

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 630 323**

51 Int. Cl.:

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 498/04 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

C07D 231/14 (2006.01)

C07D 231/16 (2006.01)

C07D 257/04 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **27.09.2013 PCT/JP2013/077014**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.04.2014 WO14051165**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **27.09.2013 E 13779398 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **10.05.2017 EP 2900655**

54 Título: **Compuestos de tetrazolinona y sus usos como plaguicidas**

30 Prioridad:

28.09.2012 JP 2012216038

25.12.2012 JP 2012280707

31.05.2013 JP 2013115179

04.07.2013 JP 2013140423

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

21.08.2017

73 Titular/es:

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LIMITED

(100.0%)

27-1, Shinkawa 2-chome

Chuo-ku, Tokyo, 104-8260, JP

72 Inventor/es:

ARIMORI, SADAYUKI y

SHIODA, TAKAYUKI

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 630 323 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

Compuestos de tetrazolinona y sus usos como plaguicidas

5 Esta solicitud reivindica prioridad y el beneficio de la Solicitud de Patente Japonesa n.º 2012-216038 presentada el 28 de septiembre de 2012, 2012-280707 presentada el 25 de diciembre de 2012, 2013-115179 presentada el 31 de mayo de 2013 y 2013-140423 presentada el 4 de julio de 2013.

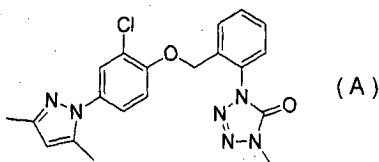
Campo técnico

10 La presente invención se refiere a compuestos de tetrazolinona y sus usos.

Técnica anterior

15 Hasta ahora, se han desarrollado ampliamente varios fármacos para controlar plagas y proporcionan un práctico, pero en algunos casos, estos fármacos pueden no ejercer suficiente eficacia.

Además, se han conocido como compuestos que tienen anillos de tetrazolinona, 1-{2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]metil}-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona representados por la siguiente fórmula (A): (véase Documento de Patente 1).



LISTA DE CITAS

25 DOCUMENTO DE PATENTE

Documento de Patente 1: folleto WO 1999/46246

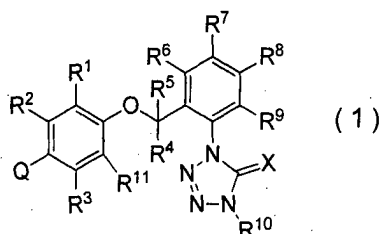
30 Sumario de la invención

Un objetivo de la presente invención es proporcionar un compuesto que tenga una excelente eficacia para controlar plagas.

35 Los inventores han estudiado intensamente para encontrar que los compuestos que tienen una excelente eficacia para controlar plagas y como resultado, han encontrado que un compuesto de tetrazolinona de la siguiente fórmula (I) tiene una excelente eficacia para controlar plagas, que, por lo tanto, ha completado la presente invención.

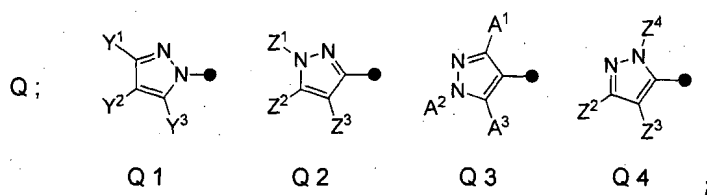
Específicamente, la presente invención incluye los siguientes [1] a [23].

40 [1] Un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (1):



45 [en la que

Q representa un grupo seleccionado entre el siguiente grupo: Q1, Q2, Q3 o Q4:



R¹, R², R³ y R¹¹ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6, un grupo haloalquino C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;

R⁴ y R⁵ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3; R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C4, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alqueno C2-C4 o un grupo haloalqueno C2-C4;

R⁷, R⁸ y R⁹ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3 o un grupo alcoxi C1-C3;

R¹⁰ representa un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3, un grupo alquino C2-C3, un grupo haloalquino C2-C3, un grupo cicloalquilo C3-C5 o un grupo halocicloalquilo C3-C5;

X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

A¹ y A³ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6, un grupo haloalquino C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹, o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;

A², Z¹ y Z⁴ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un grupo amino, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquino C3-C6, un grupo haloalquino C3-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, un grupo halocicloalquilsulfonilo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo haloalquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;

Y¹, Y², Y³, Z² y Z³ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo aldehído, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6, un grupo haloalquino C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo haloalquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C3-C6, un grupo haloalquiltio C3-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C1-C8, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo aminocarbonilo, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹; o

Y¹ e Y² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); o

Y² e Y³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado puede contener

opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); o Z¹ y Z² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono o con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado pueda contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno, átomos de nitrógeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); o Z² y Z³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado pueda contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno, átomos de nitrógeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); y el Grupo P¹: un grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo halocicloalquilo C3-C6, un grupo alcoxi C1-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquilitio C1-C4 o un grupo haloalquilitio C1-C4].

[2] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [1] en el que Q representa Q1.

[3] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [1] en el que Q representa Q2.

[4] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [1] en el que Q representa Q3.

[5] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [1] en el que Q representa Q4.

[6] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [5],

en el que

R¹ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alquinilo C2-C3, un grupo haloalquinilo C2-C3, un grupo cicloalquilo C3-C5, un grupo halocicloalquilo C3-C5, un grupo alcoxi C1-C3 o un grupo haloalcoxi C1-C3;

R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno;

R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3;

R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alquenilo C2-C4 o un grupo haloalquenilo C2-C4;

R¹⁰ representa un grupo metilo; y

X representa un átomo de oxígeno.

[7] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [2] o [6], en el que

Y¹ e Y² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco o seis miembros;

Y² e Y³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco o seis miembros;

cuando cada uno de Y¹, Y² e Y³ no forman el anillo saturado de cinco o seis miembros,

Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4.

[8] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [3] o [6],

en el que

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C3-C6, un grupo haloalquinilo C3-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo halocicloalquilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6; como alternativa, Z¹ y Z² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono o el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco o seis miembros; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4.

[9] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [2], [6] o [7],

en el que

Y¹ e Y² se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y¹ e Y² se unen para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros;

Y² e Y³ se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y² e Y³ se unen para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros;

cuando cada uno de Y¹, Y² e Y³ no forman el anillo saturado de cinco o seis miembros,

Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo ciclopropilo;

Y² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo alcoxi C1-C3; y

Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

[10] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [3] o [6], en el que

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquiloxi C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C6; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4.

[11] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [3] o [6], en el que

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo 2-propinilo, un grupo metiltio, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo metilo.

[12] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [3], [6] o [8], en el que

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo metilo.

[13] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1], [2], [6] o [7], en el que

Y¹ e Y² se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que combina junto con los átomos de carbono a los que están unidos para formar un anillo de seis miembros;

Y² e Y³ se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que combina junto con los átomos de carbono a los que están unidos para formar un anillo de seis miembros;

cuando cada uno de Y¹, Y² e Y³ no forman el anillo saturado de seis miembros,

Y¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;

Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo alcoxi C1-C3; y

Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

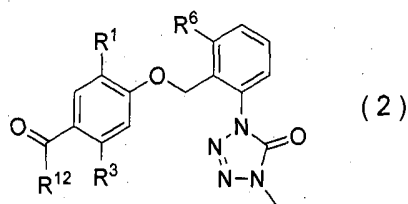
[14] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [13], en el que

R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; y

R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi o un grupo etoxi.

[15] Un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (2):



[en la que

R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo o un grupo ciclopropilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi o un grupo etoxi; y

R¹² representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C1-C6].

[16] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [15], en el que

R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo;

R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metoxi; y

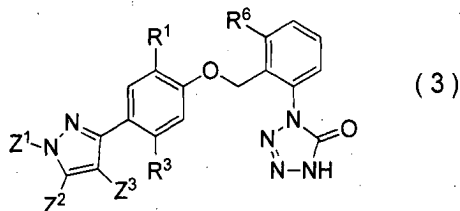
R¹² representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo.

[17] Un agente para controlar plagas que comprende el compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [16].

[18] Un método para controlar plagas que comprende aplicar una cantidad eficaz del compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [16] para planta o suelo.

5 [19] Uso del compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [16] para controlar las plagas.

[20] Un compuesto de tetrazolinona representado por una fórmula (3):



10 [en la que

R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

15 R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2;

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C2, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2, un átomo de halógeno o un grupo ciano; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano].

20

[21] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [20], en el que

R¹ representa un grupo metilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno;

25 R⁶ representa un grupo alquilo C1-C2;

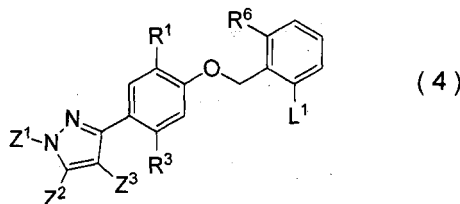
Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;

Z² representa un grupo alcoxi C1-C2 o un átomo de halógeno;

Z³ representa un grupo alquilo C1-C3.

30

[22] Un compuesto de pirazol representado por una fórmula (4):



[en la que

35 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2;

40 Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C2, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2, un átomo de halógeno o un grupo ciano;

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano; y

L¹ representa un grupo nitro, un grupo amino, un grupo isocianato, un grupo carboxilo, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un átomo de halógeno, un grupo halocarbonilo, NSO, C(O)N₃, C(O)NH₂, C(O)NHCl, C(O)NHBr o C(O)NHOH].

45

[23] El compuesto de pirazol de acuerdo con [22], en el que

R¹ representa un grupo metilo;

50 R³ representa un átomo de hidrógeno;

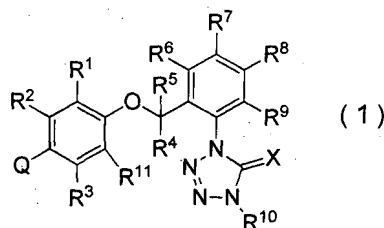
R⁶ representa un grupo alquilo C1-C2;

- Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;
- Z² representa un grupo alcoxi C1-C2 o un átomo de halógeno;
- Z³ representa un grupo alquilo C1-C3; y
- L¹ representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato.

