención (34)



15

Punto de fusión: 59 °C

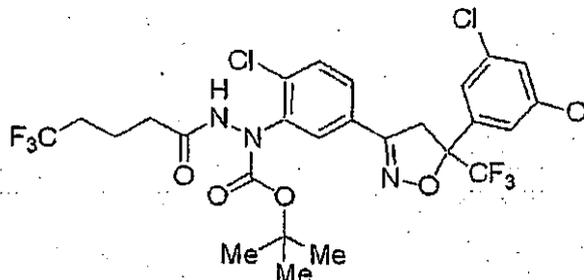
Ejemplo de producción 35

20

A una solución de 350 mg de un compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 187 mg de ácido 5,5,5-trifluoropentanoico en 2 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 153 mg de clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimida a temperatura ambiente, seguido a agitación durante 3 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 350 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (35)).

25

Compuesto de la presente invención (35)



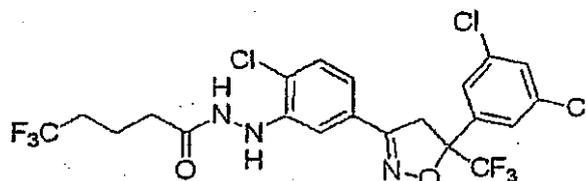
30

Ejemplo de producción 36

A 350 mg del compuesto de la presente invención n(35) se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético as temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 269 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (36)).

35

Compuesto de la presente invención (36)



Punto de fusión: 163 °C

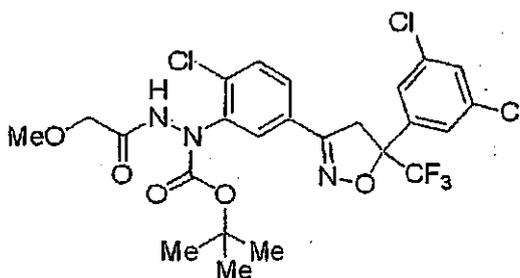
5

Ejemplo de producción 37

A una solución de 367 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 84 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 91 mg de cloruro de metoxiacetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodico anhidro, y después se concentró a presión reducida para obtener 377 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (37)).

10

15 Compuesto de la presente invención (37)

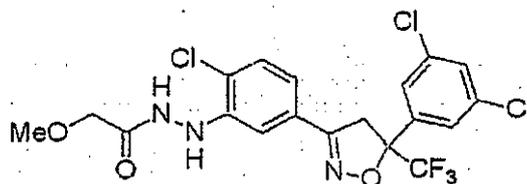


Ejemplo de producción 38

20 A 309 mg del compuesto en bruto de la presente invención (37) se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 27,6 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (38)).

25

Compuesto de la presente invención (38)



30 Punto de fusión: 178 °C

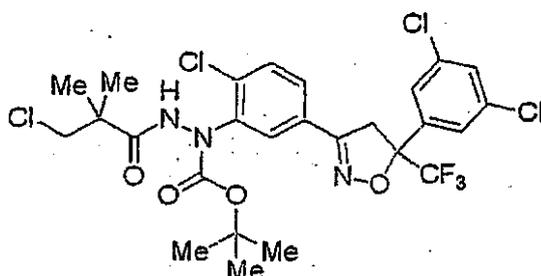
Ejemplo de producción 39

A una solución de 524 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 121 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 186 mg de cloruro de 4-cloropivaloilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo. La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodico anhidro, y después se concentró a presión reducida para obtener 643 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (39)).

35

40

Compuesto de la presente invención (39)



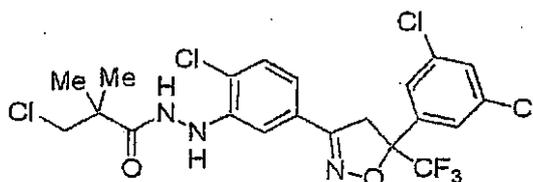
Ejemplo de producción 40

5

A 643 mg del compuesto en bruto de la presente invención (39) se le añadieron 5 ml de ácido trifluoroacético, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida para obtener 520 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (40)).

10

Compuesto de la presente invención (40)



15

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,68 (1H, d, J = 3,2 Hz), 7,47 (2H, d, J = 1,7 Hz), 7,42 (1H, t, J = 2,0 Hz), 7,32 (1H, d, J = 8,3 Hz), 7,26 (1H, d, J = 1,5 Hz), 7,06 (1H, dd, J = 8,2, 2,1 Hz), 6,45 (1H, d, J = 3,2 Hz), 4,00 (1H, d, J = 17,6 Hz), 3,68 (2H, s), 3,63 (1H, d, J = 17,6 Hz), 1,42 (3H, s), 1,41 (3H, s).

20

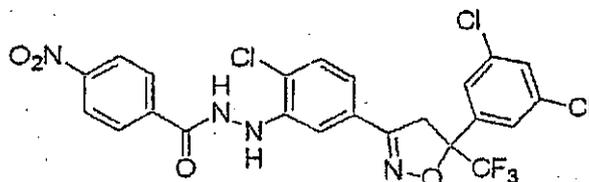
Ejemplo de producción 41

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 56 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 103 mg de cloruro de 4-nitrobenzoílo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 10 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 166 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (41)).

25

Compuesto de la presente invención (41)

30



Punto de fusión: 173 °C

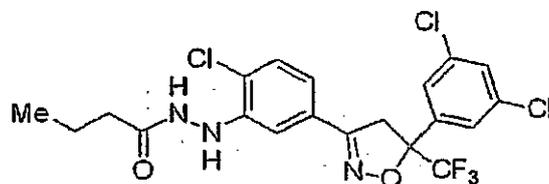
Ejemplo de producción 42

35

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 50 mg de cloruro de butirilo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 20 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 121 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (42)).

40

Compuesto de la presente invención (42)



Punto de fusión: 82 °C

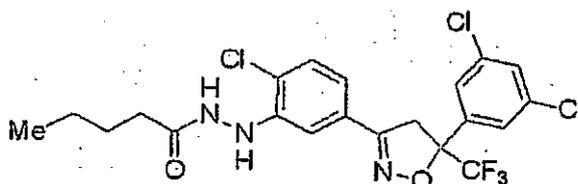
5

Ejemplo de producción 43

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 57 mg de cloruro de pentanoílo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 164 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (43)).

10

15 Compuesto de la presente invención (43)



Punto de fusión: 89 °C

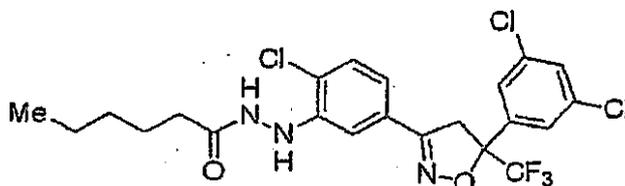
20 Ejemplo de producción 44

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 63 mg de cloruro de hexanoílo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 20 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 134 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (44)).

25

30 Compuesto de la presente invención (44)

30



Punto de fusión: 80 °C

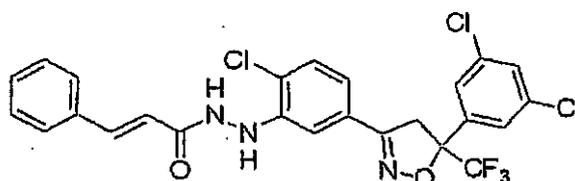
Ejemplo de producción 45

35

A una solución de 200 mg de un compuesto en bruto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante y 57 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 78 mg de cloruro de cinnamoílo a 0 °C, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 20 minutos. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 161 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (45)).

40

Compuesto de la presente invención (45)



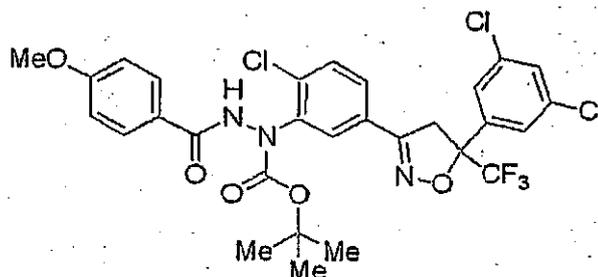
Punto de fusión: 205 °C

5

Ejemplo de producción 46

A una solución de 247 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 23 como se describe más adelante y 56 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 95 mg de cloruro de 4-metoxibenzoilo a temperatura ambiente, seguido a agitación durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo. La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida para obtener 240 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (46)).

15 Compuesto de la presente invención (46)



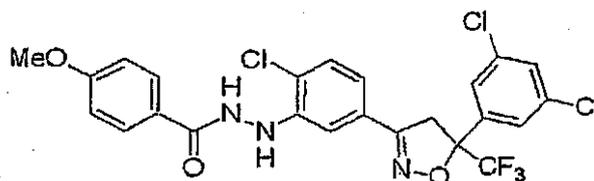
Ejemplo de producción 47

20 A 240 mg del compuesto de la presente invención (46) se le añadieron 2 ml de ácido trifluoroacético, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 1 hora.

La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadió acetato de etilo al residuo. La fase orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida para obtener 221 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado como el compuesto de la presente invención (47)).

25

Compuesto de la presente invención (47)



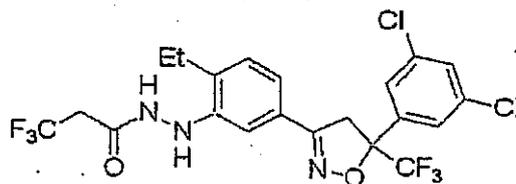
30 Punto de fusión: 131 °C

Ejemplo de producción 48

35 A una solución de 1,31 g de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 31 como se describe más adelante y 200 mg de trietilamina en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 290 mg de cloruro de 3,3,3-trifluoropropionilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 426 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (48)).

40

Compuesto de la presente invención (48)



Punto de fusión: 138,7 °C

5

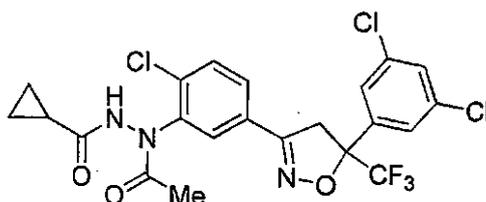
Ejemplo de producción 49

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 33 como se describe más adelante y 65 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 54 mg de cloruro de ciclopropanocarbonilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 216 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (49)).

10

15

Compuesto de la presente invención (49).



Punto de fusión: 160 °C

20

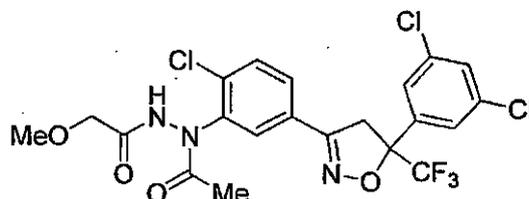
Ejemplo de producción 50

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 33 como se describe más adelante y 65 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 55 mg de cloruro de metoxiacetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 130 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (50)).

25

30

Compuesto de la presente invención (50)



Punto de fusión: 164 °C

35

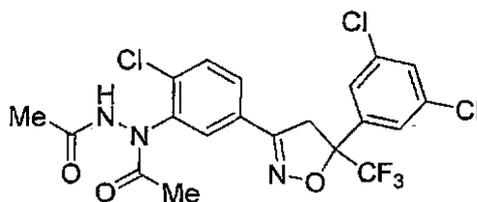
Ejemplo de producción 51

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 33 como se describe más adelante y 65 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 40 mg de cloruro de acetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sodico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 140 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de

40

la presente invención (51)).

Compuesto de la presente invención (51)

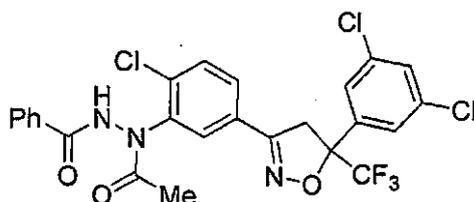


5 Punto de fusión: 173 °C

Ejemplo de producción 52

- 10 A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 33 como se describe más adelante y 65 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 72 mg de cloruro de benzoilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para
- 15 obtener 281 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (52)).

Compuesto de la presente invención (52)

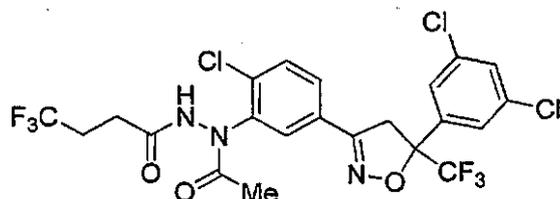


20 Punto de fusión: 107 °C

Ejemplo de producción 53

- 25 A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 33 como se describe más adelante y 65 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 90 mg de cloruro de 4,4,4-trifluorobutirilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 207 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el
- 30 compuesto de la presente invención (53)).

Compuesto de la presente invención (53)



35 Punto de fusión: 117 °C

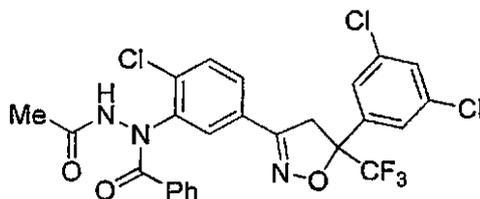
Ejemplo de producción 54

- 40 A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 35 como se describe más adelante y 58 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 38 mg de cloruro de acetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para

obtener 156 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (54)).

Compuesto de la presente invención (54)

5



Punto de fusión: 172 °C

Ejemplo de producción 55

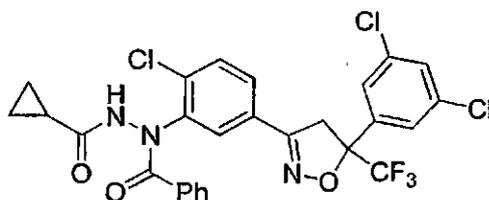
10

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 35 como se describe más adelante y 51 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 54 mg de cloruro de ciclopropanocarbonilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 103 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (55)).

15

Compuesto de la presente invención (55)

20



Punto de fusión: 157 °C

Ejemplo de producción 56

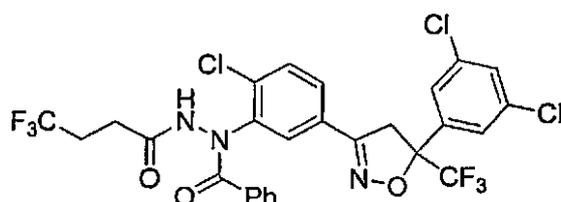
25

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 35 como se describe más adelante y 65 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 78 mg de cloruro de 4,4,4-trifluorobutirilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 211 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (56)).

30

Compuesto de la presente invención (56)

35



Punto de fusión: 173 °C

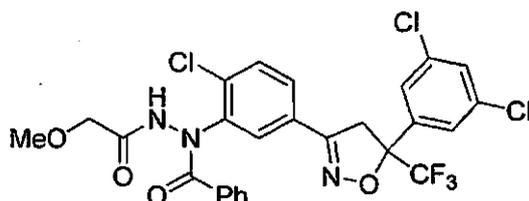
Ejemplo de producción 57

40

A una solución de 300 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 35 como se describe más adelante y 85 mg de trietilamina en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 79 mg de cloruro de metoxiacetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica, se lavó con agua, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y

después se concentró a presión reducida. EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 297 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (57)).

5 Compuesto de la presente invención (57)



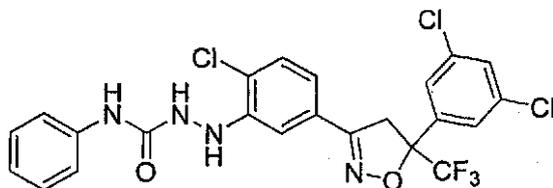
Punto de fusión: 92 °C

10 Ejemplo de producción 58

A una solución de 241 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante en 2 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 82 mg de cloruro de acetilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 187 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (58)).

20 Compuesto de la presente invención (58)

20



Punto de fusión: 131 °C

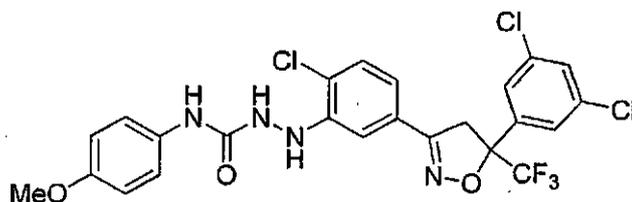
Ejemplo de producción 59

25

A una solución de 200 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante en 6 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 85 mg de isocianato de 4-metoxifenilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 191 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (59)).

30 Compuesto de la presente invención (59)

35



Punto de fusión: 131 °C

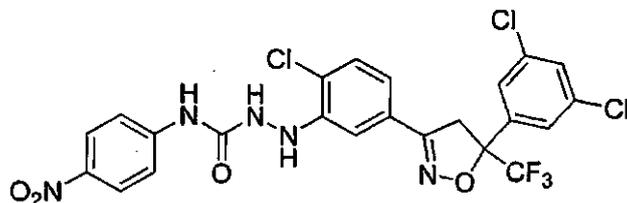
Ejemplo de producción 60

40

A una solución de 196 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante en 5 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 136 mg de isocianato de 4-nitrofenilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 110 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (60)).

45

Compuesto de la presente invención (60)



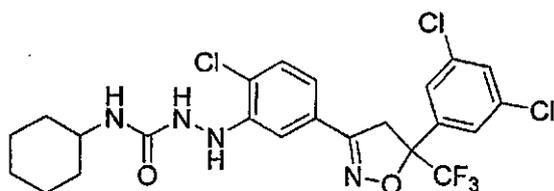
Punto de fusión: 201 °C

5

Ejemplo de producción 61

A una solución de 220 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante en 6 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 79 mg de isocianato de diclohexilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 100 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (61)).

15 Compuesto de la presente invención (61)

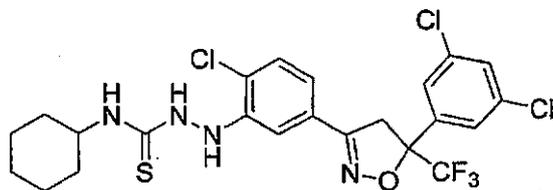


Punto de fusión: 101 °C

20 Ejemplo de producción 62

A una solución de 340 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante en 6 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 173 mg de isotiocianato de ciclohexilo a temperatura ambiente, seguido de agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 135 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (62)).

30 Compuesto de la presente invención (62)



Punto de fusión: 126 °C

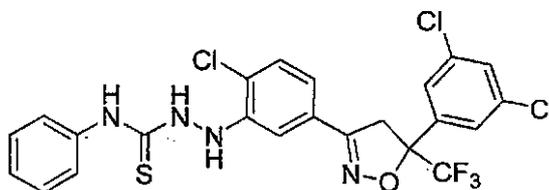
Ejemplo de producción 63

35

A una solución de 240 mg de un compuesto en obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 21 como se describe más adelante en 6 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 114 mg de isotiocianato de fenilo a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, EL residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 200 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula (en lo sucesivo denominado el compuesto de la presente invención (63)).

40

Compuesto de la presente invención (63)



Punto de fusión: 213 °C

5

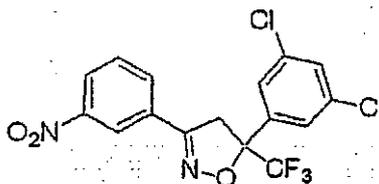
A continuación, se muestran intermedios de producción para producir el compuesto de la presente invención en forma de Ejemplos de producción de referencia.