5 La presente invención puede controlar plagas.

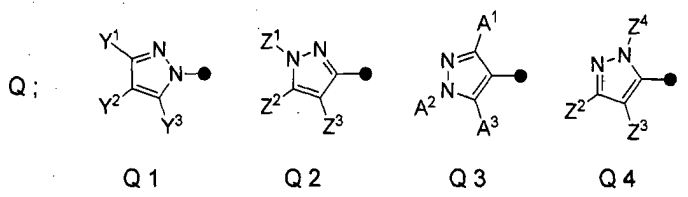
Descripción de las realizaciones

10 El compuesto de la presente invención (en lo sucesivo en el presente documento, denominado algunas veces como "el presente compuesto") es un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (1):



15 [en la que

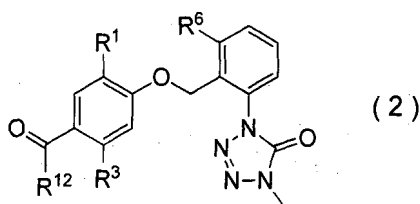
Q representa un grupo seleccionado entre el siguiente grupo: Q1, Q2, Q3 o Q4:



- 20 R¹, R², R³ y R¹¹ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;
- 30 R⁴ y R⁵ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3;
- R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C4, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alqueno C2-C4 o un grupo haloalqueno C2-C4;
- 35 R⁷, R⁸ y R⁹ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3 o un grupo alcoxi C1-C3;
- R¹⁰ representa un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3, un grupo cicloalquilo C3-C5 o un grupo halocicloalquilo C3-C5;
- 40 X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
- A¹ y A³ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹, o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;
- 50 A², Z¹ y Z⁴ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un grupo amino, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo

haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, un grupo halocicloalquilsulfonilo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo haloalquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹; Y¹, Y², Y³, Z² y Z³ representan independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo aldehído, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C1-C8, un grupo pentafluorosulfonilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo aminocarbonilo, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹; o Y¹ e Y² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); o Y² e Y³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); o Z¹ y Z² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono o con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado pueda contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno, átomos de nitrógeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); o Z² y Z³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros (con la condición de que el anillo saturado pueda contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno, átomos de nitrógeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); y el Grupo P¹: un grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo halocicloalquilo C3-C6, un grupo alcoxi C1-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4].

Además, también se incluye en la presente invención un compuesto de tetrazolinona representado por una fórmula (2):



[en la que

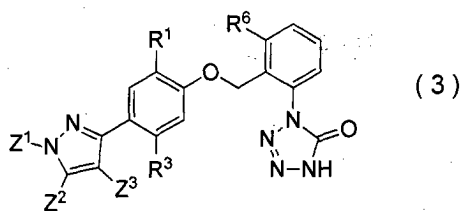
R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo o un grupo ciclopropilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi o un grupo etoxi; y R¹² representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C1-C6],

que se usa en una preparación del presente compuesto y tiene una excelente eficacia para controlar las plagas.

Además, también se incluye en la presente invención un compuesto de tetrazolinona representado por una fórmula (3):

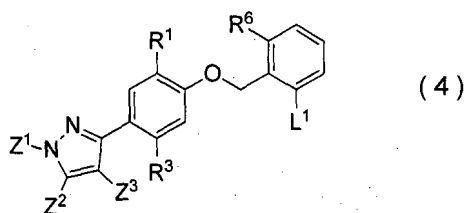


[en la que

- 5 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;
 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;
 R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2;
 Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;
 10 Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C2, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2,
 un átomo de halógeno o un grupo ciano; y
 Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano],

que se usa en una preparación del presente compuesto.

- 15 Además, también se incluye en la presente invención un compuesto de pirazol representado por una fórmula (4):



[en la que

- 20 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;
 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;
 R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2;
 Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;
 25 Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C2, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2,
 un átomo de halógeno o un grupo ciano;
 Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano; y
 L¹ representa un grupo nitro, un grupo amino, un grupo isocianato, un grupo carboxilo, un grupo alcoxycarbonilo
 C2-C6, un átomo de halógeno, un grupo halocarbonilo, NSO, C(O)N₃, C(O)NH₂, C(O)NHCl, C(O)NHBr o
 30 C(O)NHOH] (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "el presente compuesto de pirazol").

En lo sucesivo en el presente documento, la presente invención se explica con detalle.

El sustituyente a usarse en el presente documento se describe específicamente a continuación.

- 35 La expresión "átomo de halógeno" incluye, por ejemplo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

- 40 La expresión "grupo alquilo C1-C6" representa un grupo alquilo lineal o ramificado de uno a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, 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 y un grupo hexilo.

- 45 La expresión "grupo alquilo C1-C5" representa un grupo alquilo lineal o ramificado de uno a cinco átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, 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 y un grupo pentilo.

La expresión "grupo alquilo C1-C4" representa un grupo alquilo lineal o ramificado de uno a cuatro átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo sec-butilo y un grupo *terc*-butilo.

50

La expresión "grupo alquilo C1-C3" incluye, por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo.

La expresión "grupo alquilo C1-C2" incluye, por ejemplo, un grupo metilo y un grupo etilo.

5 La expresión "grupo haloalquilo C1-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilo C1-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo monofluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo clorofluorometilo, un grupo diclorofluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-cloro-2-fluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, un grupo 2-fluoropropilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 2,2-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 3-(fluorometil)-2-fluoroetilo, un grupo 4-fluorobutilo y un grupo 2,2-difluorohexilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

20 La expresión "grupo haloalquilo C1-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilo C1-C4 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo monofluorometilo, un grupo monoclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo clorofluorometilo, un grupo diclorofluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-cloro-2-fluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, un grupo 2-fluoropropilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 2,2-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 3-(fluorometil)-2-fluoroetilo y un grupo 4-fluorobutilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

30 La expresión "grupo haloalquilo C1-C3" incluye, por ejemplo, un grupo clorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo fluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo clorofluorometilo, un grupo diclorofluorometilo, un grupo clorodifluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-cloroetilo, un grupo 2,2-dicloroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo pentacloroetilo, un grupo 2-cloro-2-fluoroetilo, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetilo, un grupo 2-fluoropropilo, un grupo 3-fluoropropilo, un grupo 2,2-difluoropropilo, un grupo 2,3-difluoropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo heptafluoropropilo y un grupo 1-(fluorometil)-2-fluoroetilo.

35 La expresión "grupo perfluoroalquilo C1-C6" representa un grupo en el que todos los átomos de hidrógeno del grupo alquilo C1-C6 lineal o ramificado están sustituidos con un átomo de flúor, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo heptafluoropropilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo nonafluorobutilo, un grupo nonafluoro-*tert*-butilo, un grupo undecafluoropentilo y un grupo dodecafluorohexilo.

40 La expresión "grupo cicloalquilo C3-C6" representa un grupo alquilo, cíclico de tres a seis átomos de carbono, y abarca un grupo cicloalquilo que tiene un grupo alquilo, e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dimetilciclopropilo y un grupo 2,3-dimetilciclopropilo.

45 La expresión "grupo cicloalquilo C3-C5" representa un grupo alquilo cíclico de tres a cinco átomos de carbono, y abarca un grupo cicloalquilo que tiene un grupo alquilo, e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo 1-metilciclopropilo, un grupo 2-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dimetilciclopropilo y un grupo 2,3-dimetilciclopropilo.

50 La expresión "grupo cicloalquilo C3-C4" representa un grupo alquilo cíclico de tres a cuatro átomos de carbono, y abarca un grupo cicloalquilo que tiene un grupo alquilo, e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo y un grupo 1-metilciclopropilo.

55 La expresión "grupo cicloalquilmetilo C4-C7" representa un grupo metilo que tiene un alquilo cíclico de tres a seis átomos de carbono, y el grupo alquilo cíclico además, puede contener opcionalmente un grupo o grupos alquilo y el número de átomos de carbono es de cuatro a siete. El grupo cicloalquilo C4-C7 incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilmetilo, un grupo ciclobutilmetilo, un grupo ciclopentilmetilo, un grupo ciclohexilmetilo, un grupo 1-metilciclopropilmetilo, un grupo 2-metilciclopropilmetilo y un grupo 2,2-dimetilciclopropilmetilo.

60 La expresión "grupo halocicloalquilo C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo cicloalquilo C3-C6 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo un grupo 1-fluorociclopropilo, un grupo 2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilo, un grupo 1-clorociclopropilo, un grupo 2-cloro-2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilo, un grupo 2,2-dibromociclopropilo, un grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilo, un grupo 1-(trifluorometil)ciclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclobutilo, un grupo 1-fluorociclobutilo, un grupo 1-clorociclobutilo, un grupo 2-clorociclopentilo, un grupo 3-clorociclopentilo, un grupo 3,3-difluorociclopentilo, un grupo

1-fluorociclohexilo, un grupo 2,2-difluorociclohexilo, un grupo 3,3-difluorociclohexilo y un grupo 4,4-difluorociclohexilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

5 La expresión "grupo halocicloalquilo C3-C5" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo cicloalquilo C3-C5 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo un grupo 1-fluorociclopropilo, un grupo 2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilo, un grupo 1-clorociclopropilo, un grupo 2-cloro-2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilo, un grupo 2,2-dibromociclopropilo, un grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilo, un grupo 1-(trifluorometil)ciclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclobutilo, un grupo 2-clorociclopentilo y un grupo 3-clorociclopentilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

15 La expresión "grupo alqueno C2-C6" representa un grupo alqueno lineal o ramificado, de dos a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo 1-propeno, un grupo isopropeno, un grupo 2-propeno, un grupo 1-butenilo, un grupo 1-metil-1-propeno, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propeno, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-metil-1-propeno, un grupo 2-metil-2-propeno, un grupo 1,3-butadieno, un grupo 1-penteno, un grupo 1-etil-2-propeno, un grupo 2-penteno, un grupo 1-metil-1-butenilo, un grupo 3-penteno, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 4-penteno, un grupo 1-metil-3-butenilo, un grupo 3-metil-1-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-2-propeno, un grupo 1,1-dimetil-2-propeno, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 3-metil-2-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-1-propeno, un grupo 2-metil-3-butenilo, un grupo 3-metil-3-butenilo, un grupo 1,3-pentadieno, un grupo 1-vinil-2-propeno, un grupo 1-hexeno y un grupo 5-hexeno.

25 Una expresión "grupo haloalqueno C2-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alqueno C2-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-clorovinilo, un grupo 2-bromovinilo, un grupo 2-yodovinilo, un grupo 3-cloro-2-propeno, un grupo 3-bromo-2-propeno, un grupo 1-clorometilvinilo, un grupo 2-bromo-1-metilvinilo, un grupo 1-trifluorometilvinilo, un grupo 3,3,3-tricloro-1-propeno, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propeno, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propeno, un grupo 1-trifluorometil-2,2-difluorovinilo, un grupo 2-cloro-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-propeno, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propeno, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-butenilo, un grupo 1-bromometil-2-propeno, un grupo 3-cloro-2-butenilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 4-bromo-4,4-difluoro-2-butenilo, un grupo 3-bromo-3-butenilo, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, un grupo 3,4,4-tribromo-3-butenilo, un grupo 3-bromo-2-metil-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propeno, un grupo 3,3,3-trifluoro-2-metil-1-propeno, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-metil-1-propeno, un grupo 3,4,4-trifluoro-1,3-butadieno, un grupo 3,4-dibromo-1-penteno, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-butenilo, un grupo 3,3,4,4,5,5,5-heptafluoro-1-penteno, un grupo 5,5-difluoro-4-penteno, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-penteno, un grupo 3,4,4,4-tetrafluoro-3-trifluorometil-1-butenilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-3-metil-2-butenilo, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadieno, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexeno, un grupo 3,4,4,5,5,5-hexafluoro-3-trifluorometil-1-penteno, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-penteno y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-penteno. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

45 La expresión "grupo alqueno C3-C6" representa un grupo alqueno, lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propeno, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propeno, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-metil-2-propeno, un grupo 1-etil-2-propeno, un grupo 2-penteno, un grupo 3-penteno, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 4-penteno, un grupo 1-metil-3-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-2-propeno, un grupo 1,1-dimetil-2-propeno, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 3-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-3-butenilo, un grupo 3-metil-3-butenilo, un grupo 1-vinil-2-propeno, un grupo 2-hexeno, un grupo 3-hexeno, un grupo 4-hexeno y un grupo 5-hexeno.

50 Una expresión "grupo haloalqueno C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alqueno C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 3-cloro-2-propeno, un grupo 3-bromo-2-propeno, un grupo 2-cloro-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-propeno, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propeno, un grupo 1-bromometil-2-propeno, un grupo 3-cloro-2-butenilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 4-bromo-4,4-difluoro-2-butenilo, un grupo 3-bromo-3-butenilo, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, un grupo 3,4,4-tribromo-3-butenilo, un grupo 3-bromo-2-metil-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propeno, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 3,4-dibromo-1-penteno, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-butenilo, un grupo 5,5-difluoro-4-penteno, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-penteno, un grupo 4,4,4-trifluoro-3-metil-2-butenilo, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadieno, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexeno, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-penteno y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-penteno. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

65 La expresión "grupo alqueno C2-C4" incluye, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo 1-propeno, un grupo isopropeno, un grupo 2-propeno, un grupo 1-butenilo, un grupo 1-metil-1-propeno, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propeno, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-metil-1-propeno y un grupo 2-metil-2-propeno.

La expresión "grupo alqueno C2-C3" incluye, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo 1-propeno, un grupo isopropeno y un grupo 2-propeno.

5 Una expresión "grupo haloalqueno C2-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alqueno C2-C4 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-clorovinilo, un grupo 2-bromovinilo, un grupo 2-yodovinilo, un grupo 3-cloro-2-propeno, un grupo 3-bromo-2-propeno, un grupo 1-clorometilvinilo, un grupo 2-bromo-1-metilvinilo, un grupo 1-trifluorometilvinilo, un grupo 3,3,3-tricloro-1-propeno, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propeno, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propeno, un grupo 1-trifluorometil-2,2-diflorovinilo, un grupo 2-cloro-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-propeno, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propeno, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-butenilo, un grupo 1-bromometil-2-propeno, un grupo 3-cloro-2-butenilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 4-bromo-4,4-difluoro-2-butenilo, un grupo 3-bromo-3-butenilo, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenilo, un grupo 3,4,4-tribromo-3-butenilo, un grupo 3-bromo-2-metil-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propeno, un grupo 3,3,3-trifluoro-2-metil-1-propeno, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-metil-1-propeno y un grupo 3,4,4-trifluoro-1,3-butadieno. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

20 Una expresión "grupo haloalqueno C2-C3" incluye, por ejemplo, un grupo 2-clorovinilo, un grupo 2-bromovinilo, un grupo 2-yodovinilo, un grupo 3-cloro-2-propeno, un grupo 3-bromo-2-propeno, un grupo 1-clorometilvinilo, un grupo 2-bromo-1-metilvinilo, un grupo 1-trifluorometilvinilo, un grupo 3,3,3-tricloro-1-propeno, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propeno, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propeno, un grupo 1-trifluorometil-2,2-diflorovinilo, un grupo 2-cloro-2-propeno, un grupo 3,3-difluoro-2-propeno y un grupo 2,3,3-tricloro-2-propeno.

25 La expresión "grupo alquino C2-C6" representa un grupo alquino de dos a seis átomos de carbono que puede ser lineal o ramificado e incluye, por ejemplo, un grupo etino, un grupo propargilo, un grupo 1-butina-3-ilo, un grupo 3-metil-1-butina-3-ilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-hexinilo y un grupo 5-hexinilo.

30 La expresión "grupo haloalquino C2-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquino C2-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo fluoroetino, un grupo 3-fluoro-2-propino, un grupo 3-cloro-2-propino, un grupo 3-bromo-2-propino, un grupo 3-yodo-2-propino, un grupo 3-cloro-1-propino, un grupo 5-cloro-4-pentinilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-propino, un grupo 3,3-difluoro-1-propino, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-2-pentinilo, un grupo perfluoro-3-pentinilo y un grupo perfluoro-1-hexinilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

40 La expresión "grupo alquino C3-C6" representa un grupo alquino de tres a seis átomos de carbono que puede ser lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propino, un grupo 1-butina-3-ilo, un grupo 3-metil-1-butina-3-ilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-hexinilo y un grupo 5-hexinilo.

45 La expresión "grupo haloalquino C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquino C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 3-cloro-2-propino, un grupo 3-bromo-2-propino, un grupo 3-yodo-2-propino, un grupo 5-cloro-4-pentinilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-2-pentinilo y un grupo perfluoro-3-pentinilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

50 La expresión "grupo alquino C2-C3" incluye, por ejemplo, un grupo etino, un grupo 1-propino y un grupo 2-propino.

La expresión "grupo alquino C3-C4" incluye, por ejemplo, un grupo 2-propino, un grupo 2-butinilo y un grupo 3-butinilo.

55 La expresión "grupo haloalquino C2-C3" incluye, por ejemplo, un grupo fluoroetino, un grupo 3-fluoro-2-propino, un grupo 3-cloro-2-propino, un grupo 3-bromo-2-propino, un grupo 3-yodo-2-propino, un grupo 3-cloro-1-propino, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-propino y un grupo 3,3-difluoro-1-propino.

60 La expresión "grupo alcoxi C1-C6" representa un grupo alcoxi de uno a seis átomos de carbono que puede ser lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propiloxi, un grupo isopropiloxi, un grupo butiloxi, un grupo isobutiloxi, un grupo sec-butiloxi, un grupo *terc*-butiloxi, un grupo pentiloxi, un grupo isoamiloxi, un grupo neopentiloxi, un grupo 2-pentiloxi, un grupo 3-pentiloxi, un grupo 2-metilbutiloxi, un grupo hexiloxi, un grupo isohexiloxi, un grupo 3-metilpentiloxi y un grupo 4-metilpentiloxi.

65 La expresión "grupo alcoxi C1-C4" representa un grupo alcoxi de uno a cuatro átomos de carbono que puede ser lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propiloxi, un grupo isopropiloxi,

un grupo butiloxi, un grupo isobutiloxi, un grupo sec-butiloxi y un grupo *terc*-butiloxi.

La expresión "grupo alcoxi C1-C3" incluye, por ejemplo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo propiloxi y un grupo isopropiloxi.

- 5 La expresión "grupo alcoxi C1-C2" incluye, por ejemplo, un grupo metoxi y un grupo etoxi.

La expresión "grupo haloalcoxi C1-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alcoxi C1-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo clorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo fluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo clorofluorometoxi, un grupo diclorofluorometoxi, un grupo clorodifluorometoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo pentacloroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2,2,2-tribromoetoxi, un grupo 2,2,2-triyodoetoxi, un grupo 2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, un grupo heptafluoropropoxi, un grupo heptacloropropoxi, un grupo heptabromopropoxi, un grupo heptayodopropoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo 3,3,3-tricloropropoxi, un grupo 3,3,3-tribromopropoxi, un grupo 3,3,3-triyodopropoxi, un grupo 2-fluoropropoxi, un grupo 3-fluoropropoxi, un grupo 2,2-difluoropropoxi, un grupo 2,3-difluoropropoxi, un grupo 2-cloropropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 2,3-dicloropropoxi, un grupo 2-bromopropoxi, un grupo 3-bromopropoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo nonafluorobutoxi, un grupo nonaclorobutoxi, un grupo nonabromobutoxi, un grupo nonayodobutoxi, un grupo perfluoropentiloxi, un grupo percloropentiloxi, un grupo perbromopentiloxi, un grupo perfluorohexiloxi, un grupo perclorohexiloxi, un grupo perbromohexiloxi y un grupo peryodohexiloxi. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo haloalcoxi C1-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alcoxi C1-C4 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo clorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo fluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo clorofluorometoxi, un grupo diclorofluorometoxi, un grupo clorodifluorometoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo pentacloroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2,2,2-tribromoetoxi, un grupo 2,2,2-triyodoetoxi, un grupo 2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, un grupo heptafluoropropoxi, un grupo heptacloropropoxi, un grupo heptabromopropoxi, un grupo heptayodopropoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo 3,3,3-tricloropropoxi, un grupo 3,3,3-tribromopropoxi, un grupo 3,3,3-triyodopropoxi, un grupo 2-fluoropropoxi, un grupo 3-fluoropropoxi, un grupo 2,2-difluoropropoxi, un grupo 2,3-difluoropropoxi, un grupo 2-cloropropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 2,3-dicloropropoxi, un grupo 2-bromopropoxi, un grupo 3-bromopropoxi, un grupo 2,3,3-trifluoropropoxi, un grupo nonafluorobutoxi, un grupo nonaclorobutoxi, un grupo nonabromobutoxi y un grupo nonayodobutoxi. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo haloalcoxi C1-C3" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alcoxi C1-C3 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometoxi, un grupo triclorometoxi, un grupo clorometoxi, un grupo diclorometoxi, un grupo fluorometoxi, un grupo difluorometoxi, un grupo clorofluorometoxi, un grupo diclorofluorometoxi, un grupo clorodifluorometoxi, un grupo pentafluoroetoxi, un grupo pentacloroetoxi, un grupo 2,2,2-tricloroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2,2,2-tribromoetoxi, un grupo 2,2,2-triyodoetoxi, un grupo 2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloroetoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2-fluoroetoxi, un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, un grupo heptafluoropropoxi, un grupo heptacloropropoxi, un grupo heptabromopropoxi, un grupo heptayodopropoxi, un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi, un grupo 3,3,3-tricloropropoxi, un grupo 3,3,3-tribromopropoxi, un grupo 3,3,3-triyodopropoxi, un grupo 2-fluoropropoxi, un grupo 3-fluoropropoxi, un grupo 2,2-difluoropropoxi, un grupo 2,3-difluoropropoxi, un grupo 2-cloropropoxi, un grupo 3-cloropropoxi, un grupo 2,3-dicloropropoxi, un grupo 2-bromopropoxi, un grupo 3-bromopropoxi y un grupo 3,3,3-trifluoropropoxi. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquiltio C1-C6" representa un grupo alquiltio de uno a seis átomos de carbono que puede ser lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo n-propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo butiltio, un grupo sec-butiltio, un grupo *terc*-butiltio, un grupo pentiltio, un grupo isopentiltio, un grupo neopentiltio, un grupo n-hexiltio, un grupo isohexiltio y un grupo sec-hexiltio.