Ejemplo de producción de referencia 1

10

A una solución de 249 mg de 3-nitrobenzaldoxima en 15 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadieron 201 mg de *N*-clorosuccinimida a temperatura ambiente, seguido de agitación a 60 °C durante 1 hora. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a la misma se le añadieron 362 mg de 2-(3,5-diclorofenil)-3,3,3-trifluoro-1-propeno y después 152 mg de trietilamina, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 6 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 232 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

15



20

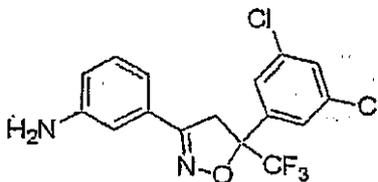
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,43 (1H, s a), 8,34-8,32 (1H, m), 8,10 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,67-7,65 (1H, m), 7,52 (2H, s), 7,45-7,45 (1H, m), 4,14 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,76 (1H, d, J = 17,3 Hz).

Ejemplo de producción de referencia 2

25

A 1 ml de una solución acuosa al 2,5% de ácido acético se le añadieron 192 mg de polvo de hierro (malla 10 a 20). A la misma se le añadieron una suspensión de 232 mg del compuesto preparado en el Ejemplo de Producción de Referencia en 1,5 ml de etanol a 75 °C, seguido a agitación a la misma temperatura durante 15 minutos. Se le añadieron 300 mg más de polvo de hierro, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se filtró, y después se lavó con acetato de etilo. El filtrado se extrajo añadiendo agua y acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 198 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

30



35

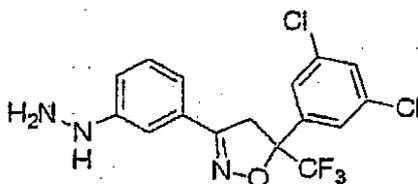
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51 (2H, s a), 7,42 (1H, t, J = 1,9 Hz), 7,20 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,04 (1H, t, J = 1,9 Hz), 6,95-6,93 (1H, m), 6,77-6,75 (1H, m), 4,05 (1H, d, J = 17,1 Hz), 3,77 (2H, s a), 3,66 (1H, d, J = 17,1 Hz).

Ejemplo de producción de referencia 3

40

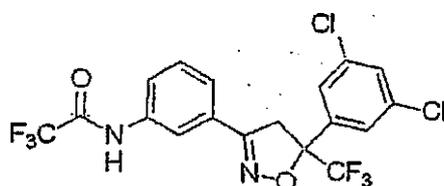
A una solución 1,0 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 2 en 4 ml de 1,4-dioxano se le añadieron 7 ml de ácido clorhídrico concentrado a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 20 minutos, la solución se enfrió a 0 °C y se le añadió gota a gota una solución de 184 mg de nitrito sódico en 4 ml de agua. Después de agitar a la misma temperatura durante 15 minutos, a la solución de reacción se le añadió gota a gota una solución de 1,11 g de cloruro de estaño (II) en 2 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción se neutralizó mediante la adición de hidróxido sódico 2 N y después la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 1,0 g de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.

45



Ejemplo de producción de referencia 4

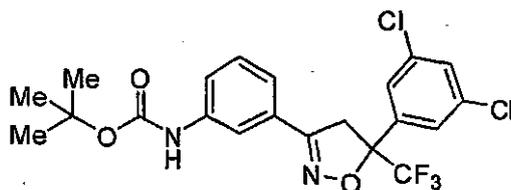
- 5 A una solución de 3,0 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 2 y 971 mg de trietilamina en 20 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 1,85 g de anhídrido trifluoroacético a 0 °C. Después de agitar a la misma temperatura durante 15 minutos, se le añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 3,84 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



- 10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,02 (1H, s a), 7,94 (1H, t, J = 1,8 Hz), 7,66-7,64 (1H, m), 7,57-7,55 (1H, m), 7,49-7,43 (4H, m), 4,09 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,71 (1H, d, J = 17,3 Hz).

Ejemplo de producción de referencia 5

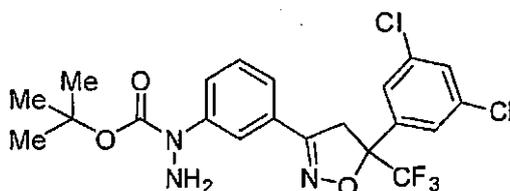
- 15 A una solución de 3,84 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 4 y 8,21 g de dicarboxilato de di-*terc*-butilo en 20 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 195 mg de 4-dimetilpiridina a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1,5 horas. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, La fase orgánica se lavó con ácido clorhídrico 2 N y después una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato de sódico anhidro, y después se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en 20 ml de metanol. A la solución se le añadieron 10 ml de agua y 2,76 g de carbonato sódico a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 2 horas. Se añadió agua a la mezcla, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 3,5 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, s), 7,51 (2H, s), 7,42-7,39 (2H, m), 7,35-7,31 (2H, m), 6,55 (1H, s a), 4,11 (1H, d, J = 16,9 Hz), 3,70 (1H, d, J = 16,9 Hz), 1,53 (9H, s).

Ejemplo de producción de referencia 6

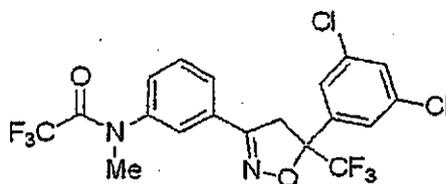
- 30 A un solución de 3,50 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 5 en 22 ml de *terc*-butil metil éter se le añadieron 23 ml de una solución acuosa al 28% de hidróxido sódico, 7 ml de agua de amoniaco, 2,56 g de cloruro de amonio y 100 mg de cloruro de trioctilmetilamonio. A la mezcla se le añadieron gota a gota 53 ml de una solución acuosa al 5% de hipoclorito sódico a temperatura ambiente durante 20 minutos. Después de agitar a la misma temperatura durante 12 horas, la fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo de nuevo con *terc*-butil metil éter. Las fases orgánicas se combinaron, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 1,52 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,87 (1H, s), 7,72-7,29 (6H, m), 4,42 (2H, s a), 4,09 (1H, d, $J = 17,2$ Hz), 3,69 (1H, d, $J = 17,2$ Hz), 1,53 (9H, s).

5 Ejemplo de producción de referencia 7

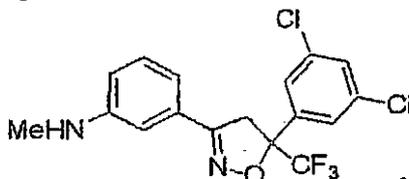
A una solución de 3,71 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 4 y 1,34 g de yoduro de metilo en 20 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadieron 1,31 g de carbonato sódico a temperatura ambiente. La mezcla se agitó a la misma temperatura durante 12 horas. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, seguido de lavado con ácido clorhídrico 2 N y después una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 3,70 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,69-7,35 (7H, m), 4,09 (1H, d, $J = 17,3$ Hz), 3,71 (1H, d, $J = 17,3$ Hz), 3,46-3,43 (3H, m).

Ejemplo de producción de referencia 8

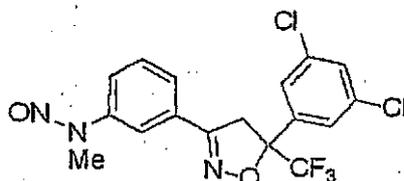
A una solución de 3,52 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 7 en 15 ml de metanol se le añadieron 2,00 g de carbonato sódico y 5 ml de agua a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 2 horas, se le añadió acetato de etilo y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 2% y después una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 2,80 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



25 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,51 (2H, d, $J = 1,2$ Hz), 7,41 (1H, t, $J = 1,8$ Hz), 7,21 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 6,95 (1H, t, $J = 2,0$ Hz), 6,87 (1H, ddd, $J = 7,6, 1,5, 1,0$ Hz), 6,69 (1H, ddd, $J = 8,3, 2,4, 0,7$ Hz), 4,07 (1H, d, $J = 17,3$ Hz), 3,85 (1H, s a), 3,67 (1H, d, $J = 17,3$ Hz), 2,86 (3H, s).

30 Ejemplo de producción de referencia 9

A una solución de 2,6 g de del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 8 en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 1,5 ml de ácido clorhídrico concentrado y 3,0 ml de agua a temperatura ambiente. Después de agitar a temperatura ambiente durante 15 minutos, a la mezcla se le añadió gota a gota una solución de 581 mg de nitrito sódico en 5 ml de agua a 0 °C. Después de agitar a la misma temperatura durante 1 hora, se le añadió una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 2,78 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

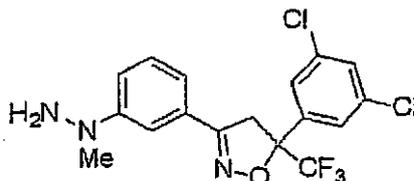


40

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,89-7,88 (1H, m), 7,67-7,64 (2H, m), 7,56-7,53 (3H, m), 7,43-7,43 (1H, m), 4,14 (1H, d, $J = 17,4$ Hz), 3,76 (1H, d, $J = 17,4$ Hz), 3,47 (3H, s).

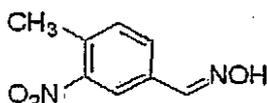
Ejemplo de producción de referencia 10

- 5 A una mezcla de 1,00 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 9, 2 ml de etanol, 2 ml de agua y 2 ml de ácido acético se le añadieron 695 mg de cinc a temperatura ambiente. Después de agitar a temperatura ambiente durante 5 horas, la mezcla se filtró. Al filtrado se le añadió hidrogenocarbonato sódico anhidro, seguido de extracción con cloroformo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 1,1 g de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.



Ejemplo de producción de referencia 11

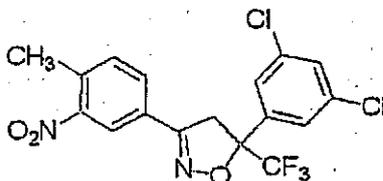
- 15 A una mezcla de 3,00 g de 4-metil-3-nitrobenzaldehído, 1,64 g de clorhidrato de hidroxilamina, 30 ml de etanol y 15 ml de agua se le añadieron 2,24 g de acetato sódico a temperatura ambiente, seguido a agitación a temperatura ambiente durante 1 hora. La mezcla de reacción se añadió a agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 2,77 g de 5-hidroxiiminometil-2-metilnitrobenzoceno. 5-Hidroxiiminometil-2-metilnitrobenzoceno



RMN ^1H (DMSO-d_6) δ : 11,53 (1H, s), 8,24 (1H, s), 8,17 (1H, d, $J = 1,7$ Hz), 7,84 (1H, dd, $J = 8,0, 1,7$ Hz), 7,54 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 2,52 (3H, s).

25 Ejemplo de producción de referencia 12

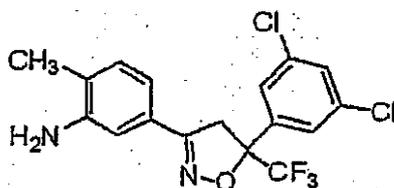
- Una solución de 2,77 g de 5-hidroxiiminometil-2-metilnitrobenzoceno obtenida en el Ejemplo de producción de referencia 11 y 2,06 g de N-clorosuccinimida en 30 ml de N,N-dimetilformamida se agitó a 50 °C durante 1 hora. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y se le añadieron 3,71 g de 2-(3,5-diclorofenil)-3,3,3-trifluoro-1-propeno y 1,56 g de trietilamina. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 4,99 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,16 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,90 (1H, dd, $J = 8,1, 1,9$ Hz), 7,51 (2H, d, $J = 1,2$ Hz), 7,45-7,43 (2H, m), 4,11 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 3,73 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 2,66 (3H, s).

Ejemplo de producción de referencia 13

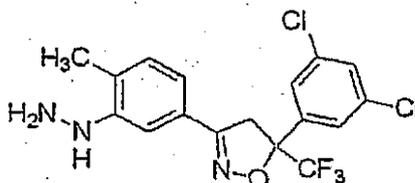
- 40 A 19 ml de una solución acuosa al 2,5% de ácido acético se le añadieron 1,89 g de polvo de hierro (malla 10 a 20). A la misma se le añadieron una suspensión de 4,62 g del compuesto preparado en el Ejemplo de Producción de Referencia 12 en 29 ml de etanol a 75 °C, seguido a agitación a la misma temperatura durante 15 minutos. Se le añadieron 1,80 g más de polvo de hierro a la misma temperatura, seguido a agitación a la misma temperatura durante 1 hora. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se filtró y después se lavó con acetato de etilo. El filtrado se extrajo añadiendo una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 3,18 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,51 (2H, d, $J = 1,4$ Hz), 7,41 (1H, t, $J = 1,8$ Hz), 7,08 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,05 (1H, d, $J = 1,8$ Hz), 6,88 (1H, dd, $J = 7,8, 1,7$ Hz), 4,04 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 3,71 (2H, s a), 3,65 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 2,19 (3H, s).

5 Ejemplo de producción de referencia 14

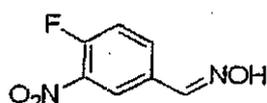
A 420 mg del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 13 se le añadieron 2 ml de ácido clorhídrico concentrado a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 20 minutos. la solución se enfrió a 0°C y se le añadió gota a gota una solución de 82 mg de nitrito sódico en 0,5 ml de agua. Después de agitar a la misma temperatura durante 10 minutos. a la solución de reacción se le añadió gota a gota una solución de 451 mg de cloruro de estaño (II) en 0,5 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción se neutralizó mediante la adición de una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 420 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.



15

Ejemplo de producción de referencia 15

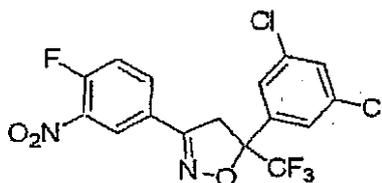
A una mezcla de 20 ml de etanol y 10 ml de agua se le añadieron 2 g de 4-fluoro-3-nitrobenzaldehído, 1,07 g de clorhidrato de hidroxilamina y 1,45 g de acetato sódico. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 6 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 1,95 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



25 RMN ^1H ($\text{DMSO}-D_6$) δ : 11,63 (1H, s), 8,34 (1H, dd, $J = 7,2, 2,2$ Hz), 8,28 (1H, s), 8,04-8,02 (1H, m), 7,65-7,62 (1H, m).

Ejemplo de producción de referencia 16

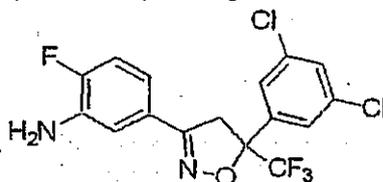
Una solución de 1,95 del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 15 y 1,42 g de N-clorosuccinimida en 20 ml de dimetilformamida se agitó a 60°C durante 1 hora. Los solución mixta de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y se le añadieron 2,55 g de 2-(3,5-diclorofenil)-3,3,3-trifluoro-1-propeno y después 1,07 g de trietilamina, seguido a agitación a la misma temperatura durante 6 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 1,40 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



40 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,26 (1H, dd, $J = 6,9, 2,3$ Hz), 8,08-8,05 (1H, m), 7,51 (2H, d, $J = 1,2$ Hz), 7,45 (1H, t, $J = 1,9$ Hz), 7,41 (1H, dd, $J = 10,1, 8,7$ Hz), 4,11 (1H, d, $J = 17,4$ Hz), 3,73 (1H, d, $J = 17,9$ Hz).

Ejemplo de producción de referencia 17

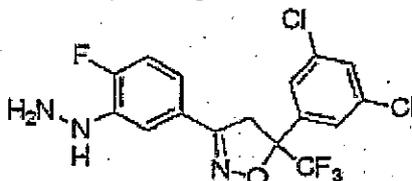
5 A una solución de 0,2 g de ácido acético en 7 ml de agua se le añadieron 1,85 g de polvo de hierro a temperatura ambiente. A la mezcla se le añadió una suspensión de 1,40 g del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 16 en 15 ml de etanol a 75 °C, seguido de agitación a 75 °C durante 20 minutos. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 806 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50 (2H, d, J = 1,4 Hz), 7,42 (1H, t, J = 1,8 Hz), 7,18 (1H, dd, J = 8,5, 2,2 Hz), 7,01 (1H, dd, J = 10,6, 8,5 Hz), 6,90-6,87 (1H, m), 4,03 (1H, d, J = 17,0 Hz), 3,85 (2H, s a), 3,64 (1H, d, J = 17,0 Hz).

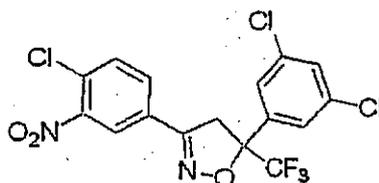
Ejemplo de producción de referencia 18

15 A una solución 500 mg del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 17 en 4 ml de 1,4-dioxano se le añadieron 4 ml de ácido clorhídrico concentrado a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 20 minutos, la solución se enfrió a 0 °C y se le añadió gota a gota una solución de 96 mg de nitrito sódico en 5 ml de agua. Después de agitar a la misma temperatura durante 15 minutos, a la solución de reacción se le añadió gota a gota una solución de 528 mg de cloruro de estaño (II) en 1 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción se neutralizó mediante la adición de hidróxido sódico 2 N. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 412 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.



Ejemplo de producción de referencia 19

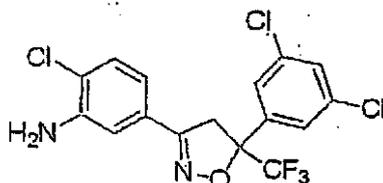
25 Una solución de 2,92 g de 2-cloro-5-hidroxiiminometilnitrobeneno y 1,94 g de N-clorosuccinimida en 30 ml de dimetilformamida se agitó a 60 °C durante 1 hora. Después de enfriarse la solución a temperatura ambiente, se le añadieron 3,50 g de 2-(3,5-diclorofenil)-3,3,3-trifluoro-1-propeno y después 1,46 g de trietilamina, seguido a agitación durante 6 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 4,42 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,09 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,89 (1H, dd, J = 8,5, 2,1 Hz), 7,65 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,50 (2H, d, J = 1,6 Hz), 7,45 (1H, t, J = 1,6 Hz), 4,09 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,71 (1H, d, J = 17,3 Hz).

Ejemplo de producción de referencia 20

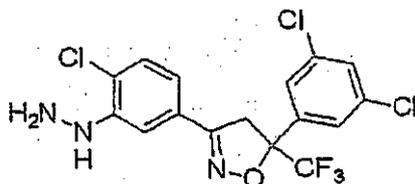
40 A una mezcla de 0,38 g de ácido acético, 15 ml de agua y 30 ml de etanol se le añadieron 3,46 g de polvo de hierro a temperatura ambiente, y a esto se le añadieron 2,73 g del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 19 a 75 °C, seguido de agitación a 75 °C durante 50 minutos. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 1,65 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49 (2H, d, J = 1,7 Hz), 7,42 (1H, t, J = 1,7 Hz), 7,29 (1H, d, J = 8,4 Hz), 7,13 (1H, d, J = 2,0 Hz), 6,89 (1H, dd, J = 8,4, 2,0 Hz), 4,18 (2H, s a), 4,03 (1H, d, J = 17,1 Hz), 3,64 (1H, d, J = 16,4 Hz).