La expresión "grupo haloalquiltio C1-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquiltio C1-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo monofluorometiltio, un grupo difluorometiltio, un grupo trifluorometiltio, un grupo triclorometiltio, un grupo tribromometiltio, un grupo triyodometiltio, un grupo clorofluorometiltio, un grupo pentafluoroetiltio, un grupo pentacloroetiltio, un grupo pentabromoetiltio, un grupo pentayodoetiltio, un grupo 2,2,2-tricloroetiltio, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio, un grupo 2,2,2-tribromoetiltio, un grupo 2,2,2-triyodoetiltio, un grupo 2,2-difluoroetiltio, un grupo heptafluoropropiltio, un grupo heptacloropropiltio, un grupo heptabromopropiltio, un grupo heptayodopropiltio, un grupo 3,3,3-trifluoropropiltio, un grupo 3,3,3-tricloropropiltio, un grupo 3,3,3-tribromopropiltio, un grupo 3,3,3-triyodopropiltio, un grupo 2,2-difluoropropiltio, un grupo 2,3,3-trifluoropropiltio, un grupo nonafluorobutiltio, un grupo

nonaflorobutiltio, un grupo nonabromobutiltio, un grupo nonayodobutiltio, un grupo perfluoropentiltio, un grupo percloropentiltio, un grupo perbromopentiltio, un grupo perfluorohexiltio, un grupo perclorohexiltio, un grupo perbromohexiltio y un grupo peryodohexiltio. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

5 La expresión "grupo alquiltio C1-C4" incluye, por ejemplo, un grupo metiltio, un grupo etiltio, un grupo propiltio, un grupo isopropiltio, un grupo butiltio, un grupo isobutiltio y un grupo *terc*-butiltio.

La expresión "grupo alquiltio C1-C2" incluye, por ejemplo, un grupo metiltio y un grupo etiltio.

10 La expresión "grupo haloalquiltio C1-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquiltio C1-C4 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo monofluorometiltio, un grupo difluorometiltio, un grupo trifluorometiltio, un grupo triclorometiltio, un grupo tribromometiltio, un grupo triyodomeltio, un grupo clorofluorometiltio, un grupo pentafluorometiltio, un grupo pentaclorometiltio, un grupo pentabromometiltio, un grupo pentayodometiltio, un grupo 2,2,2-tricloroetiltio, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio, un grupo 2,2,2-tribromoetiltio, un grupo 2,2,2-triyodoetiltio y un grupo 2,2-difluoroetiltio. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

20 La expresión "grupo alquenioloxi C3-C6" representa un grupo alquenioloxi lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propenioloxi, un grupo 2-butenioloxi, un grupo 1-metil-2-propenioloxi, un grupo 3-butenioloxi, un grupo 2-metil-2-propenioloxi, un grupo 2-pentenioloxi, un grupo 3-pentenioloxi, un grupo 4-pentenioloxi, un grupo 1-metil-3-butenioloxi, un grupo 1,2-dimetil-2-propenioloxi, un grupo 1,1-dimetil-2-propenioloxi, un grupo 2-metil-2-butenioloxi, un grupo 3-metil-2-butenioloxi, un grupo 2-metil-3-butenioloxi, un grupo 3-metil-3-butenioloxi, un grupo 1-vinil-2-propenioloxi y un grupo 5-hexenioloxi.

La expresión "grupo haloalquenioloxi C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquenioloxi C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 3-cloro-2-propenioloxi, un grupo 3-bromo-2-propenioloxi, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propenioloxi, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propenioloxi, un grupo 2-cloro-2-propenioloxi, un grupo 3,3-difluoro-2-propenioloxi, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propenioloxi, un grupo 3,3-dicloro-2-propenioloxi, un grupo 3,3-dibromo-2-propenioloxi, un grupo 3-fluoro-3-cloro-2-propenioloxi, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-butenioloxi, un grupo 1-bromometil-2-propenioloxi, un grupo 3-cloro-2-butenioloxi, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butenioloxi, un grupo 4-bromo-4,4-difluoro-2-butenioloxi, un grupo 3-bromo-3-butenioloxi, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-butenioloxi, un grupo 3,4,4-tribromo-3-butenioloxi, un grupo 3-bromo-2-metil-2-propenioloxi, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propenioloxi, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenioloxi, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-butenioloxi, un grupo 5,5-difluoro-4-pentenioloxi, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-pentenioloxi, un grupo 4,4,4-trifluoro-3-metil-2-butenioloxi, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadienioloxi, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexenioloxi, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-pentenioloxi y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-pentenioloxi. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquinioloxi C3-C6" representa un grupo alquinioloxi lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propinioloxi, un grupo 1-butina-3-iloxi, un grupo 3-metil-1-butina-3-iloxi, un grupo 2-butinioloxi, un grupo 3-butinioloxi, un grupo 2-pentinioloxi, un grupo 3-pentinioloxi, un grupo 4-pentinioloxi y un grupo 5-hexinioloxi.

La expresión "grupo alquinioloxi C3-C4" representa un grupo alquinioloxi lineal o ramificado de tres a cuatro átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propinioloxi, un grupo 1-butina-3-iloxi y un grupo 2-butinioloxi.

50 La expresión "grupo haloalquinioloxi C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquinioloxi C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 3-cloro-2-propinioloxi, un grupo 3-bromo-2-propinioloxi, un grupo 3-yodo-2-propinioloxi, un grupo 5-cloro-4-pentinioloxi, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinioloxi, un grupo perfluoro-2-butinioloxi, un grupo perfluoro-3-butinioloxi, un grupo perfluoro-2-pentinioloxi, un grupo perfluoro-3-pentinioloxi, un grupo perfluoro-4-pentinioloxi y un grupo perfluoro-5-hexinioloxi. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquenioltio C3-C6" representa un grupo alquenioltio lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propenioltio, un grupo 2-butenioltio, un grupo 1-metil-2-propenioltio, un grupo 3-butenioltio, un grupo 2-metil-2-propenioltio, un grupo 2-pentenioltio, un grupo 3-pentenioltio, un grupo 4-pentenioltio, un grupo 1-metil-3-butenioltio, un grupo 1,2-dimetil-2-propenioltio, un grupo 1,1-dimetil-2-propenioltio, un grupo 2-metil-2-butenioltio, un grupo 3-metil-2-butenioltio, un grupo 2-metil-3-butenioltio, un grupo 3-metil-3-butenioltio, un grupo 1-vinil-2-propenioltio y un grupo 5-hexenioltio.

65 La expresión "grupo haloalquenioltio C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquenioltio C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo

3-cloro-2-propeniltilio, un grupo 3-bromo-2-propeniltilio, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propeniltilio, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propeniltilio, un grupo 2-cloro-2-propeniltilio, un grupo 3,3-difluoro-2-propeniltilio, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propeniltilio, un grupo 3,3-dicloro-2-propeniltilio, un grupo 3,3-dibromo-2-propeniltilio, un grupo 3-fluoro-3-cloro-2-propeniltilio, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-buteniltilio, un grupo 1-bromometil-2-propeniltilio, un grupo 3-cloro-2-buteniltilio, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-buteniltilio, un grupo 4-bromo-4,4-difluoro-2-buteniltilio, un grupo 3-bromo-3-buteniltilio, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-buteniltilio, un grupo 3,4,4-tribromo-3-buteniltilio, un grupo 3-bromo-2-metil-2-propeniltilio, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propeniltilio, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-buteniltilio, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-buteniltilio, un grupo 5,5-difluoro-4-penteniltilio, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-penteniltilio, un grupo 4,4,4-trifluorometil-3-metil-2-buteniltilio, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadieniltilio, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexeniltilio, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-penteniltilio y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-penteniltilio. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquiniltilio C3-C6" representa un grupo alquiniltilio lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo propargiltilio, un grupo 1-butina-3-iltio, un grupo 3-metil-1-butina-3-iltio, un grupo 2-buteniltilio, un grupo 3-buteniltilio, un grupo 2-pentiniltilio, un grupo 3-pentiniltilio, un grupo 4-pentiniltilio y un grupo 5-hexiniltilio.

La expresión de "grupo haloalquiniltilio C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquiniltilio C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 3-cloro-2-propiniltilio, un grupo 3-bromo-2-propiniltilio, un grupo 3-yodo-2-propiniltilio, un grupo 5-cloro-4-pentiniltilio, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-buteniltilio, un grupo perfluoro-2-buteniltilio, un grupo perfluoro-3-buteniltilio, un grupo perfluoro-2-pentiniltilio, un grupo perfluoro-3-pentiniltilio, un grupo perfluoro-4-pentiniltilio y un grupo perfluoro-5-hexiniltilio. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquilamino C1-C8" representa un grupo amino en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno están sustituidos con el grupo alquilo lineal y/o ramificado que puede ser el mismo o diferente entre sí, y el número total de átomos de carbono del grupo alquilo en el átomo de nitrógeno es de uno a ocho. Ejemplos del grupo alquilamino C1-C8 incluyen un grupo metilamino, un grupo etilamino, un grupo propilamino, un grupo isopropilamino, un grupo N,N-dimetilamino, un grupo N,N-dietilamino, un grupo N-etil-N-metilamino, un grupo butilamino, un grupo pentilamino, un grupo hexilamino, un grupo N,N-dibutilamino y un grupo N-sec-butil-N-metilamino.

La expresión "grupo haloalquilamino C1-C8" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilamino C1-C8 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilamino, un grupo N,N-(2,2-di-trifluoroetil)amino, un grupo N,N-(2,2-di-tricloroetil)amino y un grupo pentafluoropropilamino. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquilcarbonilo C2-C6" representa un grupo alquilcarbonilo de dos a seis átomos de carbono que tiene un grupo alquilo C1-C5 lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metilcarbonilo, un grupo etilcarbonilo, un grupo propilcarbonilo, un grupo isopropilcarbonilo, un grupo pivaloilo, un grupo butilcarbonilo y un grupo pentilcarbonilo.

La expresión "grupo alcoxycarbonilo C2-C6" representa un grupo alcoxycarbonilo de dos a seis átomos de carbono que tiene un grupo alquilo C1-C5 lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metoxycarbonilo, un grupo etoxycarbonilo, un grupo propiloxycarbonilo, un grupo isopropiloxycarbonilo, un grupo butiloxycarbonilo, un grupo isobutiloxycarbonilo, un grupo sec-butiloxycarbonilo, un grupo *terc*-butiloxycarbonilo, un grupo pentiloxycarbonilo, un grupo isoamiloxycarbonilo, un grupo neopentiloxycarbonilo, un grupo 2-pentiloxycarbonilo, un grupo 3-pentiloxycarbonilo y un grupo 2-metilbutiloxycarbonilo.