5 Ejemplo de producción de referencia 21

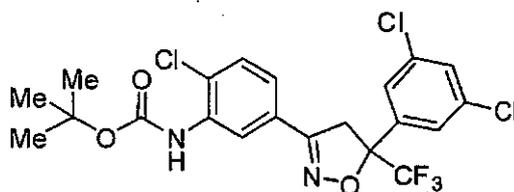
A una solución 500 mg del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 20 en 2 ml de 1,4-dioxano se le añadieron 6 ml de ácido clorhídrico concentrado a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 20 minutos. la solución se enfrió a 0 °C y se le añadió gota a gota una solución de 93 mg de nitrito sódico en 3 ml de agua. Después de agitar a la misma temperatura durante 15 minutos. a la solución de reacción se le añadió gota a gota una solución de 507 mg de cloruro de estaño (II) en 4 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción se neutralizó mediante la adición de hidróxido sódico 2 N . La fase acuosa se extrajo con t-butil metil éter. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 510 mg de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.



15

Ejemplo de producción de referencia 22

A una solución de 6,3 g de tiofosgeno en 50 ml de tolueno se le añadió gota a gota una solución de 8,7 g del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 20 en 50 ml de tolueno y 10 ml de tetrahidrofurano. Se añadieron 50 ml más de tolueno a la solución de reacción, seguido de agitación a 80 °C durante 1 hora. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y después se concentró a presión reducida, y se le añadieron 100 ml de *terc*-butanol. A la solución se le añadieron 14,6 g de trietilamina a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 16 horas. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con cloroformo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 9,81 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



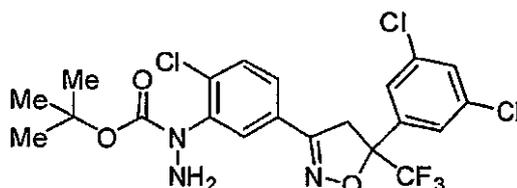
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,39 (1H, d, J = 2,1 Hz), 7,52 (2H, d, J = 1,8 Hz), 7,47 (1H, dd, J = 8,5, 2,1 Hz), 7,42 (1H, t, J = 1,8 Hz), 7,39 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,09 (1H, s a), 4,11 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,70 (1H, d, J = 17,3 Hz), 1,55 (9H, s).

30

Ejemplo de producción de referencia 23

A una suspensión de 760 mg de hidruro sódico (60% en aceite) en 200 ml de tetrahidrofurano se le añadió gota a gota una solución de 8,80 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de Referencia 22 en 50 ml de tetrahidrofurano a temperatura ambiente. Después de agitar la mezcla a la misma temperatura durante 20 minutos, se le añadieron 6,0 g de O-(difenilfosforil)hidroxilamina a temperatura ambiente. Después de agitar la mezcla a la misma temperatura durante 15 horas, se le añadieron agua y acetato de etilo, y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 6,58 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

40



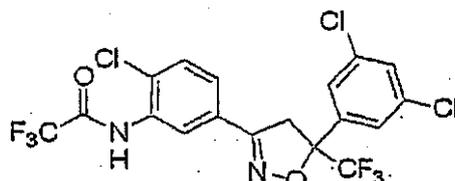
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,55-7,44 (6H, m), 4,07 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 3,68 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 1,41 (9H, s a).

Ejemplo de producción de referencia 24

5

A una solución de 3,04 g del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 20 y 772 mg de trietilamina en 20 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 1,47 g de anhídrido trifluoroacético a 0 °C. Después de agitar a la misma temperatura durante 30 minutos, la mezcla de reacción se diluyó con *tert*-butil metil éter. A la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con ácido clorhídrico 2 N y después una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 3,63 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

10



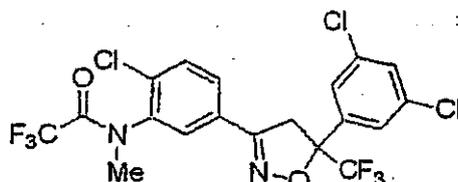
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,53 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 8,48 (1H, s a), 7,67 (1H, dd, $J = 8,5, 2,0$ Hz), 7,52 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 7,50 (2H, s), 7,43-7,42 (1H, m), 4,09 (1H, d, $J = 17,3$ Hz), 3,71 (1H, d, $J = 17,3$ Hz).

15

Ejemplo de producción de referencia 25

A una suspensión de hidruro sódico (60% en aceite) en 15 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadió gota a gota una solución de 3,6 g del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 24 en 15 ml de *N,N*-dimetilformamida a temperatura ambiente. Después de agitar la mezcla a la misma temperatura durante 20 minutos, se añadieron 1,52 g de yoduro de metilo a la misma, seguido a agitación durante 1 hora. A la mezcla de reacción se le añadió ácido clorhídrico 2 N, seguido de extracción con *tert*-butil metil éter. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 3,73 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

20



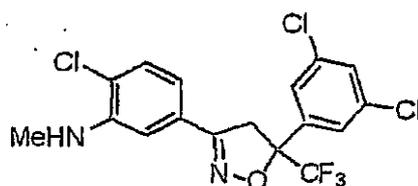
25

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,70-7,40 (6H, m), 4,06 (1H, dd, $J = 17,2, 13,0$ Hz), 3,73-3,64 (1H, m), 3,33-3,32 (3H, m).

Ejemplo de producción de referencia 26

A una solución de 3,6 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 25 en 20 ml de metanol se le añadieron 1,97 g de carbonato potásico a temperatura ambiente, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. Un precipitado se filtró. Al filtrado se le añadió agua, seguido de extracción con *tert*-butil metil éter. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 2,20 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

30



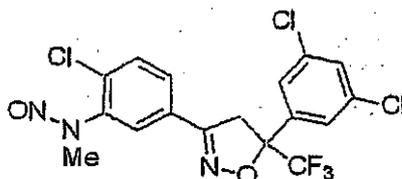
35

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,51 (2H, d, $J = 1,8$ Hz), 7,42 (1H, t, $J = 1,8$ Hz), 7,28 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 6,99 (1H, d, $J = 2,0$ Hz), 6,78 (1H, dd, $J = 8,0, 2,0$ Hz), 4,48 (1H, d, $J = 5,1$ Hz), 4,07 (1H, d, $J = 17,2$ Hz), 3,67 (1H, d, $J = 17,2$ Hz), 2,94 (3H, d, $J = 5,1$ Hz).

40

Ejemplo de producción de referencia 27

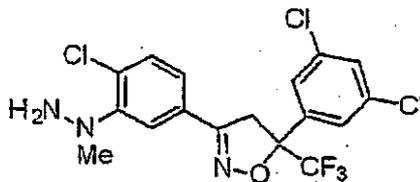
A una solución de 2,55 g de del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 26 en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 4,5 ml de ácido clorhídrico concentrado y 5,0 ml de agua a temperatura ambiente. Después de agitar a temperatura ambiente durante 10 minutos. la mezcla se enfrió a 0 °C y se le añadió gota a gota una solución de 539 mg de nitrito sódico en 5 ml de agua. La mezcla se agitó a la misma temperatura durante 1 hora, se neutralizó mediante la adición de una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y después se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 2,69 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,84-7,31 (6H, m), 4,09 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,71 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,41 (3H, s).

Ejemplo de producción de referencia 28

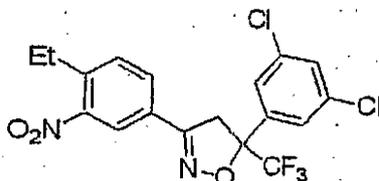
A una solución de 2,61 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 27 en 4 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 8 ml de etanol, 8 ml de agua y 8 ml de ácido acético a temperatura ambiente. Después, se añadieron 695 mg cinc a la mezcla a temperatura ambiente. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas y después se filtró. Al filtrado se le añadió hidrogenocarbonato sódico anhidro, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 764 mg de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68-7,67 (1H, m), 7,51 (2H, s), 7,42-7,40 (2H, m), 7,23-7,20 (1H, m), 4,08 (1H, d, J = 17,2 Hz), 3,85 (2H, s a), 3,69 (1H, d, J = 17,2 Hz), 3,06 (3H, s).

Ejemplo de producción de referencia 29

Una solución de 4,30 g de 2-etil-5-hidroxiiminometilnitrobenzoceno y 2,97 g de N-clorosuccinimida en 40 ml de dimetilformamida se agitó a 60 °C durante 1 hora. La solución de reacción se enfrió a temperatura ambiente. A la misma se le añadieron 3,5 g de 2-(3,5-diclorofenil)-3,3,3-trifluoro-1-propeno y después 1,7 g de trietilamina, seguido a agitación durante 6 horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 5,74 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.

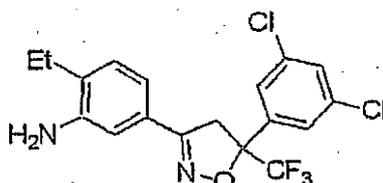


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,07 (1H, d, J = 1,9 Hz), 7,91 (1H, dd, J = 8,0, 1,9 Hz), 7,51 (2H, d, J = 1,6 Hz), 7,46 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,44 (1H, t, J = 1,6 Hz), 4,10 (1H, d, J = 17,3 Hz), 3,72 (1H, d, J = 17,3 Hz), 2,96 (2H, c, J = 7,5 Hz), 1,30 (3H, t, J = 7,5 Hz).

Ejemplo de producción de referencia 30

A una mezcla de 0,5 ml de ácido acético, 22 ml de agua y 34 ml de etanol se le añadieron 4,33 g de polvo de hierro a temperatura ambiente. A la mezcla se le añadieron 5,60 g del compuesto obtenido en el Ejemplo de producción de referencia 29 a 75 °C, seguido a agitación a la misma temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se filtró y después se lavó con acetato de etilo. Al filtrado se le añadió una solución acuosa

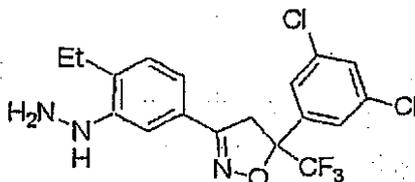
saturada de hidrógenocarbonato sódico, seguido de extracción con acetato de etilo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 5,20 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,51 (2H, d, $J = 1,7$ Hz), 7,41 (1H, t, $J = 1,7$ Hz), 7,10 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,04 (1H, d, $J = 1,7$ Hz), 6,93 (1H, dd, $J = 7,8, 1,7$ Hz), 4,05 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 3,74 (2H, s a), 3,65 (1H, d, $J = 17,1$ Hz), 2,52 (2H, c, $J = 7,5$ Hz), 1,25 (3H, t, $J = 7,5$ Hz).

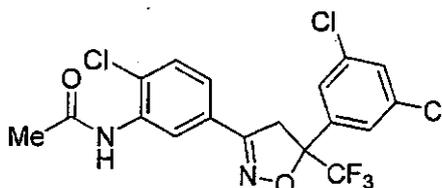
Ejemplo de producción de referencia 31

- 10 A una solución 1,00 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 30 en 2 ml de 1,4-dioxano se le añadieron 4 ml de ácido clorhídrico concentrado a temperatura ambiente. La mezcla se agitó a la misma temperatura durante 20 horas y después se enfrió a 0 °C. A la solución, se le añadió gota a gota una solución de 188 mg de nitrito sódico en 1 ml de agua. Después de agitar a la misma temperatura durante 15 minutos, a la solución de
- 15 reacción se le añadió gota a gota una solución de 1,03 g de cloruro de estaño (II) en 2 ml de ácido clorhídrico concentrado. La mezcla de reacción se neutralizó mediante la adición de hidróxido sódico 2 N. La fase acuosa se extrajo con cloroformo. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 1,31 g de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.



- 20 Ejemplo de producción de referencia 32

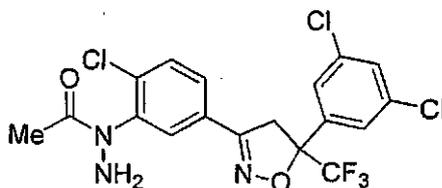
- Una solución de 2,0 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 20 en 10 ml de anhídrido acético se agitó a temperatura ambiente durante 0,5 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, El
- 25 concentrado se disolvió en acetato de etilo, y después se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato sódico y después una solución acuosa saturada de cloruro sódico. La fase orgánica se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 3,0 g de un compuesto en bruto representado por la siguiente fórmula.



- 30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,59 (1H, s a), 7,67 (1H, s a), 7,57 (1H, dd, $J = 8,4, 2,1$ Hz), 7,50 (2H, d, $J = 1,2$ Hz), 7,43-7,42 (2H, m), 4,09 (1H, d, $J = 17,4$ Hz), 3,70 (1H, d, $J = 17,4$ Hz), 2,28 (3H, s).

Ejemplo de producción de referencia 33

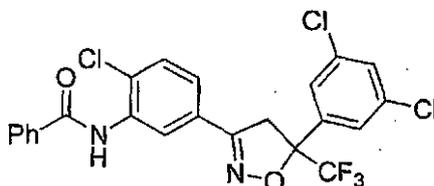
- 35 A una solución de 2,2 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 32 en 30 ml de *tert*-butil metil éter se le añadieron 14 ml de una solución acuosa al 28% de hidróxido sódico, 4,5 ml de agua de amoníaco, 1,56 g de cloruro de amonio y 274 mg de cloruro de trioctilmetilamonio. A la mezcla se le añadieron gota a gota 32 ml de una solución acuosa al 5% de hipoclorito sódico a temperatura ambiente durante 20 minutos. Después de agitar a la misma temperatura durante 2 horas, la fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo de nuevo con *tert*-butil metil éter.
- 40 Las fases orgánicas se combinaron, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 2,0 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



Punto de fusión: 92 °C

Ejemplo de producción de referencia 34

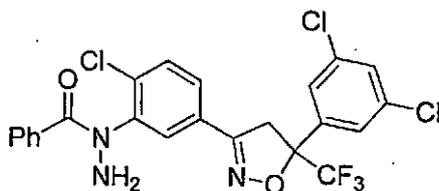
5 A una solución de 2,0 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 20 en 5 ml de piridina se le añadieron 1,4 g de cloruro de benzoilo a temperatura ambiente. Después de agitar a la misma temperatura durante 0,5 horas, a la mezcla de reacción se le añadió acetato de etilo, seguido de lavado con ácido clorhídrico al 3%. Las fases orgánicas se combinaron, se secaron sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 2,4 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,69-7,44 (1H, m), 7,68 (1H, dd, J = 4,1, 2,0 Hz), 7,63 (1H, dd, J = 5,7, 2,1 Hz), 7,58 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,49 (2H, d, J = 7,6 Hz), 7,44 (1H, t, J = 2,0 Hz), 4,74 (2H, s), 4,37 (0H, s), 4,07 (1H, dd, J = 17,2, 6,7 Hz), 2,42 (1H, s), 1,92 (2H, d, J = 2,9 Hz).

Ejemplo de producción de referencia 35

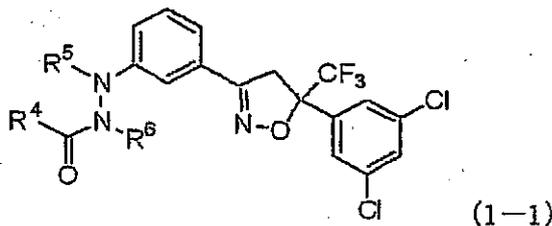
20 A una solución de 2,4 g del compuesto preparado en el Ejemplo de producción de referencia 34 en 20 ml de tetrahidrofuran se le añadieron 14 ml de una solución acuosa al 8% de hidróxido sódico, 4,5 ml de agua de amoníaco, 2,56 g de cloruro de amonio y 274 mg de cloruro de trioctilmetilamonio. A la mezcla se le añadieron gota a gota 48 ml de una solución acuosa al 5% de hipoclorito sódico a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de agitar a la misma temperatura durante 2 horas, la fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo de nuevo con terc-butil metil éter. Las fases orgánicas se combinaron, se secó sobre sulfato sódico anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 1,8 g de un compuesto representado por la siguiente fórmula.



Punto de fusión: 87 °C

A continuación se muestran ejemplos específicos del compuesto e la presente invención.

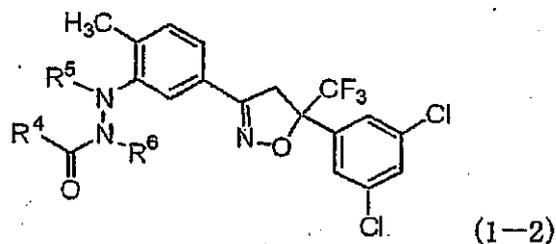
30 Un compuesto representado por la fórmula (1-1):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

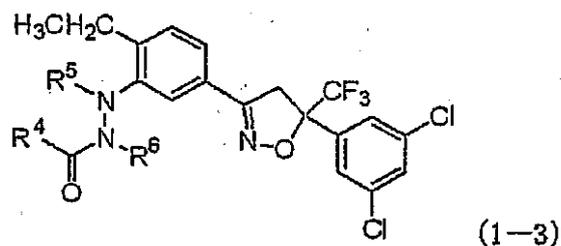
35

Un compuesto representado por la fórmula (1-2):



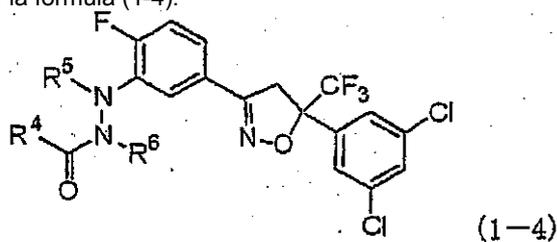
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-3):



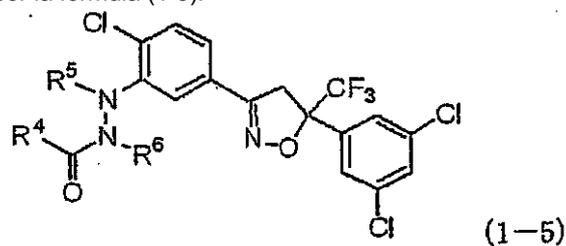
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-4):



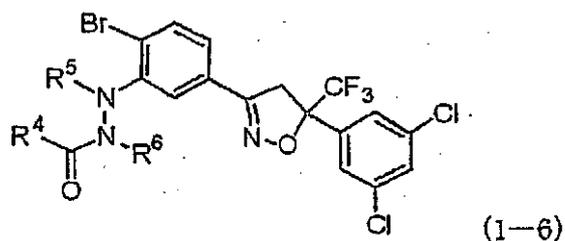
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-5):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

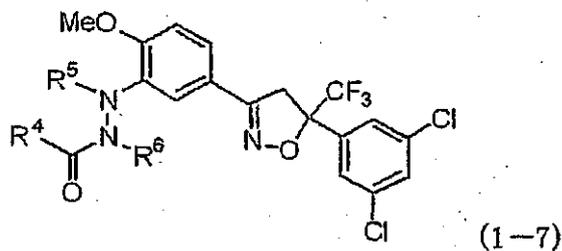
Un compuesto representado por la fórmula (1-6):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

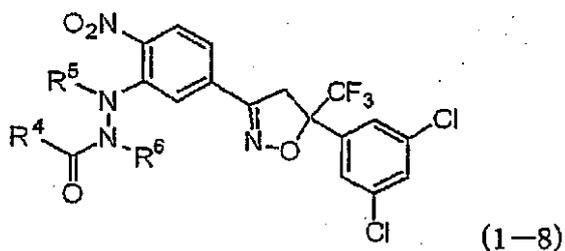
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-7):



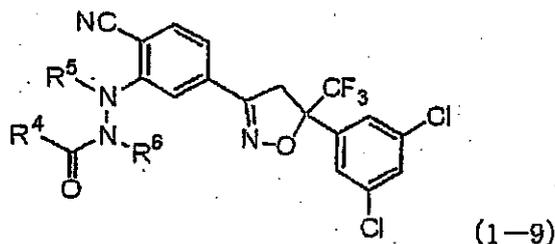
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-8):



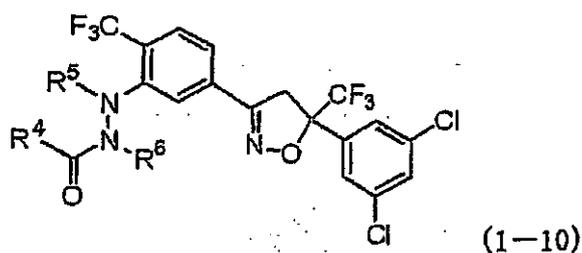
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-9):



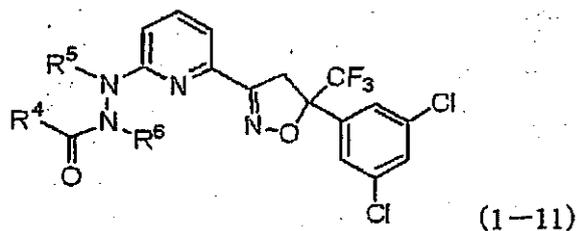
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-10):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

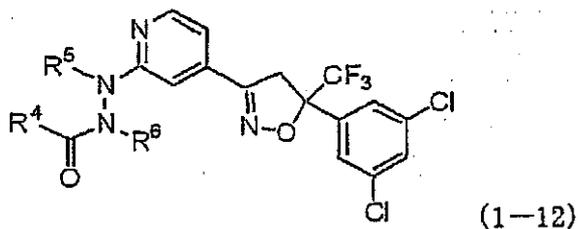
Un compuesto representado por la fórmula (1-11):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

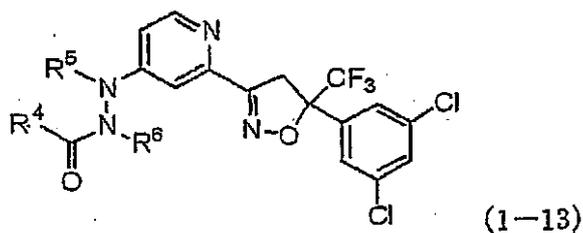
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-12):



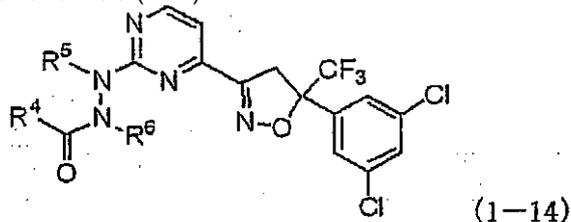
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-13):



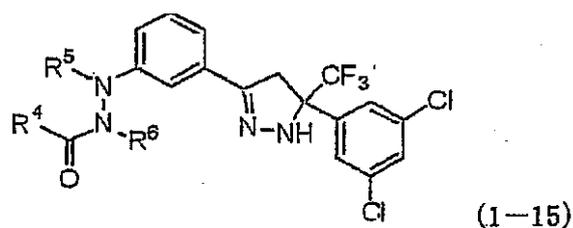
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-14):



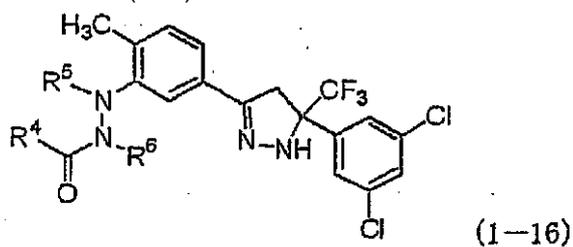
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-15):



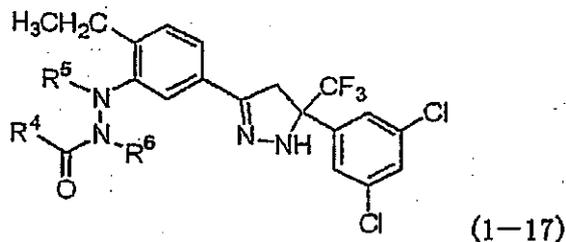
15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-16):



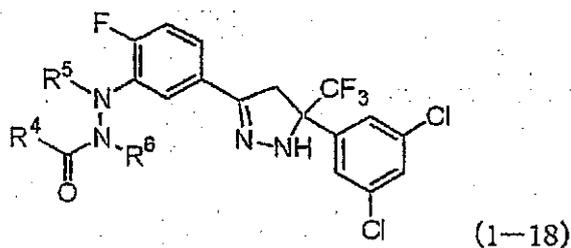
20 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-17):



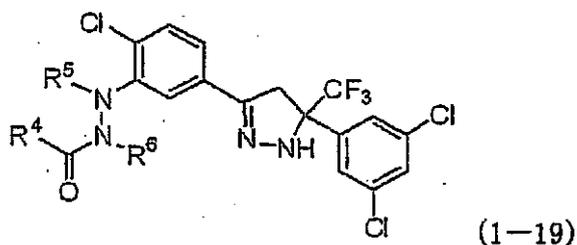
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-18):



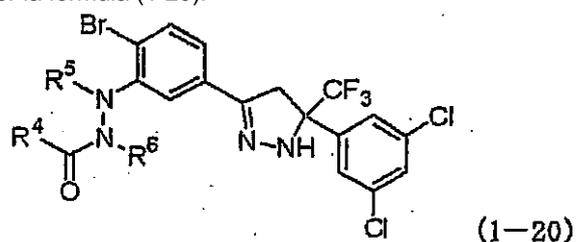
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-19):



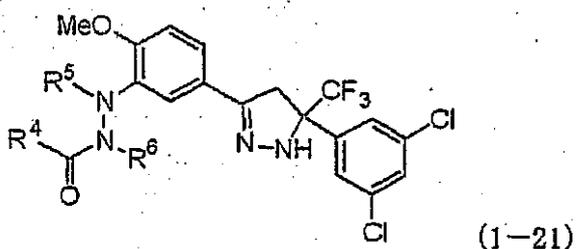
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-20):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

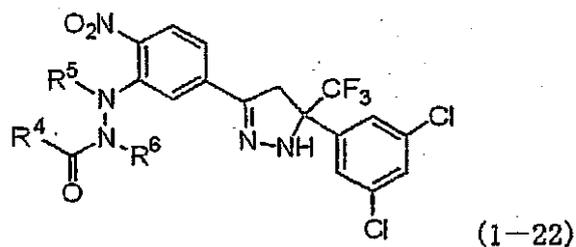
Un compuesto representado por la fórmula (1-21):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

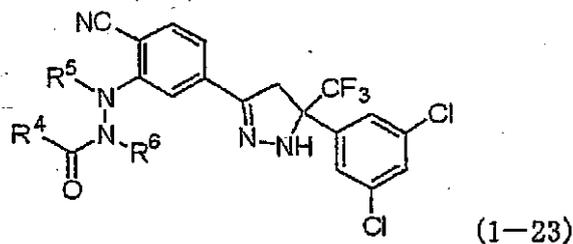
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-22):



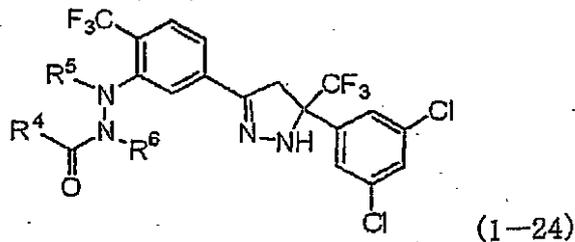
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-23):



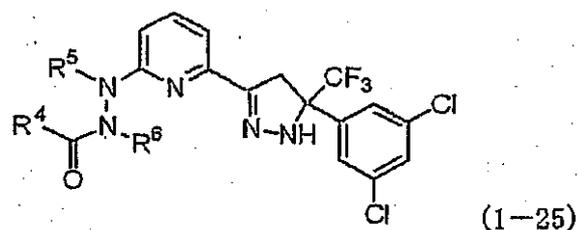
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-24):



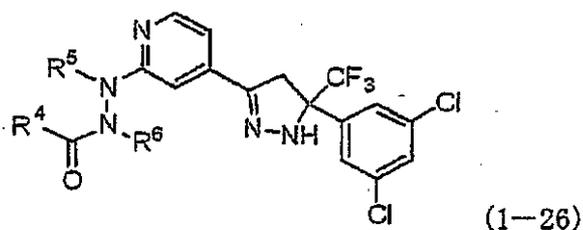
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-25):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

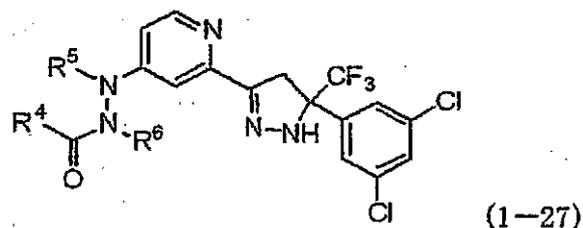
Un compuesto representado por la fórmula (1-26):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

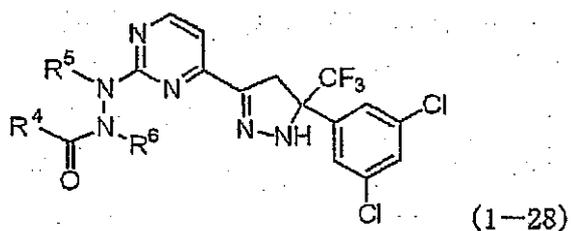
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-27):



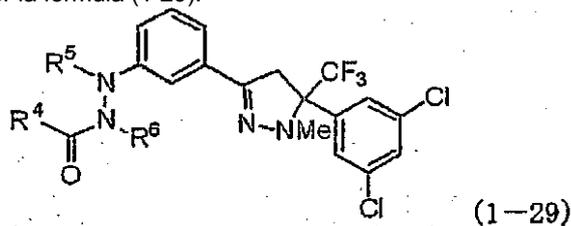
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-28):



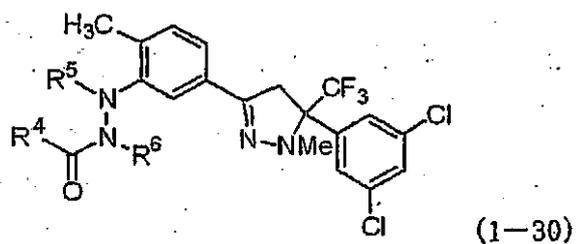
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-29):



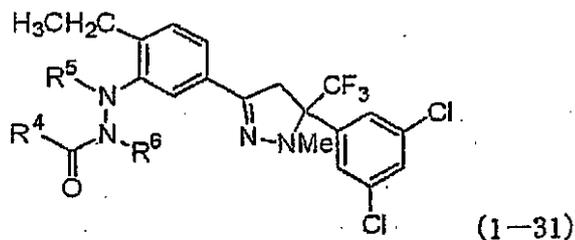
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-30):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

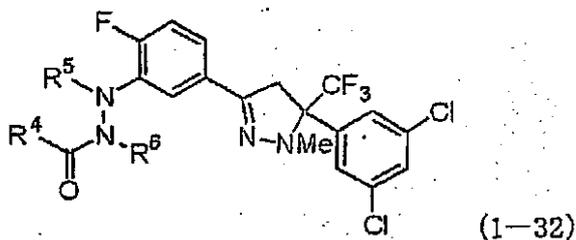
Un compuesto representado por la fórmula (1-31):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

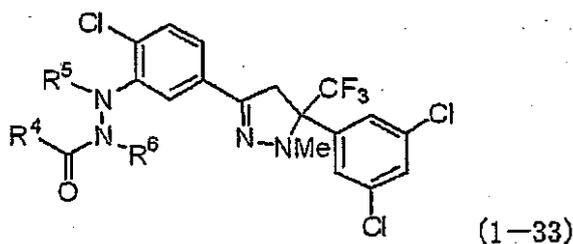
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-32):



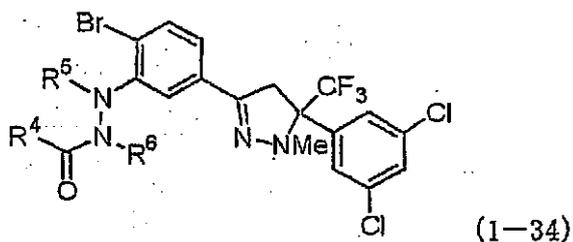
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-33):



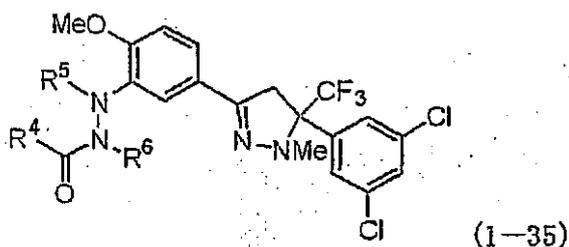
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-34):



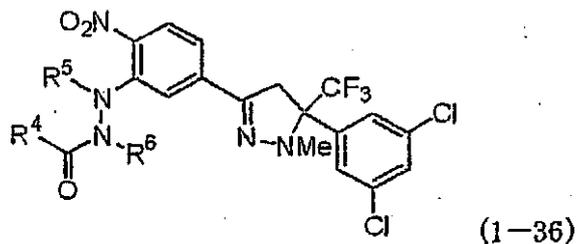
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-35):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

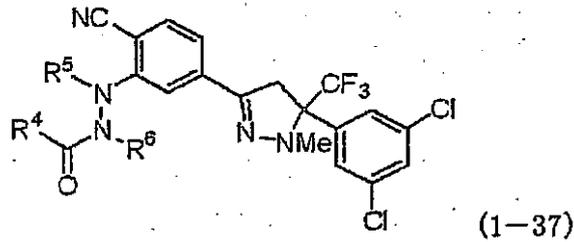
Un compuesto representado por la fórmula (1-36):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

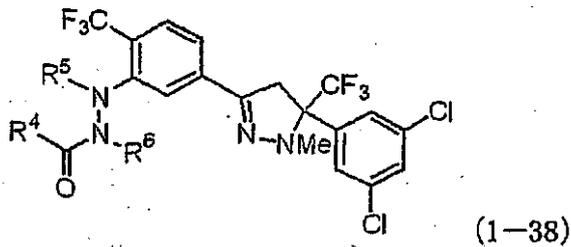
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-37):



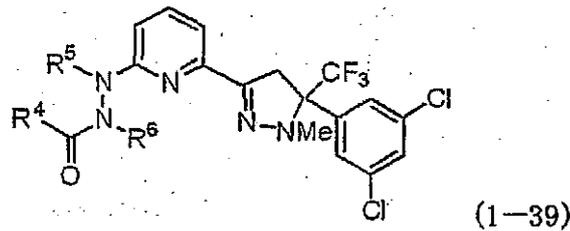
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-38):



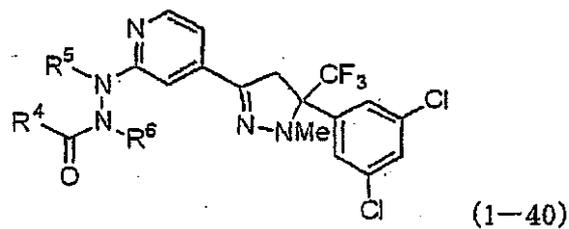
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-39):



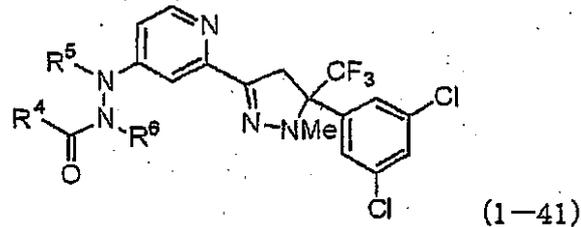
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-40):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

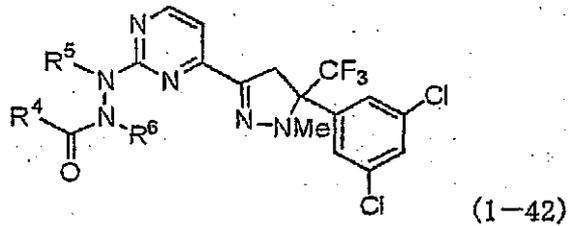
Un compuesto representado por la fórmula (1-41):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

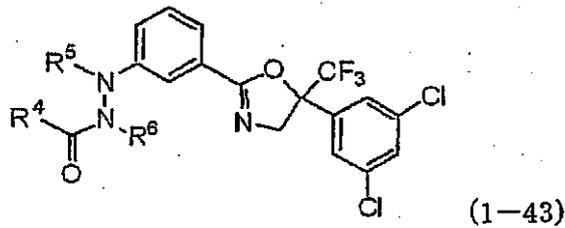
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-42):



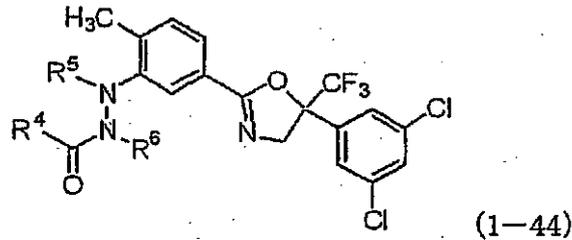
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-43):



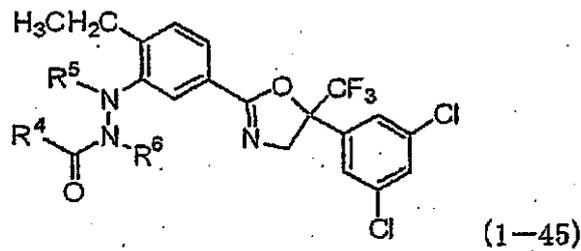
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-44):



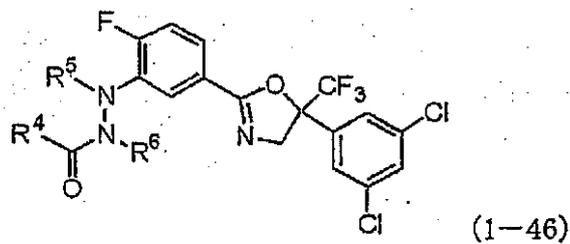
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-45):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

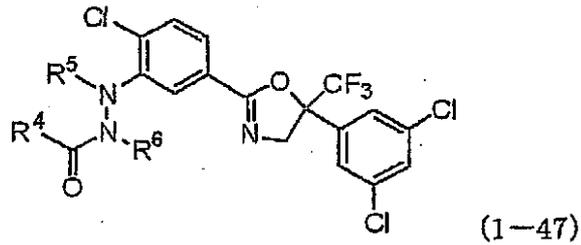
Un compuesto representado por la fórmula (1-46):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

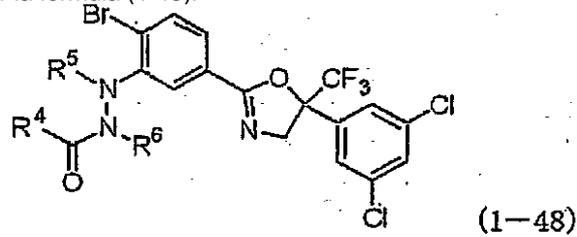
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-47):



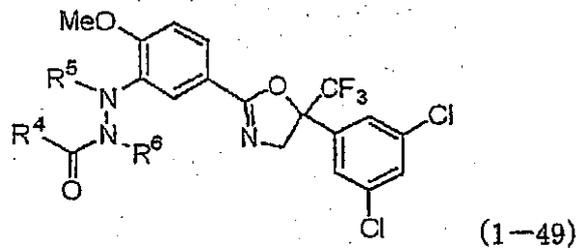
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-48):