La expresión "grupo alquilaminocarbonilo C2-C8" representa un grupo aminocarbonilo en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno están sustituidos con el grupo alquilo lineal y/o ramificado que pueden ser el mismo o diferente entre sí, y el número total de átomos de carbono del grupo alquilo en el átomo de nitrógeno es de uno a siete. Ejemplos del grupo alquilaminocarbonilo C2-C8 incluyen un grupo metilaminocarbonilo, un grupo etilaminocarbonilo, un grupo propilaminocarbonilo, un grupo isopropilaminocarbonilo, un grupo butilaminocarbonilo, un grupo N,N-dimetilaminocarbonilo, un grupo N,N-dietilaminocarbonilo, un grupo N,N-dipropilaminocarbonilo y un grupo N,N-diisopropilaminocarbonilo.

La expresión "grupo trialquilsililo C3-C9" representa un grupo trialquilsililo de tres a nueve átomos de carbono que tiene un grupo trialquilo C3-C9 lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo trimetilsililo, un grupo *terc*-butildimetilsililo, un grupo trietilsililo, un grupo isopropildimetilsililo y un grupo triisopropilsililo.

La expresión "grupo halocarbonilo" incluye los grupos: C(O)F, C(O)Cl, C(O)Br y C(O)I.

La expresión "grupo alquilsulfonilo C1-C6" representa un grupo alquilsulfonilo que tiene un grupo alquilo C1-C6 lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo butilsulfonilo, un grupo isobutilsulfonilo, un grupo sec-butilsulfonilo, un grupo pentilsulfonilo, un grupo isoamilsulfonilo, un grupo neopentilsulfonilo, un grupo 2-pentilsulfonilo, un grupo 3-pentilsulfonilo, un grupo 2-metilbutilsulfonilo, un grupo hexilsulfonilo, un grupo isohexilsulfonilo, un grupo 3-metilpentilsulfonilo y un grupo 4-metilpentilsulfonilo.

La expresión "grupo haloalquilsulfonilo C1-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilsulfonilo C1-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilsulfonilo, un grupo triclorometilsulfonilo, un grupo tribromometilsulfonilo, un grupo triyodometilsulfonilo, un grupo pentafluoroetilsulfonilo, un grupo pentacloroetilsulfonilo, un grupo pentabromoetilsulfonilo, un grupo pentayodoetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilsulfonilo, un grupo 2,2,2-triyodoetilsulfonilo, un grupo heptafluoropropilsulfonilo, un grupo heptacloropropilsulfonilo, un grupo heptabromopropilsulfonilo, un grupo heptayodopropilsulfonilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilsulfonilo, un grupo 3,3,3-tricloropropilsulfonilo, un grupo 3,3,3-tribromopropilsulfonilo, un grupo 3,3,3-triyodopropilsulfonilo, un grupo nonafluorobutilsulfonilo, un grupo nonaclorobutilsulfonilo, un grupo nonabromobutilsulfonilo, un grupo nonayodobutilsulfonilo, un grupo perfluoropentilsulfonilo, un grupo percloropentilsulfonilo, un grupo perbromopentilsulfonilo, un grupo perfluorohexilsulfonilo, un grupo perclorohexilsulfonilo, un grupo perbromohexilsulfonilo y un grupo peryodohexilsulfonilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6" representa un grupo alquilsulfonilo cíclico de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo ciclopropilsulfonilo, un grupo ciclobutilsulfonilo, un grupo ciclopentilsulfonilo, un grupo ciclohexilsulfonilo, un grupo 1-metilciclopropilsulfonilo y un grupo 2,2-dimetilciclopropilsulfonilo.

La expresión "grupo halocicloalquilsulfonilo C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilsulfonilo C3-C6 cíclico está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-fluorociclopropilsulfonilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilsulfonilo, un grupo 2-cloro-2-fluorociclopropilsulfonilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilsulfonilo, un grupo 2,2-dibromociclopropilsulfonilo, un grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilsulfonilo, un grupo 2,2-dicloro-1-metilciclopropilsulfonilo, un grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilsulfonilo, un grupo 1-(trifluorometil)ciclopropilsulfonilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclobutilsulfonilo, un grupo 2-clorociclohexilsulfonilo, un grupo 4,4-difluorociclohexilsulfonilo y un grupo 4-clorociclohexilsulfonilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquilaminosulfonilo C1-C8" representa un grupo aminosulfonilo en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno están sustituidos con el grupo alquilo lineal y/o ramificado que puede ser el mismo o diferente entre sí, y el número total de átomos de carbono del grupo alquilo en el átomo de nitrógeno es de uno a ocho. Ejemplos del grupo alquilaminosulfonilo C1-C8 incluyen un grupo metilaminosulfonilo, un grupo etilaminosulfonilo, un grupo propilaminosulfonilo, un grupo isopropilaminosulfonilo, un grupo butilaminosulfonilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo N,N-dietilaminosulfonilo, un grupo N,N-dipropilaminosulfonilo, un grupo N,N-diisopropilaminosulfonilo, un grupo pentilaminosulfonilo y un grupo hexilaminosulfonilo.

La expresión "grupo alquilaminosulfonilo C2-C8" representa un grupo aminosulfonilo en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno están sustituidos con el grupo alquilo lineal y/o ramificado que puede ser el mismo o diferente entre sí, y el número total de átomos de carbono del grupo alquilo en el átomo de nitrógeno es de dos a ocho. Ejemplos del grupo alquilaminosulfonilo C2-C8 incluyen un grupo etilaminosulfonilo, un grupo propilaminosulfonilo, un grupo isopropilaminosulfonilo, un grupo butilaminosulfonilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo N,N-dietilaminosulfonilo, un grupo N,N-dipropilaminosulfonilo, un grupo N,N-diisopropilaminosulfonilo, un grupo pentilaminosulfonilo y un grupo hexilaminosulfonilo.

La expresión "grupo haloalquilaminosulfonilo C1-C8" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilaminosulfonilo C1-C8 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilaminosulfonilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilaminosulfonilo, un grupo N,N-di-(2,2,2-trifluoroetil)aminosulfonilo, un grupo N,N-di-(2,2,2-tricloroetil)aminosulfonilo y un grupo pentafluoropropilaminosulfonilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo haloalquilaminosulfonilo C2-C8" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilaminosulfonilo C2-C8 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilaminosulfonilo, un grupo N,N-di-(2,2,2-trifluoroetil)aminosulfonilo, un grupo N,N-di-(2,2,2-tricloroetil)aminosulfonilo y un grupo pentafluoropropilaminosulfonilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

La expresión "grupo alquilsulfonilo C1-C6" representa un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado de uno a seis átomos

de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfinilo, un grupo etilsulfinilo, un grupo propilsulfinilo, un grupo isopropilsulfinilo, un grupo butilsulfinilo, un grupo isobutilsulfinilo, un grupo sec-butilsulfinilo, un grupo pentilsulfinilo, un grupo isoamilsulfinilo, un grupo neopentilsulfinilo, un grupo 2-pentilsulfinilo, un grupo 3-pentilsulfinilo, un grupo 2-metilbutilsulfinilo, un grupo hexilsulfinilo, un grupo isohexilsulfinilo, un grupo 3-metilpentilsulfinilo y un grupo 4-metilpentilsulfinilo.

La expresión "grupo haloalquilsulfinilo C1-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilsulfinilo C1-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo trifluorometilsulfinilo, un grupo triclorometilsulfinilo, un grupo tribromometilsulfinilo, un grupo triyodometilsulfinilo, un grupo pentafluoroetilsulfinilo, un grupo pentacloroetilsulfinilo, un grupo pentabromoetilsulfinilo, un grupo pentayodoetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-tribromoetilsulfinilo, un grupo 2,2,2-triyodoetilsulfinilo, un grupo heptafluoropropilsulfinilo, un grupo heptacloropropilsulfinilo, un grupo heptabromopropilsulfinilo, un grupo heptayodopropilsulfinilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilsulfinilo, un grupo 3,3,3-tricloropropilsulfinilo, un grupo 3,3,3-tribromopropilsulfinilo, un grupo 3,3,3-triyodopropilsulfinilo, un grupo nonafluorobutilsulfinilo, un grupo nonaclorobutilsulfinilo, un grupo nonabromobutilsulfinilo, un grupo nonayodobutilsulfinilo, un grupo perfluoropentilsulfinilo, un grupo percloropentilsulfinilo, un grupo perbromopentilsulfinilo, un grupo perfluorohexilsulfinilo, un grupo perclorohexilsulfinilo, un grupo perbromohexilsulfinilo y un grupo peryodohexilsulfinilo. El átomo de halógeno que puede sustituirse por un átomo de hidrógeno incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

Los términos "grupo aldehído" y "grupo formilo" representan los mismos significados.

La expresión "grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹" representa un grupo alquilo C1-C6 en el que un átomo de hidrógeno que está unido al átomo de carbono puede estar sustituido opcionalmente con uno o más átomos o grupos seleccionados entre el Grupo P¹, y cuando dicho grupo alquilo C1-C6 tiene dos o más átomos o grupos seleccionados entre el Grupo P¹, los átomos o grupos seleccionados entre el Grupo P¹ pueden ser los mismos o diferentes entre sí.

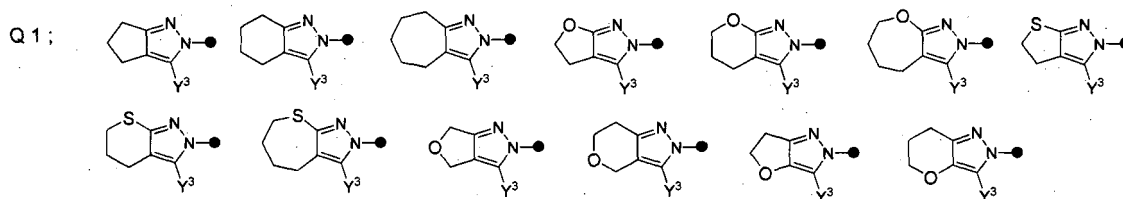
Ejemplos del grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ incluyen un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo difluorometilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 1,1-difluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo heptafluoroisopropilo, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluoropropilo, un grupo 2,2,3,3,3-pentafluorobutilo, un grupo ciclopropilmetilo, un grupo ciclopropiletilo, un grupo ciclopropilpropilo, un grupo ciclopropilbutilo, un grupo ciclopropilpentilo, un grupo ciclopropilhexilo, un grupo ciclobutilmetilo, un grupo ciclobutiletilo, un grupo ciclobutilpropilo, un grupo ciclobutilbutilo, un grupo ciclopentilmetilo, un grupo ciclopentiletilo, un grupo ciclopentilpropilo, un grupo ciclohexiletilo, un grupo ciclohexilpropilo, un grupo 1-fluorociclopropilmetilo, un grupo 1-fluorociclopropiletilo, un grupo 1-fluorociclopropilpropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilmetilo, un grupo 2,2-difluorociclopropiletilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilpropilo, un grupo pentafluorociclopropilmetilo, un grupo pentafluorociclopropiletilo, un grupo pentafluorociclopropilpropilo, un grupo 1-clorociclopropilmetilo, un grupo 1-clorociclopropiletilo, un grupo 1-clorociclopropilpropilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilmetilo, un grupo 2,2-diclorociclopropiletilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilpropilo, un grupo pentaclorociclopropilmetilo, un grupo pentaclorociclopropiletilo, un grupo pentaclorociclopropilpropilo, un grupo 1-fluorociclobutilmetilo, un grupo 1-fluorociclobutiletilo, un grupo 1-fluorociclobutilpropilo, un grupo 2,2-difluorociclobutilmetilo, un grupo 2,2-difluorociclobutiletilo, un grupo 2,2-difluorociclobutilpropilo, un grupo 1-clorociclobutilmetilo, un grupo 1-clorociclobutiletilo, un grupo 1-clorociclobutilpropilo, un grupo 2,2-diclorociclobutilmetilo, un grupo 2,2-diclorociclobutiletilo, un grupo 2,2-diclorociclobutilpropilo, un grupo 1-fluorociclopentilmetilo, un grupo 1-fluorociclopentiletilo, un grupo 1-fluorociclopentilpropilo, un grupo 2,2-difluorociclopentilmetilo, un grupo 2,2-difluorociclopentiletilo, un grupo 2,2-difluorociclopentilpropilo, un grupo 3,3-difluorociclopentilmetilo, un grupo 3,3-difluorociclopentiletilo, un grupo 3,3-difluorociclopentilpropilo, un grupo 1-clorociclopentilmetilo, un grupo 1-clorociclopentiletilo, un grupo 1-clorociclopentilpropilo, un grupo 2,2-diclorociclopentilmetilo, un grupo 2,2-diclorociclopentiletilo, un grupo 2,2-diclorociclopentilpropilo, un grupo 3,3-diclorociclopentilmetilo, un grupo 3,3-diclorociclopentiletilo, un grupo 3,3-diclorociclopentilpropilo, un grupo 1-fluorociclohexilmetilo, un grupo 1-fluorociclohexiletilo, un grupo 1-fluorociclohexilpropilo, un grupo 2,2-difluorociclohexilmetilo, un grupo 2,2-difluorociclohexiletilo, un grupo 2,2-difluorociclohexilpropilo, un grupo 3,3-difluorociclohexilmetilo, un grupo 3,3-difluorociclohexiletilo, un grupo 3,3-difluorociclohexilpropilo, un grupo 4,4-difluorociclohexilmetilo, un grupo 4,4-difluorociclohexiletilo, un grupo 4,4-difluorociclohexilpropilo, un grupo 1-clorociclohexilmetilo, un grupo 1-clorociclohexiletilo, un grupo 1-clorociclohexilpropilo, un grupo 2,2-diclorociclohexilmetilo, un grupo 2,2-diclorociclohexiletilo, un grupo 2,2-diclorociclohexilpropilo, un grupo 3,3-diclorociclohexilmetilo, un grupo 3,3-diclorociclohexiletilo, un grupo 3,3-diclorociclohexilpropilo, un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo isopropoximetilo, un grupo *tert*-butoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 2-*tert*-butoxietilo, un grupo 3-metoxipropilo, un grupo 3-etoxipropilo, un grupo trifluorometoximetilo, un grupo 2-trifluorometoxietilo, un grupo 3-trifluorometoxipropilo, un grupo 4-trifluorometoxibutilo, un grupo difluorometoximetilo, un grupo 2-difluorometoxietilo, un grupo 2-pentafluoroetoxietilo, un grupo 3-pentafluoroetoxipropilo, un grupo 1,1,2,2-tetrafluoroetoximetilo, un grupo 2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)-etilo, un grupo metiltiometilo, un grupo 2-metiltioetilo, un grupo 3-metiltiopropilo, un grupo 2-

etiltioetilo, un grupo 3-etiltiopropilo, un grupo *terc*-butiltioetilo, un grupo 2-(*terc*-butiltio)-etilo, un grupo 3-(*terc*-butiltio)-propilo, un grupo trifluorometiltioetilo, un grupo 2-trifluorometiltioetilo, un grupo trifluorometiltiopropilo, un grupo cianometilo, un grupo 2-cianoetilo, un grupo 3-cianopropilo, un grupo 1-cianoetilo, un grupo 2-ciano-2-metiletilo y un grupo 2-ciano-2-metilpropilo y similares.

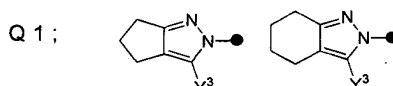
5 La expresión "grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹" representa un grupo cicloalquilo C3-C6 en el que un átomo de hidrógeno que está unido al átomo de carbono puede estar sustituido opcionalmente con uno o más átomos o grupos seleccionados entre el Grupo P¹, y cuando dicho grupo alquilo C3-C6 tiene dos o más átomos o grupos seleccionados entre el Grupo P¹, los átomos o grupos
10 seleccionados entre el Grupo P¹ pueden ser los mismos o diferentes entre sí.

Ejemplos del grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ incluyen un grupo 1-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilo, un grupo 1-cloro-2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilo, un grupo 2,2-dibromociclopropilo, un grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, un grupo
15 2,2-dicloro-1-metilciclopropilo, un grupo 2,2-dibromo-1-metilciclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclobutilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclopentilo, un grupo 2-clorociclopropilo, un grupo 3-clorociclopropilo, un grupo 3,3-difluorociclopropilo, un grupo 1-fluorociclohexilo, un grupo 2,2-difluorociclohexilo, un grupo 3,3-difluorociclohexilo, un grupo 4,4-difluorociclohexilo, a 1-ciclopropilciclopropilo, a 2-ciclopropilciclopropilo, un grupo 2,2-bis-
20 ciclopropilciclopropilo, un grupo 2,3-bis-ciclopropilciclopropilo, un grupo 1-ciclopropilciclobutilo, un grupo 1-ciclobutilciclobutilo, un grupo 2-ciclopropilciclobutilo, un grupo 1-ciclopropilciclopropilo, un grupo 2-ciclopropilciclopropilo, un grupo 1-(1-fluorociclopropil)-ciclopropilo, un grupo 1-(2,2-difluorociclopropil)-ciclopropilo, un grupo 1-(1-clorociclopropil)-ciclopropilo, un grupo 1-(2,2-diclorociclopropil)-ciclopropilo, un grupo 1-metoxiciclopropilo, un grupo 1-metoxiciclobutilo, un grupo 1-metoxiciclopropilo, un grupo 2-
25 metoxiciclopropilo, un grupo 2-metoxiciclobutilo, un grupo 2-metoxiciclopropilo, un grupo 2-metoxiciclohexilo, un grupo 2-etoxiciclopropilo, un grupo 2-etoxiciclobutilo, un grupo 2-etoxiciclopropilo, un grupo 2-etoxiciclohexilo, un grupo 1-etoxiciclopropilo, un grupo 1-etoxiciclobutilo, un grupo 1-etoxiciclopropilo, un grupo 1-etoxiciclohexilo, un grupo 1-isopropoxiciclopropilo, un grupo 1-isopropoxiciclobutilo, un grupo 1-isopropoxiciclopropilo, un grupo 1-isopropoxiciclohexilo, un grupo 1-trifluorometoxiciclopropilo, un grupo 2-trifluorometoxiciclopropilo, un grupo 1-
30 2-difluorometoxiciclopropilo, un grupo 2-difluorometoxiciclopropilo, un grupo 1-(2,2-difluoroetoxi)-ciclopropilo, un grupo 2-(2,2-difluoroetoxi)-ciclopropilo, un grupo 1-metiltiociclopropilo, un grupo 1-etiltiociclopropilo, un grupo 2-metiltiociclopropilo, un grupo 2-etiltiociclopropilo, un grupo 1-trifluorometiltiociclopropilo, un grupo 2-trifluorometiltiociclopropilo, un grupo 1-cianociclopropilo, un grupo 2-cianociclopropilo y un grupo 2,2-dicianociclopropilo y similares.

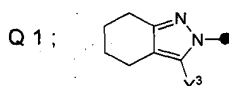
35 Y¹ e Y² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ como sustituyente. Ejemplos de Q1 incluyen las siguientes
40 estructuras:



En términos de una conveniencia de producción, el Q1 preferido incluye las siguientes estructuras:

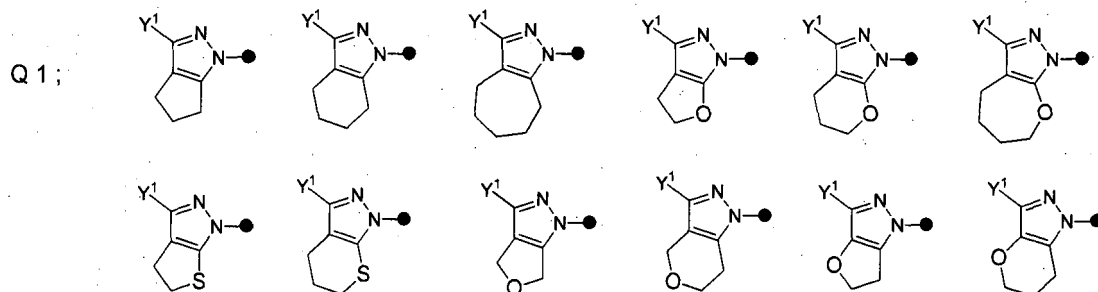


El Q1 más preferido incluye la siguiente estructura:



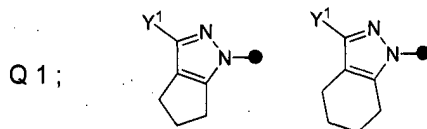
Y² e Y³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ como sustituyente. Ejemplos de Q1 incluyen las siguientes estructuras:

5

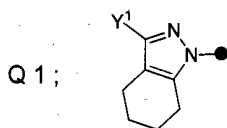


En términos de una conveniencia de producción, el Q1 preferido incluye las siguientes estructuras:

10



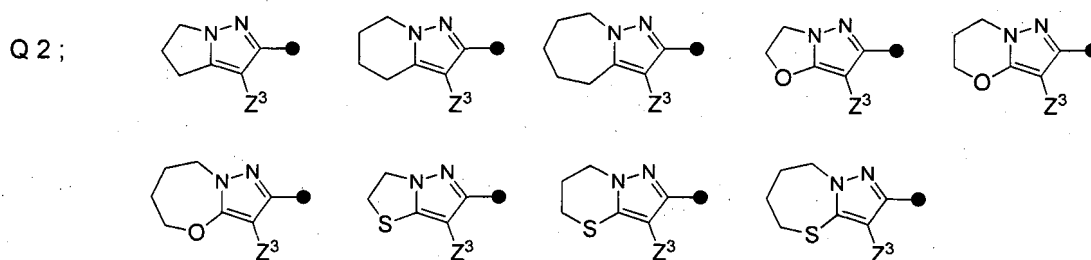
El Q1 más preferido incluye la siguiente estructura:



15

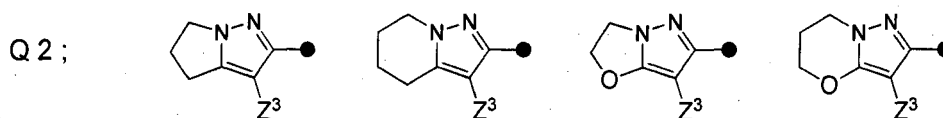
Z¹ y Z² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono o al átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno, átomos de nitrógeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ como sustituyente. Ejemplos de Q2 incluyen las siguientes estructuras:

20

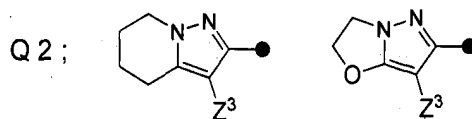


En términos de una conveniencia de producción, el Q2 preferido incluye las siguientes estructuras:

25

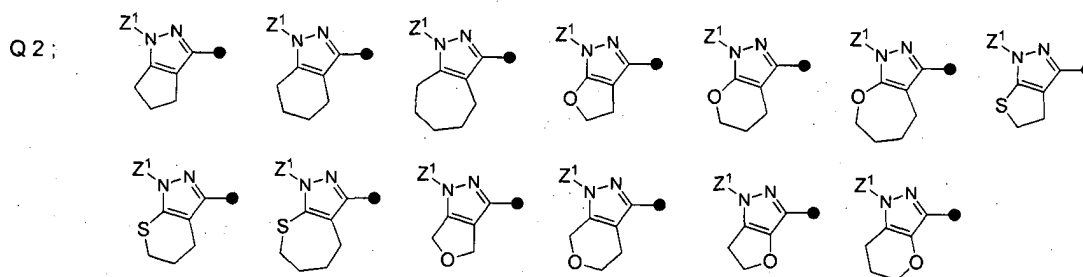


El Q2 más preferido incluye las siguientes estructuras:



5 Z^2 y Z^3 pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹ como sustituyente. Ejemplos de Q2 incluyen las siguientes estructuras:

10



Ejemplos de una realización del presente compuesto incluyen los compuestos de la fórmula (1) en la que los sustituyentes representan los siguientes.

- 15 un compuesto de la fórmula (1) en la que A^2 , Z^1 y Z^4 representa independientemente entre sí, un átomo de hidrógeno, un grupo amino, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquino C3-C6, un grupo haloalquino C3-C6, un grupo alquilsulfinilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo C1-C6, un grupo alquilsulfonylo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonylo C1-C6, un grupo cicloalquilsulfonylo C3-C6, un grupo halocicloalquilsulfonylo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonylo C2-C8, un grupo haloalquilaminosulfonylo C2-C8, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹; un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo o un grupo butilo;
- 20 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butililo o un grupo 2-butililo;
- 25 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo ciclopropilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo trifluorometilo;
- 30 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^2 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^4 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^5 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- 35 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^7 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^8 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^9 representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^{11} representa un átomo de hidrógeno o un átomo de flúor;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^2 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^4 representa un átomo de hidrógeno;
- 40 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^5 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^7 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^8 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^9 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^{11} representa un átomo de hidrógeno;
- 45 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo isobutilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo o un grupo 2-propenilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo propiloxi;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 3,3,3-trifluoroetilo o un grupo 2,2-difluoroetilo;
- 50 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo;

- un compuesto de la fórmula (1) en la que R⁶ representa un grupo ciano;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹⁰ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo o un grupo 2,2-difluoroetilo;
- 5 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹⁰ representa un grupo metilo;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que X representa un átomo de oxígeno;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que X representa un átomo de azufre;
- 10 un compuesto de la fórmula (1) en la que A¹ y A³ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que A¹ y A³ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo alquilo C1-C6;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que A¹ y A³ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo haloalquilo C1-C6;
- 15 un compuesto de la fórmula (1) en la que A² y Z⁴ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo alquilo C1-C6;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que A² y Z⁴ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo haloalquilo C1-C6;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que A² y Z⁴ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo alquinilo C1-C6;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que A² y Z⁴ pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo haloalquinilo C1-C6;
- 20 un compuesto de la fórmula (1) en la que Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que puede sustituirse opcionalmente con un grupo seleccionado entre el Grupo P¹;
- 25 un compuesto de la fórmula (1) en la que Z² representa un grupo alquilo C1-C6 que puede sustituirse opcionalmente con un grupo seleccionado entre el Grupo P¹;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno y X representa un átomo de oxígeno;
- 30 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno y R¹⁰ representa un grupo metilo;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q1 o Q2;
- 35 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q1, Q2 o Q4;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q1;
- 40 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q2;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q3;
- 45 un compuesto de la fórmula (1) en la que R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q4;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un átomo de halógeno;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo alquilo C1-C3;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo haloalquilo C1-C3;
- 50 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo alquinilo C2-C3;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo haloalquinilo C2-C3;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo cicloalquilo C3-C5;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo halocicloalquilo C3-C5;
- 55 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo alcoxi C1-C3;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un grupo haloalcoxi C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo cicloalquilo C3-C5;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3;
- 60 un compuesto de la fórmula (1) en la que R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa un átomo de hidrógeno;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa un átomo de halógeno;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa un grupo alquilo C1-C3;
 un compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa un grupo haloalquilo C1-C3;
- 65 un compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3;

- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 5 un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 10 un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo alcoxi C1-C2, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 15 un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 20 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un grupo haloalquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un grupo cicloalquilo C3-C6;
- 25 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un grupo halocicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6;
- 30 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo;
- 35 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un átomo de halógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo haloalquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo alquinilo C2-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo alcoxi C1-C6;
- 40 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo haloalcoxi C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo halocicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, lineal divalente para formar un anillo de cinco o seis miembros;
- 45 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y¹ e Y² se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y¹ e Y² se unen para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C2-C3, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6;
- 50 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alquinilo C2-C3, un grupo alcoxi C1-C3 o un grupo cicloalquilo C3-C4;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isobutilo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo ciclopropilo;
- 55 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y³ representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y³ representa un grupo alquilo C1-C4;
- 60 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y³ representa un grupo haloalquilo C1-C4;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo;
- 65 un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, lineal divalente para formar un anillo de cinco o seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² e Y³ se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-

- representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, Y² representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo aldehído, Y³ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, Y² representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo aldehído o un grupo cicloalquilo C3-C6, Y³ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilino C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C1-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, y Z³ representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un grupo alcoxi C1-C4 o un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, grupo ciano y grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilino C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C1-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente átomo de halógeno o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo alquilo C1-C3, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un grupo alcoxi C1-C4 o un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente átomo de halógeno o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un átomo de halógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilino C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C1-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C3 o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un grupo alquilo C1-C6, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno, grupo ciano y grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilino C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C1-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6 o un átomo de halógeno, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un átomo de halógeno, un grupo aldehído o un grupo ciano, como alternativa Z¹ y Z² se combinan junto con los átomos de carbono o los átomos de nitrógeno a los que Z¹ y Z² se unen para formar un anillo saturado de cinco miembros o seis miembros, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente un átomo o átomos de oxígeno como átomo constituyente del anillo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q3, R¹ representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, A¹ representa un

- átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, A² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, y A³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un grupo alquilo C1-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z⁴ representa un grupo alquilo C1-C6, y Z² y Z³ representan un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un grupo alquilo C1-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, Z³ representa un átomo de hidrógeno, y Z⁴ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, R¹ representa un grupo alquilo C1-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4 o un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de halógeno, Z³ representa un átomo de hidrógeno, y Z⁴ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo ciclopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo de trifluorometilo o un grupo etilo, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo metilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un

- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo isopropilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo o un grupo metoxi, Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo etilo, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo metilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo etilo, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo etilo, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un átomo de bromo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, Y² representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo aldehído, Y³ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C1-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C3 o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo ciclopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a

través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo metilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un átomo de bromo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁶ representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, Y² representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo aldehído, Y³ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquinilo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C2-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C3 o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo ciclopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metoxi o un grupo

etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo

5 ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo metilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un

10 átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y²

15 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³

se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de bromo, un grupo metilo, un

20 grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, R⁶ representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo propilo, un

grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo

25 ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un átomo de bromo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C6, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de

30 hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, R⁶ representa un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de hidrógeno, Y² representa un grupo alquilo C1-C6 que

tiene opcionalmente un átomo de halógeno, un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo aldehído, Y³ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo

35 de hidrógeno, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰

40 representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más átomos o grupos seleccionados entre el grupo que consiste en un átomo de halógeno y un grupo cicloalquilo C3-C6, un átomo de hidrógeno, un grupo alquilinilo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo alquilsulfonilo C1-C6 o un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, Z²

45 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C3 o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo

50 ciclopropilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de

halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo ciclopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de

55 hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo

etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un

60 grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo

propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo

65 ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metilo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo metilo, R² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ y R⁹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R¹¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo *terc*-butilo o un grupo trifluorometilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo ciclopropilo, un grupo metoxi o un grupo aldehído, Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo o un grupo trifluorometilo, como alternativa Y¹ e Y² se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros, o Y² e Y³ se conectan a través de una cadena de carbono saturada, divalente para formar un anillo de seis miembros;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo o un átomo de cloro, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un átomo de bromo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo ciclopropilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alcoxi C1-C4 o un átomo de halógeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C3-C6 o a grupo cicloalquilmetilo C4-C7, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C6, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo ciclopropilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alcoxi C1-C4 o un átomo de halógeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C6, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un metilo, un grupo etilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo trifluorometilo o un átomo de halógeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C6, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo etilo, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C6, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un

- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro o un grupo metilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un átomo de halógeno, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo metiltio, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro o un grupo metilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo 2-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo metiltio, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro o un grupo metilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo 2-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo metiltio, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo ciclopropilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un átomo de flúor, un átomo de cloro o un átomo de bromo, X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, Z¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo butilo, un grupo isobutilo, un grupo isopentilo, un grupo pentilo, un grupo isohexilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2-difluoroetilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo N,N-dimetilaminosulfonilo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo ciclopropilsulfonilo o un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo 2-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo metiltio, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo difluorometilo, un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un grupo ciano;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un grupo metilo o un átomo de cloro, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo etilo, X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, Z¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo isopropilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo metiltio, un grupo 2-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un átomo de halógeno o un grupo ciano;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un grupo metilo o un átomo de cloro, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, Z¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo isopropilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo metiltio, un grupo 2-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un átomo de halógeno *または* un grupo ciano;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3, Z² representa un grupo alcoxi C1-C2, un grupo haloalcoxi C1-C2, un grupo alquiloxi C3-C4, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2, un átomo de halógeno o un grupo ciano, y Z² representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un grupo metilo, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C3, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C3, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo aldehído.
- Ejemplos de una realización del presente compuesto incluyen los compuestos de la fórmula (2) en la que los sustituyentes representan los siguientes.
- un compuesto de la fórmula (2) en la que R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo etilo, y R¹² representa un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (2) en la que R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo metilo o un grupo

etilo, y R^{12} representa un grupo metilo o un grupo etilo;

un compuesto de la fórmula (2) en la que R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, y R^{12} representa un grupo alquilo C1-C6;