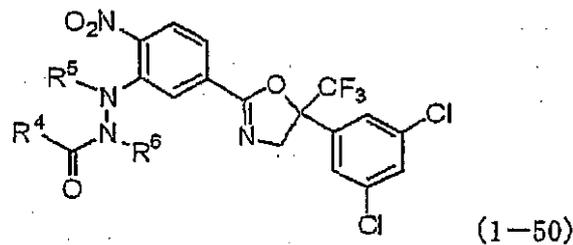
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-49):



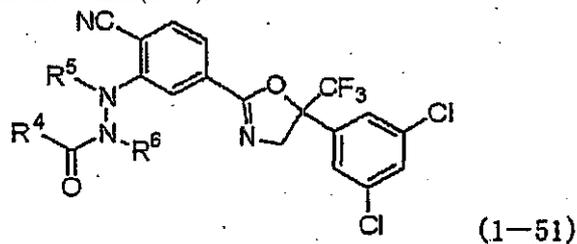
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-50):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

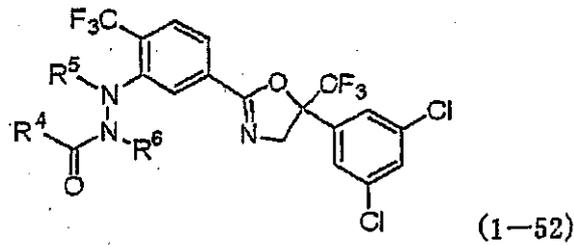
Un compuesto representado por la fórmula (1-51):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

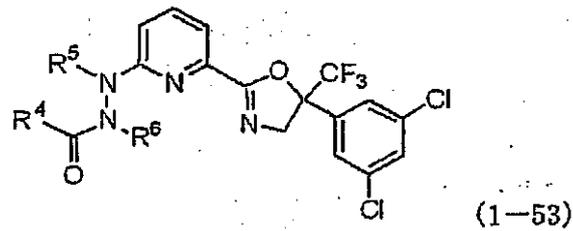
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-52):



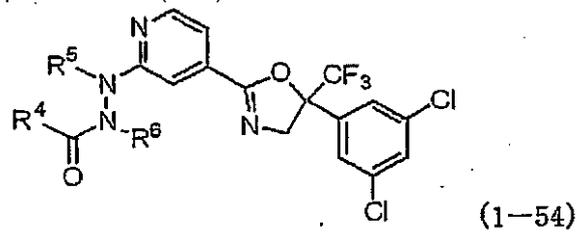
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-53):



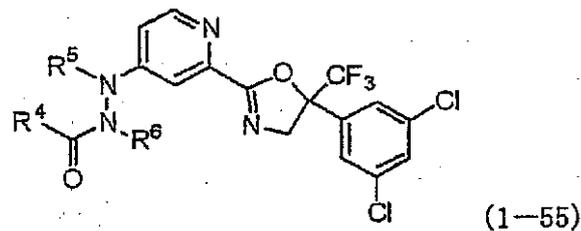
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-54):



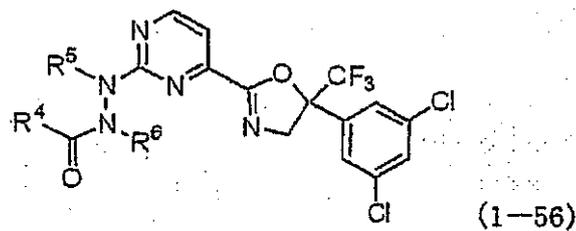
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-55):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

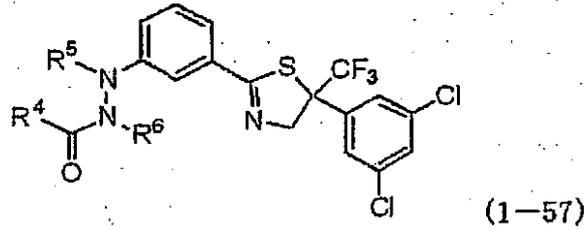
Un compuesto representado por la fórmula (1-56):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

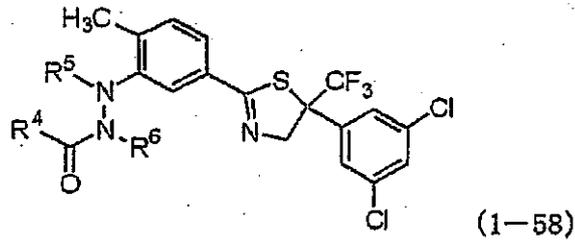
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-57):



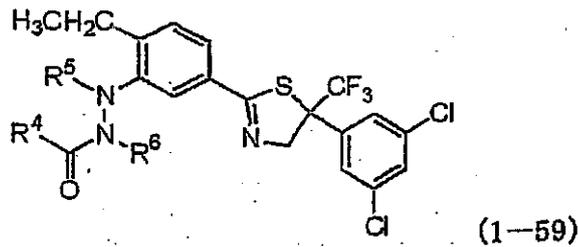
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-58):



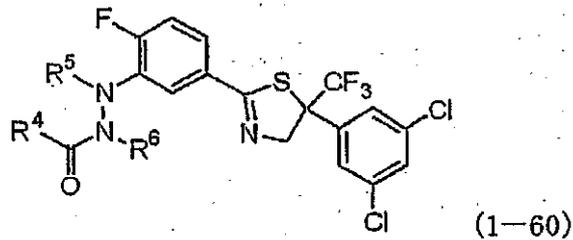
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-59):



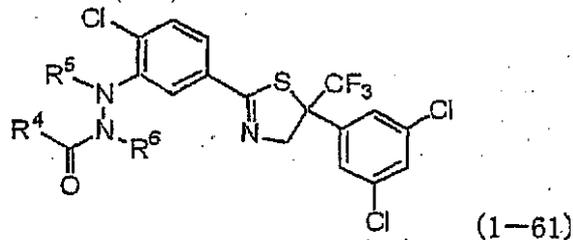
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-60):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

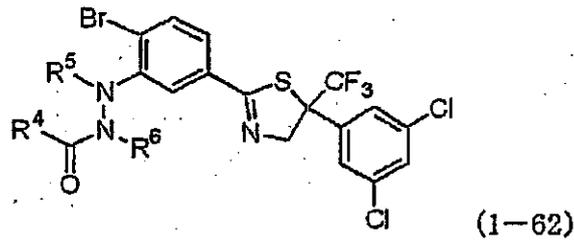
Un compuesto representado por la fórmula (1-61):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

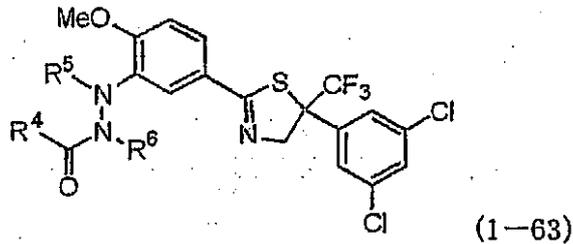
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-62):



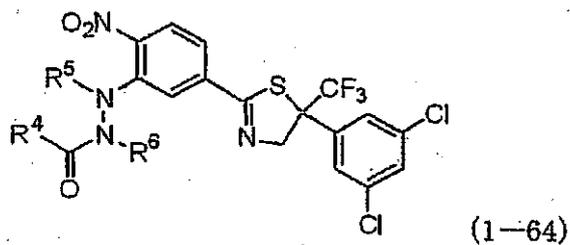
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-63):



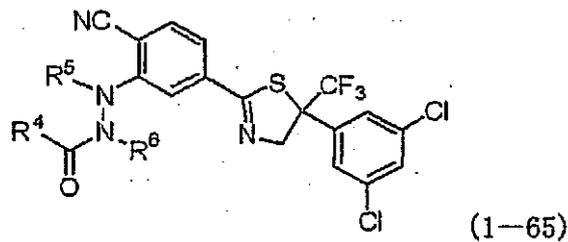
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-64):



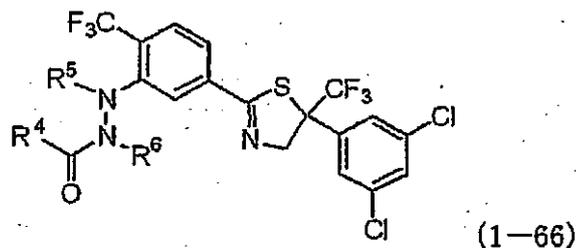
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-115):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

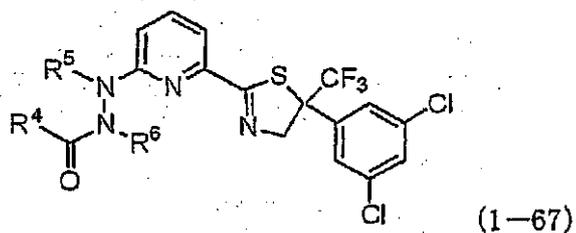
Un compuesto representado por la fórmula (1-66):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

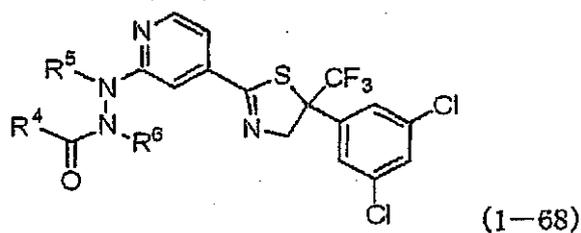
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-67):



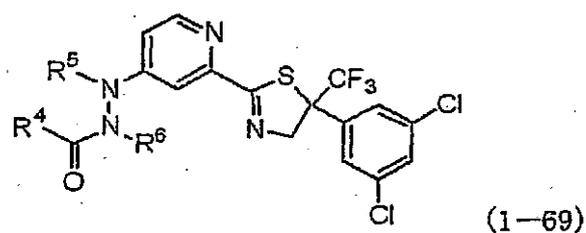
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-68):



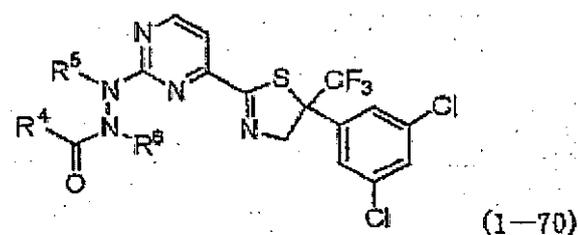
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-69):



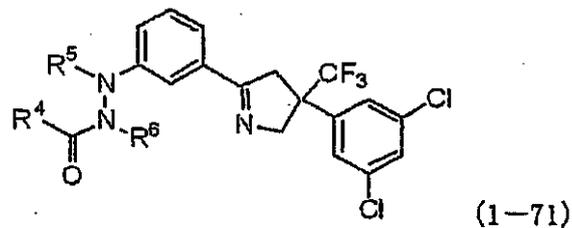
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-70):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

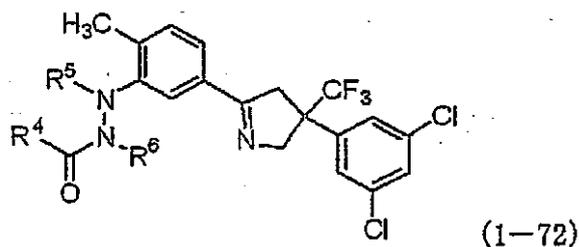
Un compuesto representado por la fórmula (1-71):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

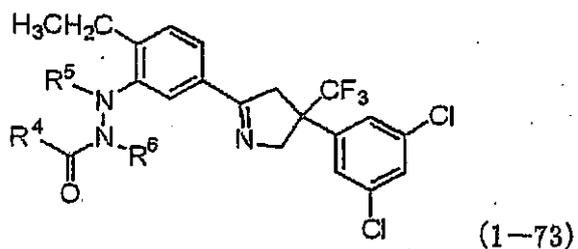
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-72):



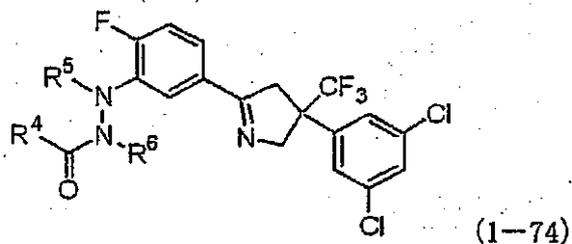
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-73):



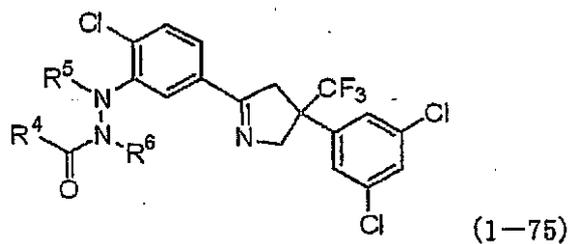
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-74):



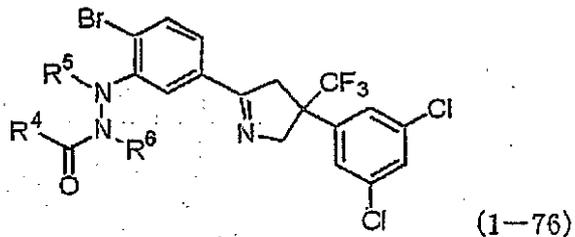
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-75):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

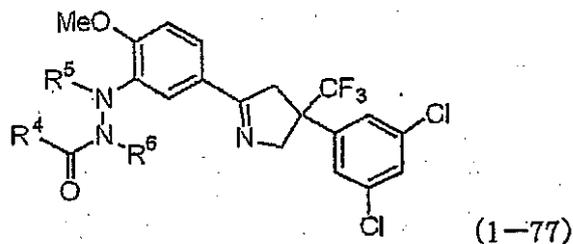
Un compuesto representado por la fórmula (1-76):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

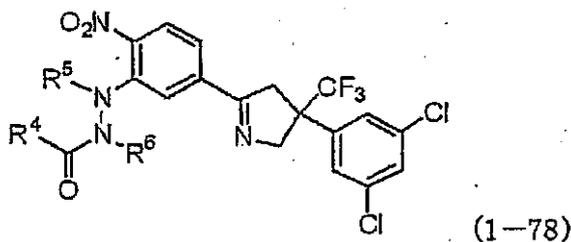
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-77):



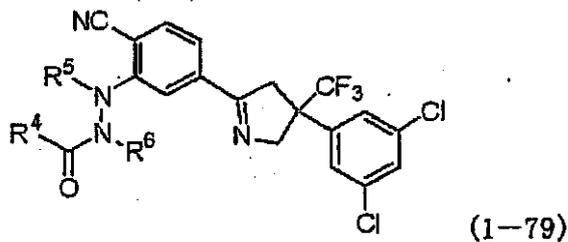
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-78):



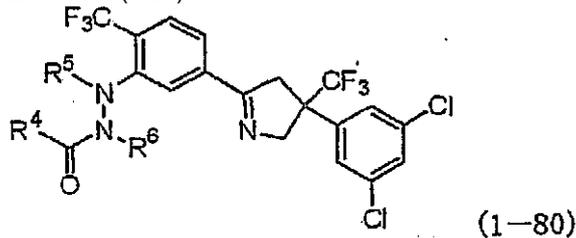
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-79):



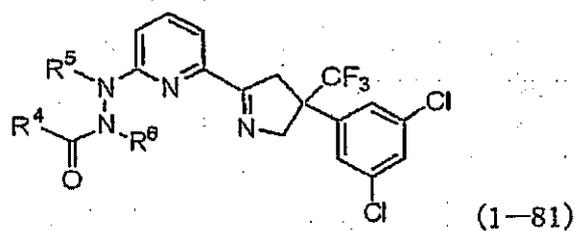
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-80):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

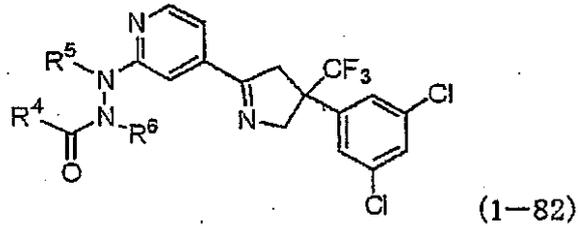
Un compuesto representado por la fórmula (1-81):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

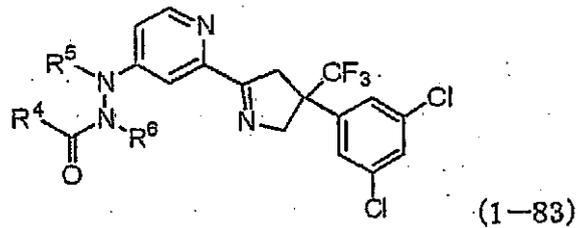
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-82):



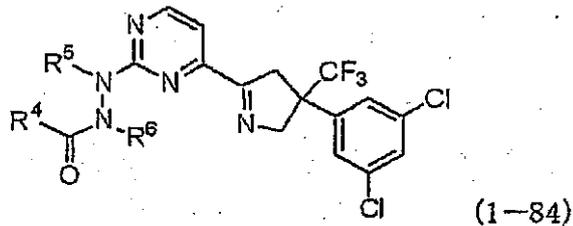
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-83):



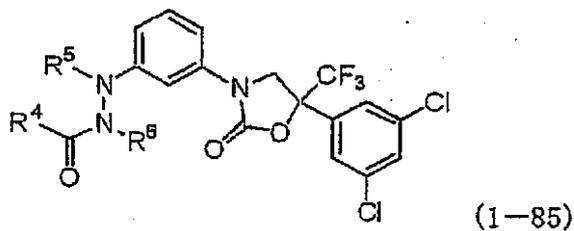
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-84):



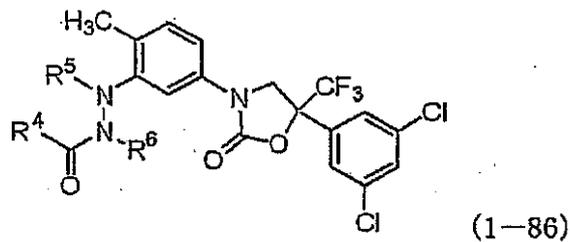
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-85):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

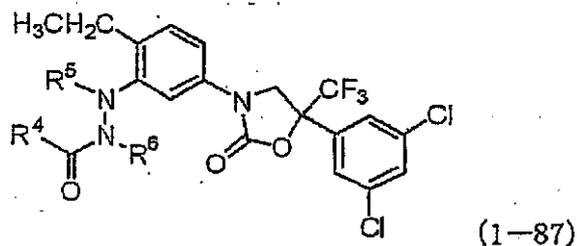
Un compuesto representado por la fórmula (1-86):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

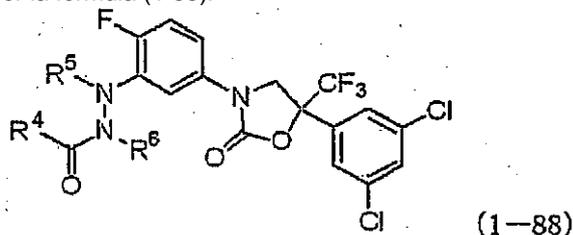
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-87):



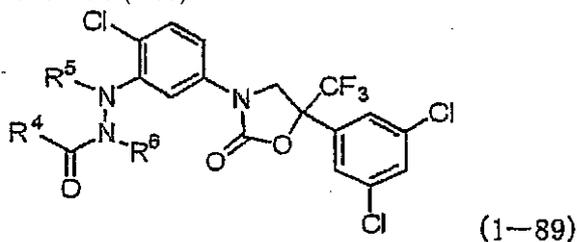
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-88):



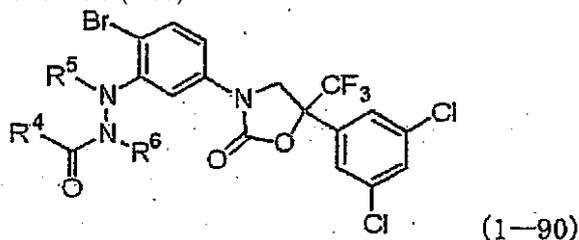
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-89):



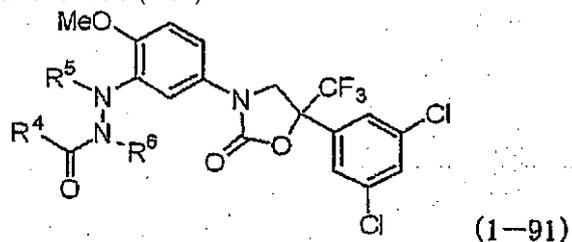
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-90):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

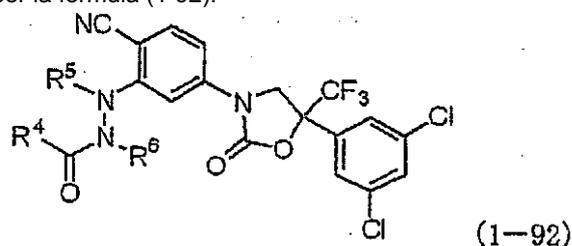
Un compuesto representado por la fórmula (1-91):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

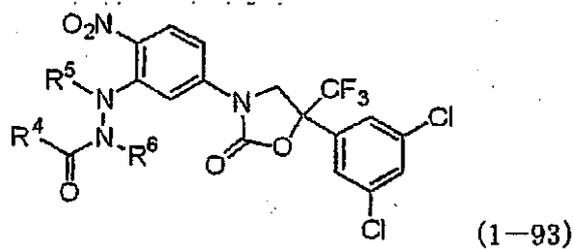
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-92):



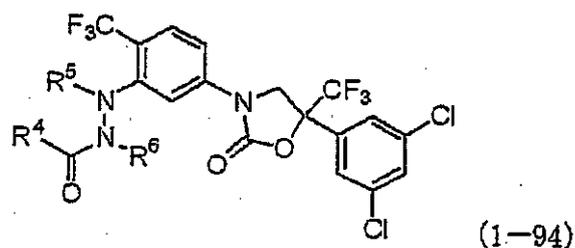
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-93):



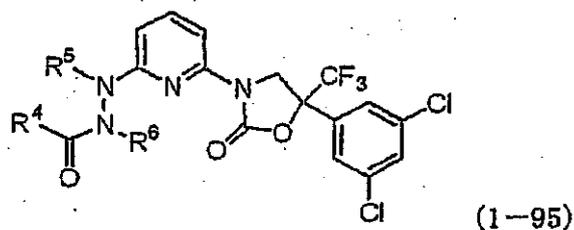
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-94):



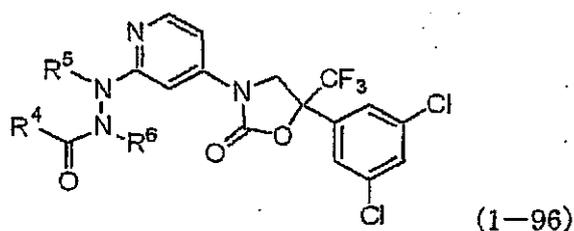
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-95):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

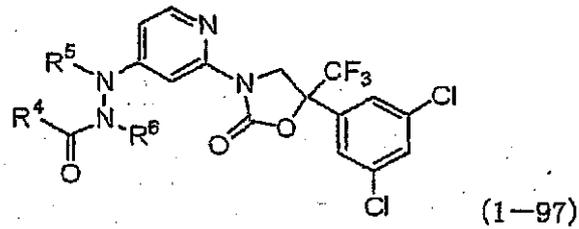
Un compuesto representado por la fórmula (1-96):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

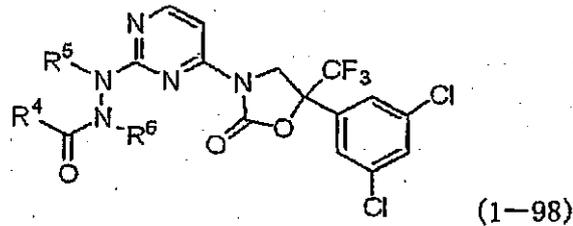
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-97):



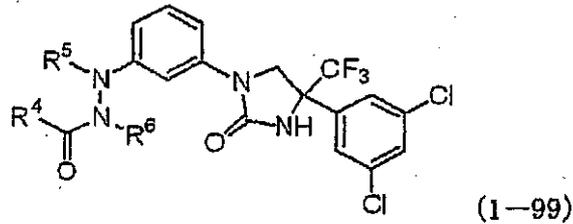
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-98):



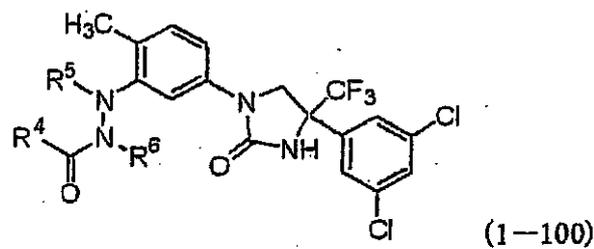
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-99):



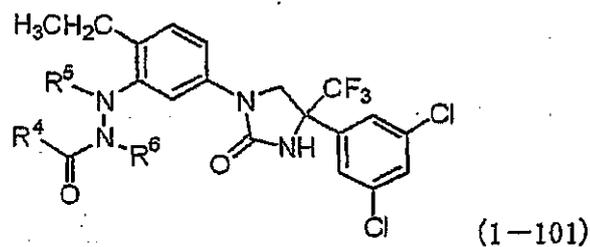
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-100):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

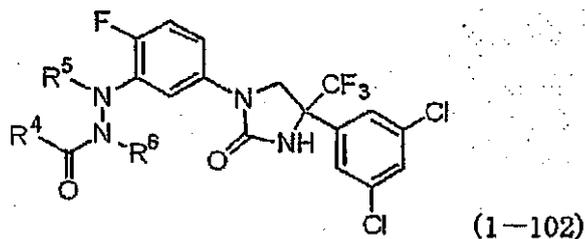
Un compuesto representado por la fórmula (1-101):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

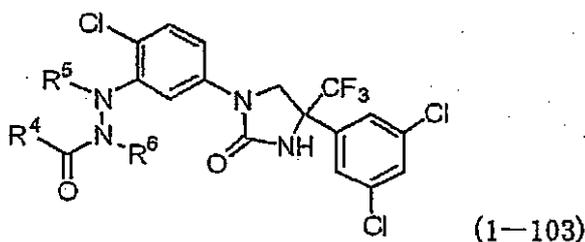
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-102):



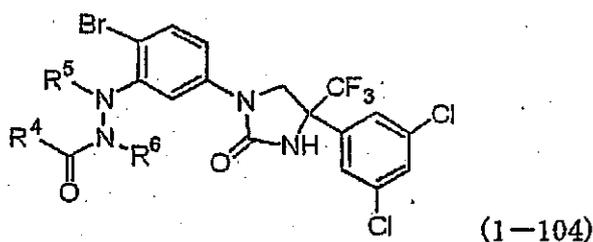
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-103):



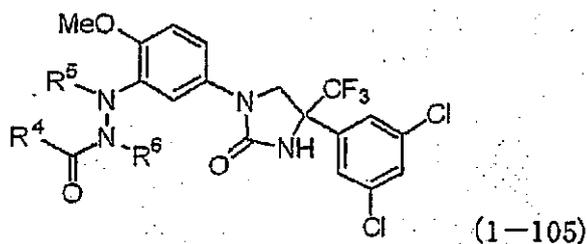
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-104):



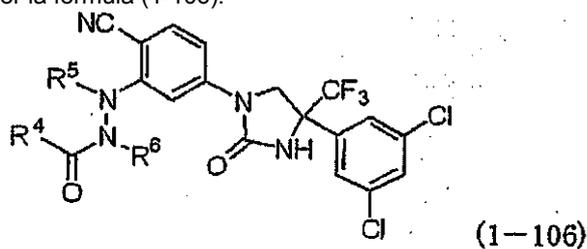
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-105):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

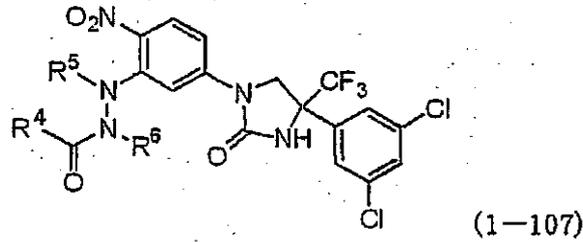
Un compuesto representado por la fórmula (1-106):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

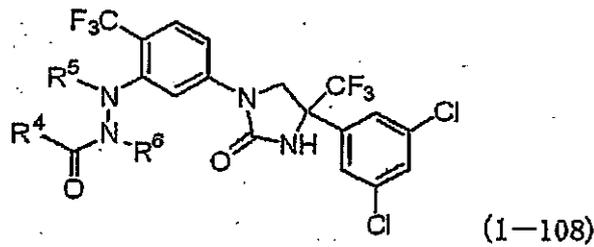
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-107):



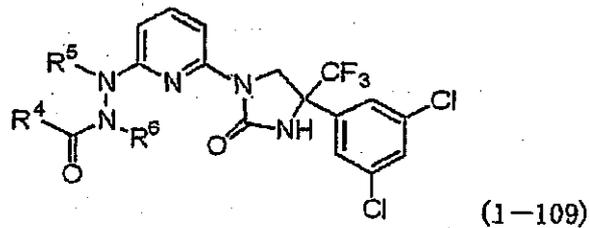
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-108):



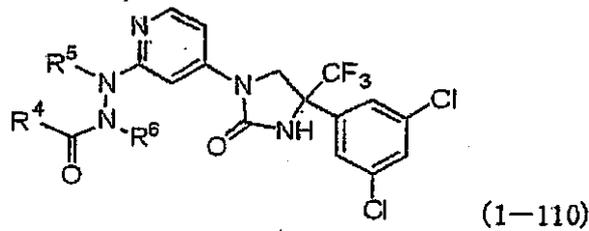
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-109):



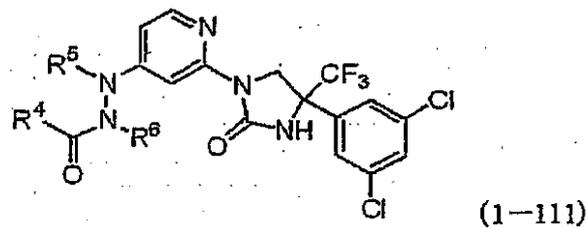
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-110):



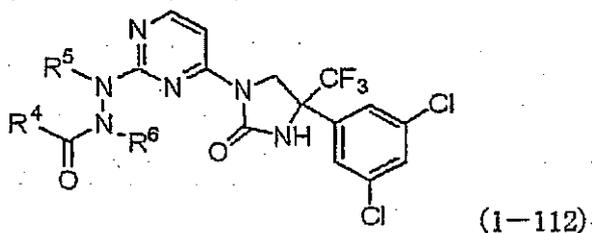
15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-111):



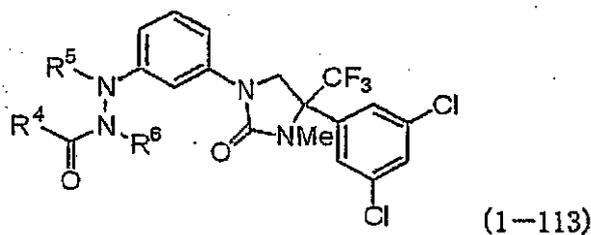
20 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-112):



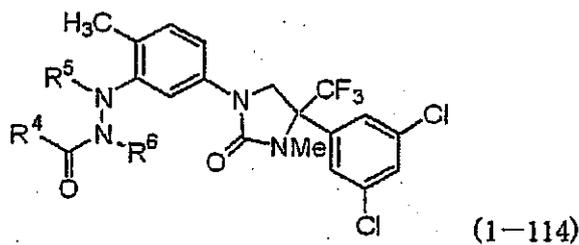
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-113):



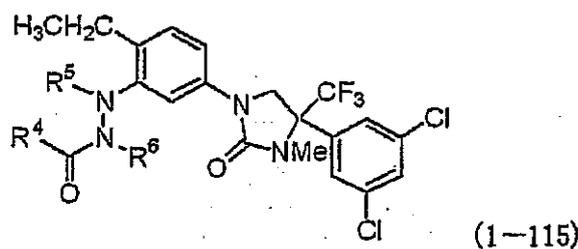
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-114):



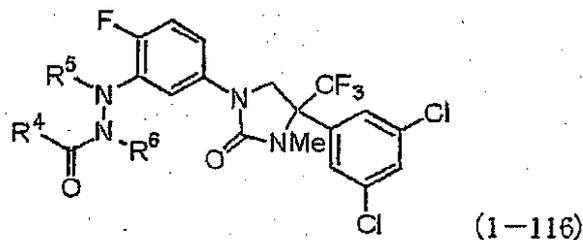
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-115):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

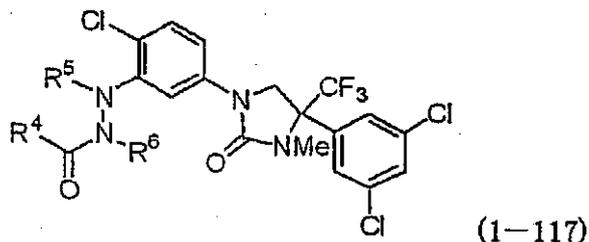
Un compuesto representado por la fórmula (1-116):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

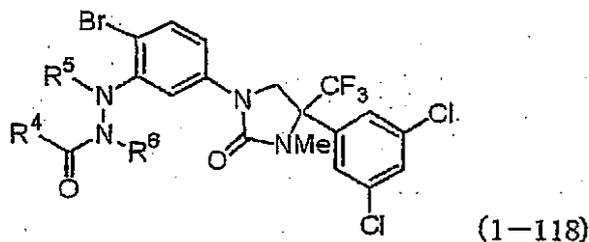
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-117):



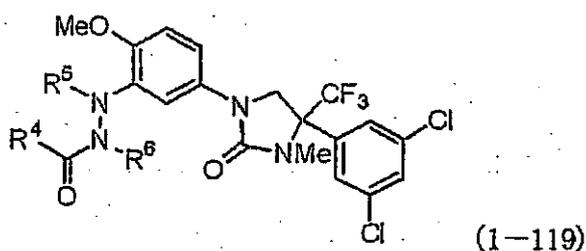
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-118):



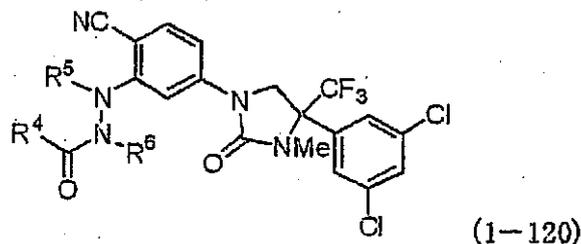
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-119):



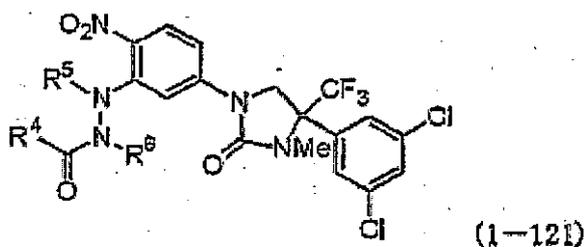
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-120):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

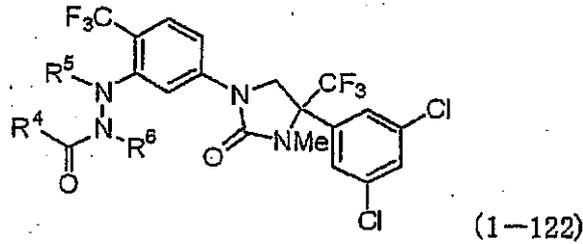
Un compuesto representado por la fórmula (1-121):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

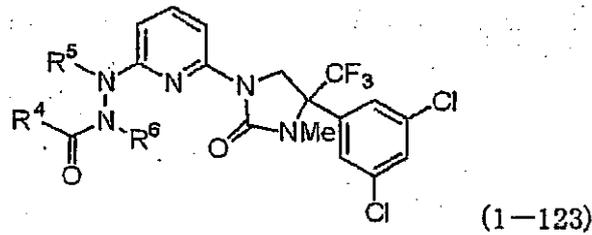
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-122):



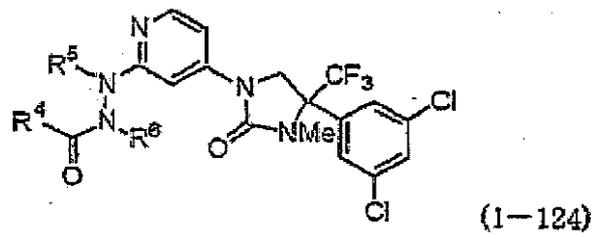
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-123):



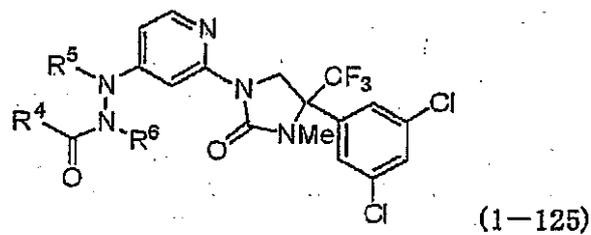
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-124):



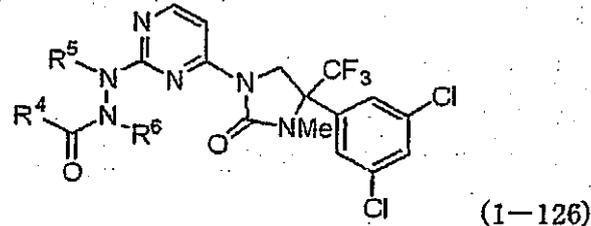
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-125):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

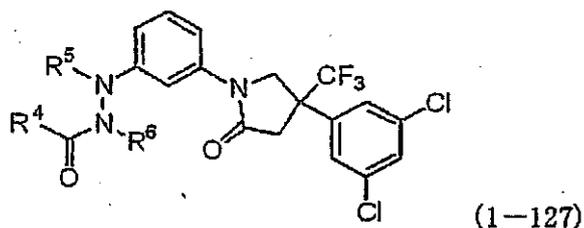
Un compuesto representado por la fórmula (1-126):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

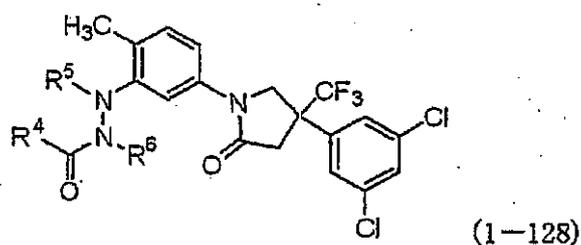
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-127):



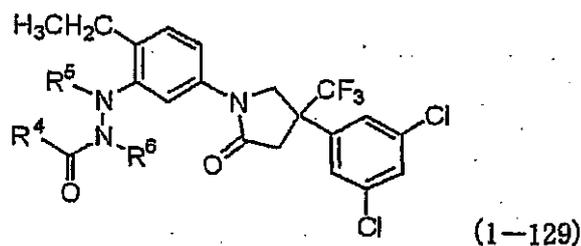
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-128):



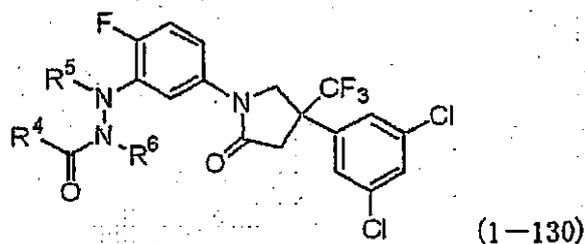
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-129):



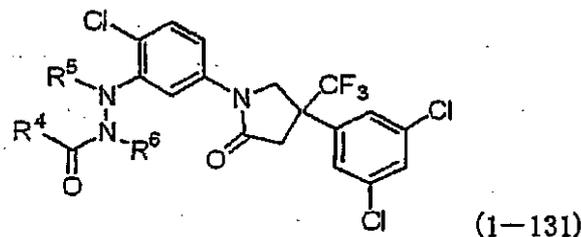
10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-130):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

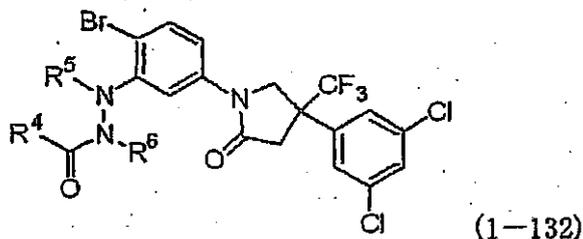
Un compuesto representado por la fórmula (1-131):



donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

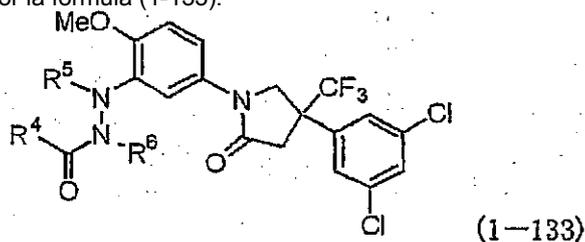
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-132):



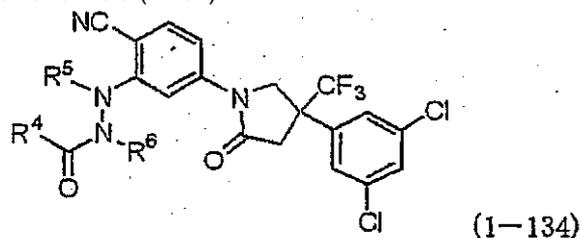
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-133):



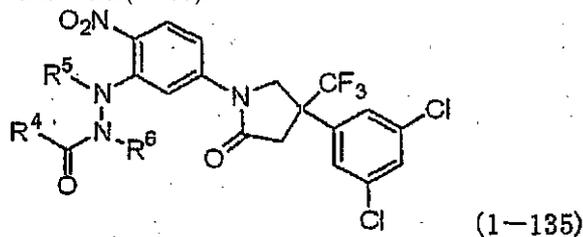
donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-134):



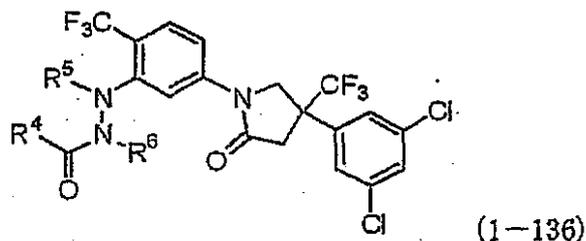
10 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-135):



15 donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

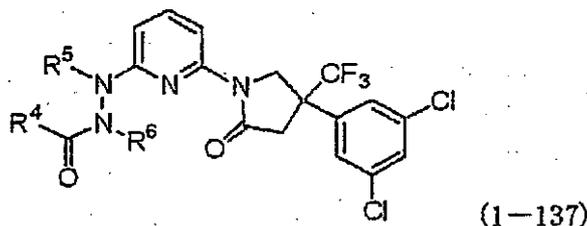
Un compuesto representado por la fórmula (1-136):



donde R⁴, R⁵ y R⁶ representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

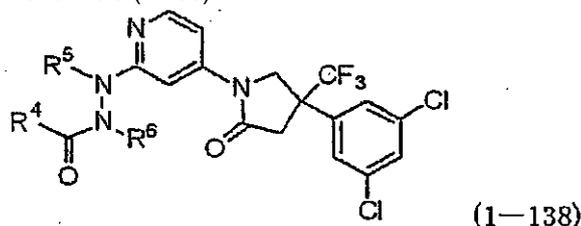
20

Un compuesto representado por la fórmula (1-137):



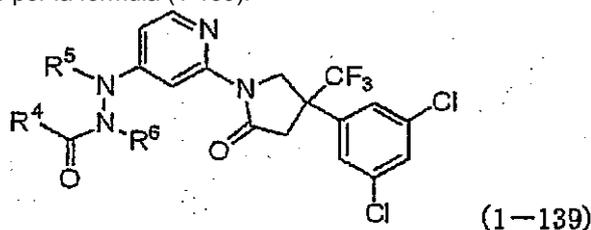
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

5 Un compuesto representado por la fórmula (1-138):



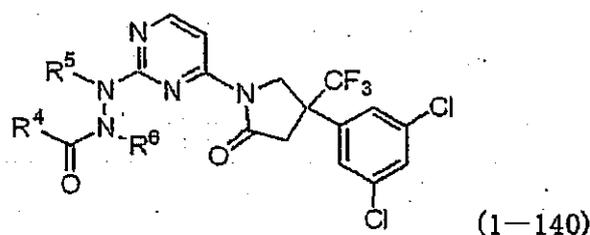
donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-139):



10 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

Un compuesto representado por la fórmula (1-140):



15 donde R^4 , R^5 y R^6 representan una cualquiera de las combinaciones que se muestran a continuación.

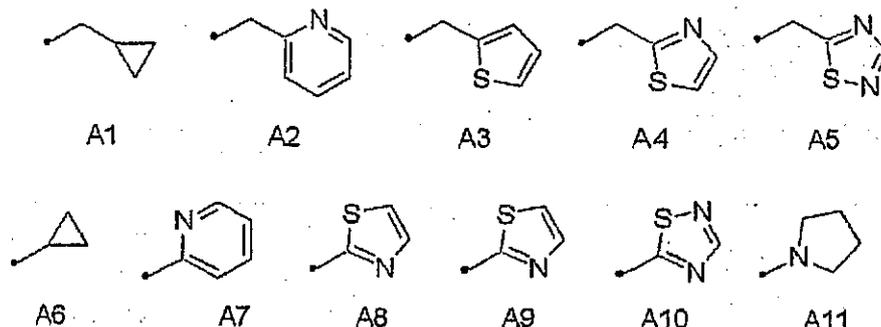
Combinaciones de A, R^1 , R^2 , R^{1a} , R^{2a} , Q, y n en la fórmula (1-1) hasta la fórmula (1-140) se muestran a continuación.

Entre corchetes, se muestran en este orden un número separado, un grupo representado por R^4 , un grupo representado por R^5 y un grupo representado por R^6 . [número separado, R^4 , R^5 , R^6]=[1, H, H, H], [2, CH₃, H, H], [3,

- 20 CH₂CF₃, H, H], [4, CH=CH₂, H, H], [5, CH=CHPh, H, H], [6, CH₂C≡CH, H, H], [7, CH₂CN, H, H], [8, CH₂NO₂, H, H], [9, CH₂N(CH₃)₂, H, H], [10, CH₂OCH₃, H, H], [11, CH₂OPh, H, H], [12, CH₂C(=O)OCH₃, H, H], [13, CH₂C(=O)CH₃, H, H], [14, CH₂Ph, H, H], [15, A1, H, H], [16, A2, H, H], [17, A3, H, H], [18, A4, H, H], [19, A5, H, H], [20, A6, H, H], [21, Ph, H, H], [22, A7, H, H], [23, A8, H, H], [24, A9, H, H], [25, A10, H, H], [26, OCH₃, H, H], [27, OPh, H, H], [28, NHCH₃, H, H], [29, N(CH₃)₂, H, H], [30, NHPh, H, H], [31, A11, H, H], [32, H, H, CH₃], [33, CH₃, H, CH₃], [34, CH₂CF₃, H, CH₃], [35, CH=CH₂, H, CH₃], [36, CH=CHPh, H, CH₃], [37, CH₂C≡CH, H, CH₃], [38, CH₂CN, H, CH₃], [39, CH₂NO₂, H, CH₃], [40, CH₂N(CH₃)₂, H, CH₃], [41, CH₂OCH₃, H, CH₃], [42, CH₂OPh, H, CH₃], [43, CH₂C(=O)OCH₃, H, CH₃], [44, CH₂C(=O)CH₃, H, CH₃], [45, CH₂Ph, H, CH₃], [46, A1, H, CH₃], [47, A2, H, CH₃], [48, A3, H, CH₃], [49, A4, H, CH₃], [50, A5, H, CH₃], [51, A6, H, CH₃], [52, Ph, H, CH₃], [53, A7, H, CH₃], [54, A8, H, CH₃], [55, A9, H, CH₃], [56, A10, H, CH₃], [57, OCH₃, H, CH₃], [58, OPh, H, CH₃], [59, NHCH₃, H, CH₃], [60, N(CH₃)₂, H, CH₃], [61, NHPh, H, CH₃], [62, All, H, CH₃], [63, H, H, C(=O)CH₃], [64, CH₃, H, C(=O)CH₃], [65, CH₂CF₃, H, C(=O)CH₃], [66, CH=CH₂, H, C(=O)CH₃], [67, CH=CHPh, H, C(=O)CH₃], [68, CH₂C≡CH, H, C(=O)CH₃], [69, CH₂CN, H, C(=O)CH₃], [70, CH₂NO₂, H, C(=O)CH₃], [71, CH₂N(CH₃)₂, H, C(=O)CH₃], [72, CH₂OCH₃, H, C(=O)CH₃], [73, CH₂OPh, H, C(=O)CH₃], [74, CH₂C(=O)OCH₃, H, C(=O)CH₃], [75, CH₂C(=O)CH₃, H, C(=O)CH₃], [76, CH₂Ph, H, C(=O)CH₃], [77, A1, H, C(=O)CH₃], [78, A2, H, C(=O)

- CH₃], [79, A3, H, C(=O)CH₃], [80, A4, H, C(=O)CH₃], [81, A5, H, C(=O)CH₃], [82, A6, H, C(=O)CH₃], [83, Ph, H, C(=O)CH₃], [84, A7, H, C(=O)CH₃], [85, A8, H, C(=O)CH₃], [86, A9, H, C(=O)CH₃], [87, A10, H, C(=O)CH₃], [88, OCH₃, H, C(=O)CH₃], [89, OPh, H, C(=O)CH₃], [90, NHCH₃, H, C(=O)CH₃], [91, N(CH₃)₂, H, C(=O)CH₃], [92, NHPH, H, C(=O)CH₃], [93, A11, H, C(=O)CH₃], [94, H, CH₃, H], [95, CH₃, CH₃, H], [96, CH₂CF₃, CH₃, H], [97, CH=CH₂, CH₃, H], [98, CH=CHPh, CH₃, H], [99, CH₂C≡CH, CH₃, H], [100, CH₂CN, CH₃, H], [101, CH₂NO₂, CH₃, H], [102, CH₂N(CH₃)₂, CH₃, H], [103, CH₂OCH₃, CH₃, H], [104, CH₂OPh, CH₃, H], [105, CH₂C(=O)OCH₃, CH₃, H], [106, CH₂C(=O)CH₃, CH₃, H], [107, CH₂Ph, CH₃, H], [108, A1, CH₃, H], [109, A2, CH₃, H], [110, A3, CH₃, H], [111, A4, CH₃, H], [112, A5, CH₃, H], [113, A6, CH₃, H], [114, Ph, CH₃, H], [115, A7, CH₃, H], [116, A8, CH₃, H], [117, A9, CH₃, H], [118, A10, CH₃, H], [119, OCH₃, CH₃, H], [120, OPh, CH₃, H], [121, NHCH₃, CH₃, H], [122, N(CH₃)₂, CH₃, H], [123, NHPH, CH₃, H], [124, A11, CH₃, H], [125, H, CH₃, CH₃], [126, CH₃, CH₃, CH₃], [127, CH₂CF₃, CH₃, CH₃], [128, CH=CH₂, CH₃, CH₃], [129, CH=CHPh, CH₃, CH₃], [130, CH₂C≡CH, CH₃, CH₃], [131, CH₂CN, CH₃, CH₃], [132, CH₂NO₂, CH₃, CH₃], [133, CH₂N(CH₃)₂, CH₃, CH₃], [134, CH₂OCH₃, CH₃, CH₃], [135, CH₂OPh, CH₃, CH₃], [136, CH₂C(=O)OCH₃, CH₃, CH₃], [137, CH₂C(=O)CH₃, CH₃, CH₃], [138, CH₂Ph, CH₃, CH₃], [139, A1, CH₃, CH₃], [140, A2, CH₃, CH₃], [141, A3, CH₃, CH₃], [142, A4, CH₃, CH₃], [143, A5, CH₃, CH₃], [144, A6, CH₃, CH₃], [145, Ph, CH₃, CH₃], [146, A7, CH₃, CH₃], [147, A8, CH₃, CH₃], [148, A9, CH₃, CH₃], [149, A10, CH₃, CH₃], [150, OCH₃, CH₃, CH₃], [151, OPh, CH₃, CH₃], [152, NHCH₃, CH₃, CH₃], [153, N(CH₃)₂, CH₃, CH₃], [154, NHPH, CH₃, CH₃], [155, A11, CH₃, CH₃], [156, H, CH₃, C(=O)CH₃], [157, CH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [158, CH₂CF₃, CH₃, C(=O)CH₃], [159, CH=CH₂, CH₃, C(=O)CH₃], [160, CH=CHPh, CH₃, C(=O)CH₃], [161, CH₂C≡CH, CH₃, C(=O)CH₃], [162, CH₂CN, CH₃, C(=O)CH₃], [163, CH₂NO₂, CH₃, C(=O)CH₃], [164, CH₂N(CH₃)₂, CH₃, C(=O)CH₃], [165, CH₂OCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [166, CH₂OPh, CH₃, C(=O)CH₃], [167, CH₂C(=O)OCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [168, CH₂C(=O)CH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [169, CH₂Ph, CH₃, C(=O)CH₃], [170, A1, CH₃, C(=O)CH₃], [171, A2, CH₃, C(=O)CH₃], [172, A3, CH₃, C(=O)CH₃], [173, A4, CH₃, C(=O)CH₃], [174, A5, CH₃, C(=O)CH₃], [175, A6, CH₃, C(=O)CH₃], [176, Ph, CH₃, C(=O)CH₃], [177, A7, CH₃, C(=O)CH₃], [178, A8, CH₃, C(=O)CH₃], [179, A9, CH₃, C(=O)CH₃], [180, A10, CH₃, C(=O)CH₃], [181, OCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [182, OPh, CH₃, C(=O)CH₃], [183, NHCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [184, N(CH₃)₂, CH₃, C(=O)CH₃], [185, NHPH, CH₃, C(=O)CH₃], [186, A11, CH₃, C(=O)CH₃], [187, H, C(=O)CH₃, H], [188, CH₃, C(=O)CH₃, H], [189, CH₂CF₃, C(=O)CH₃, H], [190, CH=CH₂, C(=O)CH₃, H], [191, CH=CHPh, C(=O)CH₃, H], [192, CH₂C≡CH, C(=O)CH₃, H], [193, CH₂CN, C(=O)CH₃, H], [194, CH₂NO₂, C(=O)CH₃, H], [195, CH₂N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, H], [196, CH₂OCH₃, C(=O)CH₃, H], [197, CH₂OPh, C(=O)CH₃, H], [198, CH₂C(=O)OCH₃, C(=O)CH₃, H], [199, CH₂C(=O)CH₃, C(=O)CH₃, H], [200, CH₂Ph, C(=O)CH₃, H], [201, A1, C(=O)CH₃, H], [202, A2, C(=O)CH₃, H], [203, A3, C(=O)CH₃, H], [204, A4, C(=O)CH₃, H], [205, A5, C(=O)CH₃, H], [206, A6, C(=O)CH₃, H], [207, Ph, C(=O)CH₃, H], [208, A7, C(=O)CH₃, H], [209, A8, C(=O)CH₃, H], [210, A9, C(=O)CH₃, H], [211, A10, C(=O)CH₃, H], [212, OCH₃, C(=O)CH₃, H], [213, OPh, C(=O)CH₃, H], [214, NHCH₃, C(=O)CH₃, H], [215, N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, H], [216, NHPH, C(=O)CH₃, H], [217, A11, C(=O)CH₃, H], [218, H, C(=O)CH₃, CH₃], [219, CH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [220, CH₂CF₃, C(=O)CH₃, CH₃], [221, CH=CH₂, C(=O)CH₃, CH₃], [222, CH=CHPh, C(=O)CH₃, CH₃], [223, CH₂C≡CH, C(=O)CH₃, CH₃], [224, CH₂CN, C(=O)CH₃, CH₃], [225, CH₂NO₂, C(=O)CH₃, CH₃], [226, CH₂N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, CH₃], [227, CH₂OCH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [228, CH₂OPh, C(=O)CH₃, CH₃], [229, CH₂C(=O)OCH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [230, CH₂C(=O)CH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [231, CH₂Ph, C(=O)CH₃, CH₃], [232, A1, C(=O)CH₃, CH₃], [233, A2, C(=O)CH₃, CH₃], [234, A3, C(=O)CH₃, CH₃], [235, A4, C(=O)CH₃, CH₃], [236, A5, C(=O)CH₃, CH₃], [237, A6, C(=O)CH₃, CH₃], [238, Ph, C(=O)CH₃, CH₃], [239, A7, C(=O)CH₃, CH₃], [240, A8, C(=O)CH₃, CH₃], [241, A9, C(=O)CH₃, CH₃], [242, A10, C(=O)CH₃, CH₃], [243, OCH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [244, OPh, C(=O)CH₃, CH₃], [245, NHCH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [246, N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, CH₃], [247, NHPH, C(=O)CH₃, CH₃], [248, A11, C(=O)CH₃, CH₃], [249, H, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [250, CH₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [251, CH₂CF₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [252, CH=CH₂, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [253, CH=CHPh, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [254, CH₂C≡CH, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [255, CH₂CN, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [256, CH₂NO₂, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [257, CH₂N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [258, CH₂OCH₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [259, CH₂OPh, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [260, CH₂C(=O)OCH₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [261, CH₂C(=O)CH₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [262, CH₂Ph, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [263, A1, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [264, A2, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [265, A3, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [266, A4, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [267, A5, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [268, A6, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [269, Ph, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [270, A7, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [271, A8, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [272, A9, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [273, A10, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [274, OCH₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [275, OPh, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [276, NHCH₃, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [277, N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [278, NHPH, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃], [279, A11, C(=O)CH₃, C(=O)CH₃].

Donde, A1 a A11 representan los siguientes grupos:



A continuación, se muestran Ejemplos de Formulación. El término "parte (s)" significa una o más partes en peso.

Ejemplo de Formulación 1

- 5 Nueve partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63) se disuelven en 37,5 partes de xileno y 37,5 partes de N,N-dimetilformamida. A esto, se añaden 10 partes de polioxietilenoestirilfeniléter y 6 partes de dodecibencensulfonato de calcio y se mezclan agitando con cuidado para obtener un concentrado emulsionable.

Ejemplo de Formulación 2

- 10 A 40 partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63) se añaden 5 partes de SORPOL 5060 (marca registrada para TOHO Chemical Industry Co., LTD.) LTD.) y se mezclan con concienzudamente. La mezcla se mezcla con 32 partes de CARPLEX #80 (marca registrada para Shionogi & Co., Ltd., do) y 23 partes de tierra de diatomeas de malla 300 usando una mezcladora de jugos para obtener un polvo humectable.

15 Ejemplo de Formulación 3

- 20 Tres partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63), 5 partes de polvo fino sintético de óxido de silicio hidrogenado, 5 partes de dodecibencensulfonato de sódico, 30 partes de bentonita y 57 partes de arcilla se mezclan agitando concienzudamente. A esta mezcla se añade una cantidad adecuada de agua. La mezcla se agita adicionalmente, se granula con un granulador, y después se seca al aire para obtener un gránulo.

Ejemplo de Formulación 4

- 25 Cuatro coma cinco partes de uno cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63), 1 parte de polvo fino sintético de óxido de silicio hidrogenado, 1 parte de Dorires B (fabricado por Sankyo) como un floculante, y 7 partes de arcilla se mezclan concienzudamente en un mortero, y después se mezclan agitando mediante un mezclador de jugos. A la mezcla resultante, se añaden 86,5 partes de arcilla trozada y se mezclan agitando con cuidado para obtener un polvo.

30 Ejemplo de Formulación 5

- 35 Diez partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63), 35 partes de una mezcla (proporción en peso de 1:1) de una sal de sulfato de amonio de polioxietilenoalquiléter y carbón blanco, y 55 partes de agua se mezclan y luego se dividen finamente con un método de trituración por vía húmeda para obtener una formulación.

Ejemplo de Formulación 6

- 40 Se disuelven 0,5 partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63) en 10 partes de diclorometano. Esta solución se mezcla con 89,5 partes de Isopar M (isoparafina: marca registrada para Exxon Chemical) para obtener una solución oleosa.

Ejemplo de Formulación 7

- 45 Se colocan 0,1 partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63) y 49,9 partes de NEO-THIOZOL (Chuo Kasei Co., Ltd.) en un tubo de aerosol. Se ajusta una válvula para aerosol al tubo. El tubo se carga con 25 partes de éter dimetilico y 25 partes de LPG. El tubo de aerosol se agita. Se ajusta un actuador al tubo para obtener un aerosol oleoso.

Ejemplo de Formulación 8

- 50 Se mezclan 0,6 partes de cualquiera de los presentes compuestos (1) a (63), 0,01 partes de BHT, 5 partes de xileno, 3,39 partes de un querosén desodorizado y 1 parte de un agente emulsionante [Atmos 300 (marca registrada para Atmos Chemical Ltd.)] para obtener una solución. Un recipiente de aerosol se carga con la solución obtenida y 50 partes de agua destilada. Se adjunta una parte de válvula al recipiente y éste luego se carga con 40 partes de un propelente (LPG) a través de la válvula a mayor presión para obtener un aerosol acuoso.

- 55 Los siguientes ejemplos de ensayo demuestran que el compuesto de la presente invención es efectivo como un ingrediente activo de una composición de control de plagas. Los compuestos de la presente invención se designan por sus números de compuestos mostrados con anterioridad.

60 Ejemplo de ensayo 1

- 65 Las formulaciones de algunos compuestos de la presente invención se obtuvieron de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5. La formulación se diluyó con agua para preparar una solución de ensayo con 500 ppm de ingrediente activo.

Se esparció un papel filtrante de un diámetro de 5,5 cm sobre la parte inferior de un recipiente de polietileno de un diámetro de 5,5 cm y se añadieron 0,7 ml de la solución de ensayo gota a gota sobre el papel filtrante. Como cebo, se colocaron 30 mg de sacarosa de modo uniforme sobre el papel filtrante. En el recipiente de polietileno, se liberaron 10 imagos hembra de *Musca domestica* y el recipiente se selló con una tapa. Después de 24 horas, se contó la cantidad de *Musca domestica* sobrevivientes o muertas y se calculó la tasa de mortalidad de la plaga de acuerdo con la siguiente ecuación.

$$\text{Tasa de mortalidad de la plaga (\%)} = (\text{cantidad de larvas muertas/cantidad de larvas ensayadas}) \times 100$$

Como resultado, el tratamiento con uno cualquiera de los compuestos de la presente invención (1), (7), (8), (10), (11), (15), (17) a (20), (23), (28) a (32), (36), (38), (40) y (42) a (44) mostró una tasa de mortalidad de plagas del 100%.

Ejemplo de ensayo 2

Las formulaciones de algunos compuestos de la presente invención se obtuvieron de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5. La formulación se diluyó con agua para preparar una solución de ensayo con 500 ppm de ingrediente activo.

En 100 ml de agua de intercambio iónico, se añadieron 0,7 ml de la solución de ensayo (concentración del ingrediente activo: 3,5 ppm). En la solución, se liberaron 20 larvas de último instar de *Culex pipiens pallens*. Después de 8 días, se contó la cantidad de *Culex pipiens pallens* supervivientes o muertas y se calculó la tasa de mortalidad de la plaga de acuerdo con la siguiente ecuación.

$$\text{Tasa de mortalidad de la plaga (\%)} = (\text{cantidad de larvas muertas/cantidad de larvas ensayadas}) \times 100$$

Como resultado, el tratamiento con uno cualquiera de los compuestos de la presente invención (1) a (13), (15) a (23), (25) a (32), (34), (36), (38), (40) a (45), (47) a (56) y (59) mostró una tasa de mortalidad de plagas del 90% o superior.

Ejemplo de ensayo 3

Las formulaciones de algunos compuestos de la presente invención se obtuvieron de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5. La formulación se diluyó con agua para preparar una solución de ensayo con 500 ppm de ingrediente activo.

Sobre repollo (*Brassicae oleracea*) en el tercer al cuarto estadio de hoja, se rociaron 20 ml de la solución de ensayo. Después de que se secase la solución de ensayo, se cortó la parte enterrada superior del repollo y luego se colocó en un recipiente de polietileno (volumen: 100 ml) junto con 5 larvas de segundo instar de *Plutella xylostella*. Después de almacenar el recipiente de polietileno a 25 °C durante 5 días, se contó la cantidad de *Plutella xylostella* supervivientes o muertas y se calculó la tasa de mortalidad de la plaga de acuerdo con la siguiente ecuación.

$$\text{Tasa de mortalidad de la plaga (\%)} = (\text{cantidad de larvas muertas/cantidad de larvas ensayadas}) \times 100.$$

Como resultado, el tratamiento con uno cualquiera de los compuestos de la presente invención (1) a (13), (15) a (23), (25), (28) a (32), (34), (36), (38), (40), (42) a (44), (47) a (51), (53) a (55), (57) y (61) mostró una tasa de mortalidad de plagas del 80% o superior.

Ejemplo de ensayo 4

Las formulaciones de algunos compuestos de la presente invención se obtuvieron de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5. La formulación se diluyó con agua para preparar una solución de ensayo con 500 ppm de ingrediente activo.

Se esparció un papel filtrante de un diámetro de 5,5 cm sobre la parte inferior de un recipiente de polietileno de un diámetro de 5,5 cm. Se cortó Insecta LF (fabricado por NOSAN CORPORATION), una dieta artificial, hasta 6 mm de espesor, se cortó a la mitad y luego se colocó sobre el papel filtrante. Después, se vertieron 2 ml de la solución de ensayo en el recipiente de polietileno. Después de que se secase al aire la solución de ensayo, se liberaron 5 larvas de cuarto instar de *Spodoptera litura* en el recipiente de polietileno y el recipiente se selló con una tapa. Después de 6 días, se contó la cantidad de *Spodoptera litura* supervivientes o muertas y se calculó la tasa de mortalidad de la plaga de acuerdo con la siguiente ecuación.

$$\text{Tasa de mortalidad de la plaga (\%)} = (\text{cantidad de larvas muertas/cantidad de larvas ensayadas}) \times 100$$

Como resultado, el tratamiento con uno cualquiera de los compuestos de la presente invención (1), (5), (7) a (11), (15) a (20) a (23), (26), (28) a (32), (34), (36), (38), (40), (42) a (44), (48) a (51), (53) y (57) mostró una tasa de mortalidad de plagas del 80% o superior.

Ejemplo de ensayo 5

5 Las formulaciones de algunos compuestos de la presente invención se obtuvieron de acuerdo con el Ejemplo de formulación 5. La formulación se diluyó con agua para preparar una solución de ensayo con 500 ppm de ingrediente activo.

10 Se esparció un papel filtrante de un diámetro de 5,5 cm sobre la parte inferior de un recipiente de polietileno de un diámetro de 5,5 cm. Se cortó Silkmate 2S (fabricado por NOSAN CORPORATION), una dieta artificial, hasta 2 mm de espesor, y después se colocó sobre el papel filtrante. Después, se vertieron 1 ml de la solución de ensayo en el recipiente de polietileno. Después de que se secase al aire la solución de ensayo, se colocó un papel filtrante de 5,5 cm de diámetro sobre la dieta artificial, y allí se colocaron 30 larvas de primer instar de *Adoxophyes orana*. El recipiente se selló con una tapa. Después de 7 días, se contó la cantidad de *Adoxophyes orana* supervivientes o muertas y se calculó la tasa de mortalidad de la plaga de acuerdo con la siguiente ecuación.

15
$$\text{Tasa de mortalidad de la plaga (\%)} = (\text{cantidad de larvas muertas} / \text{cantidad de larvas ensayadas}) \times 100$$

Como resultado, el tratamiento con uno cualquiera de los compuestos de la presente invención (1) a (5), (7) a (13), (15) a (23), (25) a (32), (34), (36), (38), (40), (42) a (44), (47) a (59) y (61) mostró una tasa de mortalidad de plagas del 90% o superior.

20

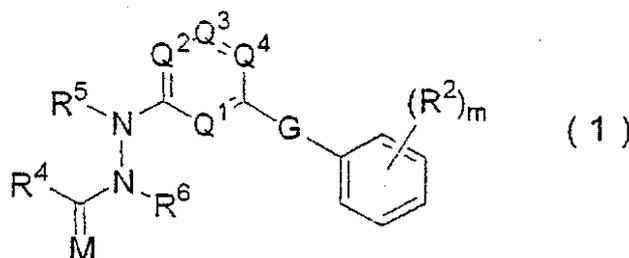
Aplicabilidad industrial

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

25

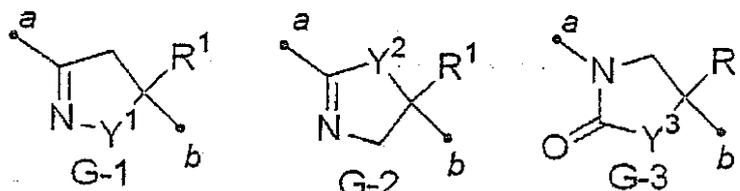
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de hidrazida representado por la fórmula (1):

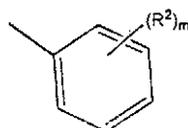


5 donde,

G representa un grupo heterocíclico de 5 miembros representado por la siguiente fórmula G-1, G-2 o G-3:



donde cada uno de $\overset{a}{\bullet}$ — $\overset{b}{\bullet}$ — representa un enlace y el $\overset{b}{\bullet}$ — está enlazado al resto



10

en la fórmula (1),

R¹ representa un grupo haloalquilo C1-C4,

Y¹ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR⁷, Y² representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR⁷ o un grupo metileno,

15 Y³ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR⁷ o un grupo metileno,

R⁷ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquenilo C2-C6, un grupo alquinilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo cicloalquilalquilo C4-C7, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilamionocarbonilo C2-C6, un grupo dialquilamionocarbonilo C3-C9, un grupo fenilo, un grupo ciano, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, M representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre,

20 Q¹, Q², Q³ y Q⁴ representan independientemente un átomo de nitrógeno o un grupo CR³,

R³ representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo nitro, un grupo ciano, un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, m representa un número entero de 0 a 5,

25 R² representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo nitro, un grupo ciano o un átomo de halógeno,

con la condición de que cuando m sea un número entero de 2 a 5, los R² puedan ser iguales o diferentes entre sí, R⁵ y R⁶ representen independientemente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo benzoilo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C12, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, R⁴ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo OR⁸, un grupo N(R⁹)R¹⁰ o un átomo de hidrógeno,

35 R⁸ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, o un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2,

40 R⁹ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, o un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, R¹⁰ represente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, o un átomo de hidrógeno, o

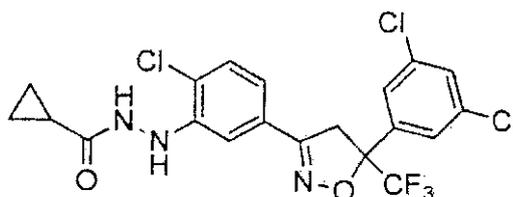
R⁹ y R¹⁰ se combinan en sus extremos para representar un grupo alcanodiilo C2-C9,

45 El Grupo E1 consiste en un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo

fenilamino opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno, y

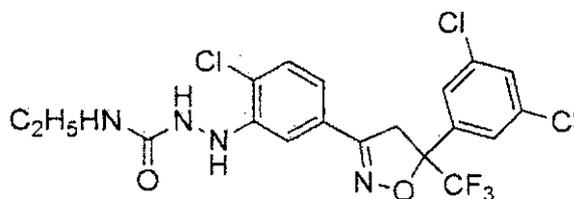
- 5 El Grupo E2 consiste en un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno.

2. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:



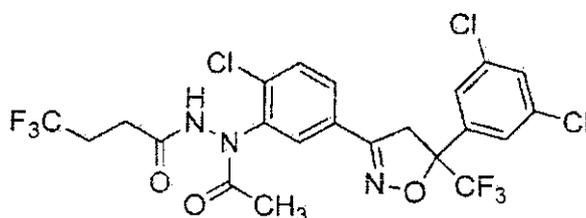
10

3. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:



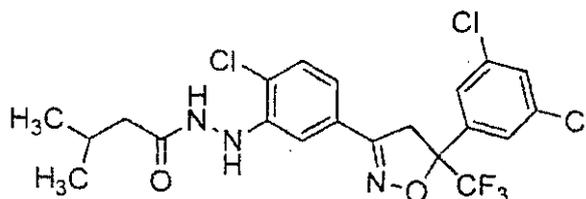
15

4. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:



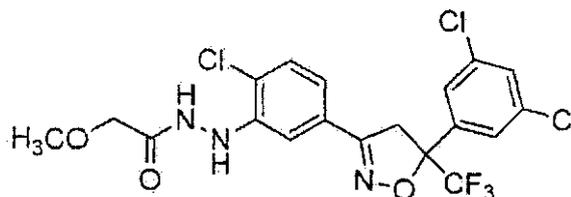
20

5. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:

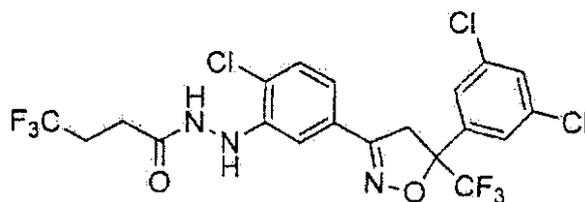


25

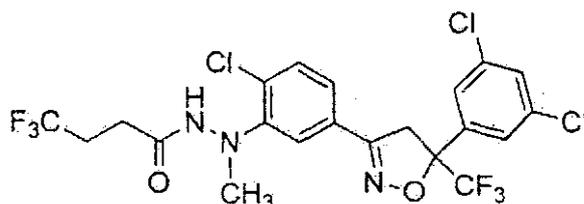
6. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:



7. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:



5 8. El compuesto de hidrazida de acuerdo con la reivindicación 1, que se representa por la siguiente fórmula:

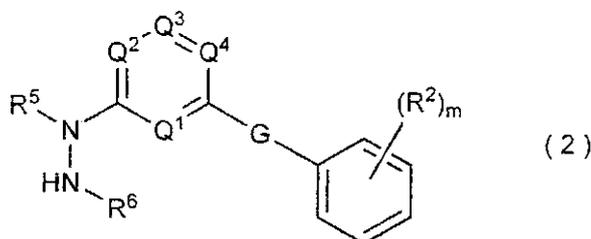


9. Una composición para el control de plagas que comprende el compuesto de hidrazida de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 como un ingrediente activo.

10

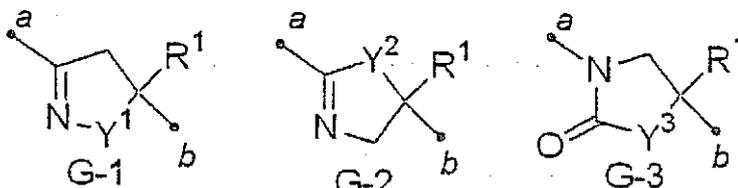
10. Un método para controlar una plaga que comprende aplicar una cantidad eficaz de un compuesto de hidrazida de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 a la plaga o al hábitat de la plaga; y

15 11. Un compuesto de hidrazina representado por la fórmula (2):

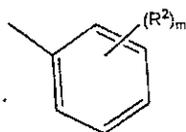


donde,

20 G representa un grupo heterocíclico de 5 miembros representado por la siguiente fórmula G-1, G-2 o G-3:



donde cada uno de $\overset{a}{\bullet}$ — y $\overset{b}{\bullet}$ — representa un enlace y el $\overset{b}{\bullet}$ — está enlazado al resto



25 en la fórmula (1),

R¹ representa un grupo haloalquilo C1-C4,

Y¹ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un grupo NR⁷,

Y² representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR⁷ o un grupo metileno,

Y³ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo NR⁷ o un grupo metileno,

30 R⁷ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo alquenilo C2-C6, un grupo alquinilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo cicloalquilalquilo C4-C7, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcóxicarbonilo C2-C6, un grupo alquilamionocarbonilo C2-C6, un grupo dialquilamionocarbonilo C3-C9, un grupo fenilo, un grupo ciano, un grupo

- formilo o un átomo de hidrógeno, Q^1 , Q^2 , Q^3 y Q^4 representan independientemente un átomo de nitrógeno o un grupo CR^3 ,
- 5 R^3 representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo nitro, un grupo ciano, un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, m representa un número entero de 0 a 5,
- R^2 representa un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfinilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo nitro, un grupo ciano o un átomo de halógeno,
- 10 con la condición de que cuando m sea un número entero de 2 a 5, los R^2 puedan ser iguales o diferentes entre sí, R^5 y R^6 representen independientemente un grupo hidrocarburo de cadena C1-C12 opcionalmente sustituido con un grupo Grupo seleccionado entre el Grupo E1, un grupo benzoílo opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C12, un grupo formilo o un átomo de hidrógeno, El Grupo E1 consiste en un grupo hidrocarburo cíclico C3-C12 opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo heterocíclico de 5 a 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenoxi opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo fenilamino opcionalmente sustituido con un grupo seleccionado entre el Grupo E2, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno, y
- 15 El Grupo E2 consiste en un grupo alquilo C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alcoxi C1-C6 opcionalmente halogenado, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo dialquilamino C2-C12, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo formilo y un átomo de halógeno.
- 20