5 un compuesto de la fórmula (2) en la que R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, y R^{12} representa un grupo metilo o un grupo etilo;

un compuesto de la fórmula (2) en la que R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un átomo de cloro o un

10 átomo de bromo, y R^{12} representa un grupo alquilo C1-C6;
un compuesto de la fórmula (2) en la que R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un átomo de cloro o un átomo de bromo, y R^{12} representa un grupo metilo o un grupo etilo;

15 Ejemplos de una realización del presente compuesto incluyen los compuestos de la fórmula (3) en la que los sustituyentes representan los siguientes.

un compuesto de la fórmula (3) en la que R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo metilo, un grupo etilo o un átomo de cloro, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 representa un grupo alcoxi C1-C2 o un átomo de

20 halógeno, y Z^3 representa un grupo alquilo C1-C3;
un compuesto de la fórmula (3) en la que R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 representa un grupo alcoxi C1-C2 o un átomo de halógeno, y Z^3 representa un grupo alquilo C1-C3;

25 un compuesto de la fórmula (3) en la que R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 representa un grupo alcoxi C1-C2, y Z^3 representa un grupo alquilo C1-C3;

un compuesto de la fórmula (3) en la que R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo metilo, Z^2 representa un grupo metoxi, un grupo etoxi o un átomo de cloro, y Z^3 representa un grupo metilo;

30 un compuesto de la fórmula (3) en la que R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo metilo, Z^2 representa un grupo metoxi o un grupo etoxi, y Z^3 representa un grupo metilo;

Ejemplos de una realización del presente compuesto incluyen los compuestos de la fórmula (4) en la que los sustituyentes representan los siguientes.

35 un compuesto de la fórmula (4) en la que L^1 representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato, R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 representa un grupo alquilo C1-C2 o un átomo de halógeno, y Z^3 representa un grupo alquilo C1-C3;

40 un compuesto de la fórmula (4) en la que L^1 representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato, R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 representa un grupo alcoxi C1-C2, y Z^3 representa un grupo alquilo C1-C3;

un compuesto de la fórmula (4) en la que L^1 representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato, R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un

45 grupo metilo, Z^2 representa un grupo metoxi, un grupo etoxi o un átomo de cloro, y Z^3 representa un grupo metilo;
un compuesto de la fórmula (4) en la que L^1 representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato, R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo metilo, Z^2 representa un grupo metoxi o un grupo etoxi y Z^3 representa un grupo metilo;

un compuesto de la fórmula (4) en la que L^1 representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato, R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo metilo o un grupo etilo, Z^2 representa un grupo metoxi o un grupo etoxi o un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z^3 representa un grupo metilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo;

50 un compuesto de la fórmula (4) en la que L^1 representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato, R^1 representa un grupo metilo, R^3 representa un átomo de hidrógeno, R^6 representa un grupo metilo, Z^1 representa un grupo metilo o un grupo etilo, Z^2 representa un grupo metoxi o un grupo etoxi o un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z^3 representa un grupo metilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo ciano;

En el presente documento, cuando en una fórmula (I), R^4 y R^5 son diferentes entre sí, el presente compuesto de la fórmula (1) puede tener un átomo de carbono asimétrico en el mismo, y por lo tanto, puede incluir sustancias ópticamente activas y racematos, sin limitarse a los mismos.

60

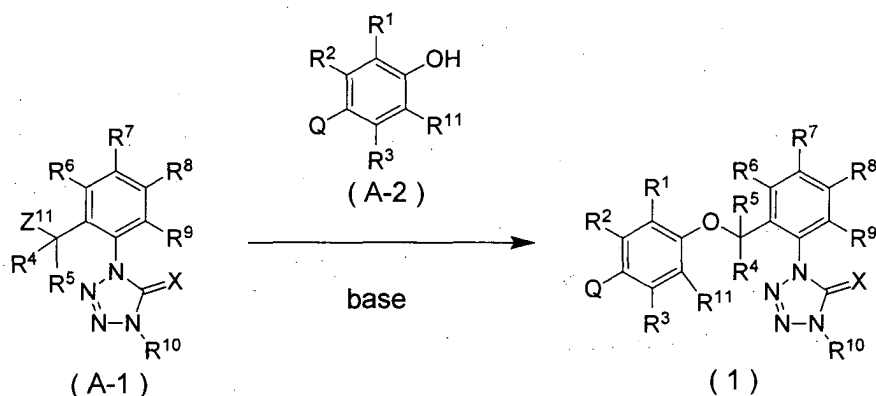
A continuación, se explica un proceso para preparar el presente documento.

El presente documento puede prepararse, por ejemplo, de acuerdo con el proceso mencionado a continuación.

65

(Proceso A)

El presente compuesto de la fórmula (1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de a formula (A-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (A-1)) con un compuesto de una formula (A-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (A-2)) en presencia de una base.



[en la que

10 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X$ y Q son los mismos como se han definido anteriormente, Z^{11} representa un grupo saliente tal como un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metanosulfoniloxi, un grupo trifluorometanosulfoniloxi o un grupo p-toluenosulfoniloxi]

15 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

35 En la reacción, El compuesto (A-2) se usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de una relación de 1 a 10 molar, frente a 1 mol del Compuesto (A-1).

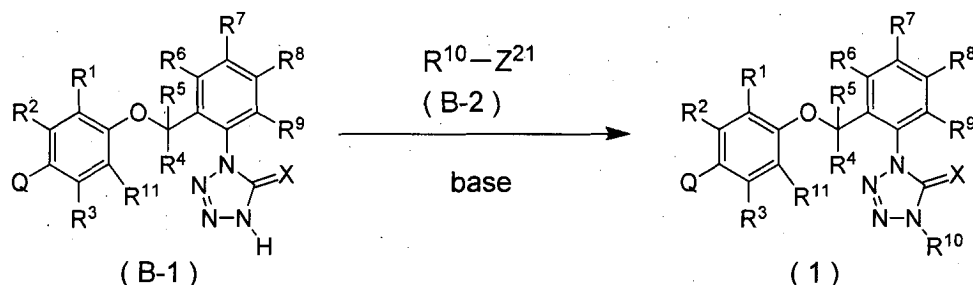
40 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción yoduro de sodio, yoduro de tetrabutilamonio y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (A-1).

45 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso B)

El presente compuesto de la fórmula (1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de a formula (B-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (B-1)) con un compuesto de una formula (B-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (B-2)) en presencia de una base.



[en la que

10 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X$ y Q son los mismos como se han definido anteriormente, Z^{21} representa un grupo saliente tal como un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metanosulfonyloxi, un grupo metoxisulfonyloxi, un grupo trifluorometanosulfonyloxi o un grupo p-toluenosulfonyloxi]

15 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25 El Compuesto (B-2) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen haluros de alquilo, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, bromuro de arilo, bromuro de ciclopropilo, 1,1-difluoro-2-yodoetano; sulfatos de alquilo o arilo, tales como sulfato de dimetilo, p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo, metanosulfonato de etilo y metanosulfonato de propilo.

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

En la reacción, El compuesto (B-2) usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (B-1).

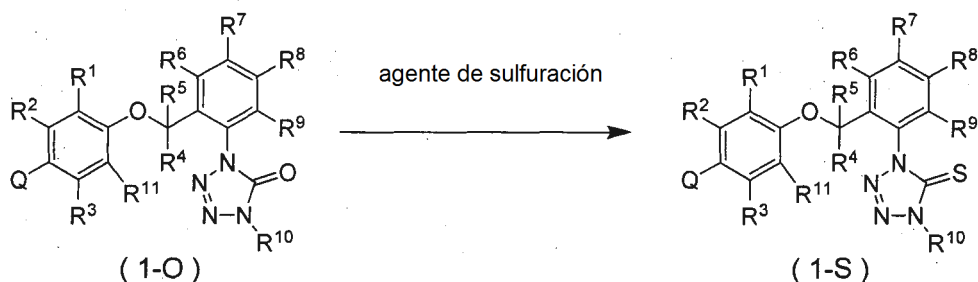
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso C)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que X representa un átomo de azufre, es decir, el compuesto de una fórmula (1-S) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-S)) puede prepararse haciendo reaccionar el presente compuesto de la fórmula (1) en la que X representa un átomo de oxígeno (en lo

sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-O)) mediante una sulfuración bien conocida.



5 [en la que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}$ y Q son los mismos como se han definido anteriormente.]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

10

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

15

Ejemplos del agente de sulfuración a usarse en la reacción incluyen pentasulfuro de fósforo, reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano).

20

En la reacción, el agente de sulfuración se usa dentro de un intervalo de 0,5 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-O).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25

Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción bases orgánica, tales como piridina y trietilamina y bases inorgánicas, tales como hidróxidos de metal alcalino y carbonatos de metal alcalino y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,5 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-O).

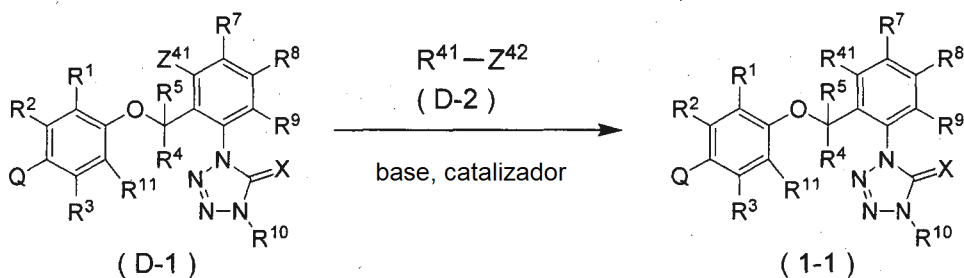
30

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-S). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

35 (Proceso D)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa R^{41} , es decir, el compuesto de una fórmula (1-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-1)), puede prepararse mediante el acoplamiento del Compuesto (D-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (D-1)) con un compuesto de a formula (D-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (D-2)) en presencia de una base y un catalizador.

40



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X y Q son los mismos como se han definido anteriormente, Z⁴¹ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un grupo trifluorometanosulfonilo, R⁴¹ representa un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alqueno C2-C4 o un grupo haloalqueno C2-C4, y Z⁴² representa un B(OH)₂, un grupo alcoxiborilo o unas sales de trifluoroborato (BF₃⁻K⁺).]

5 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

El Compuesto (D-2) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado o puede prepararse de acuerdo con un método descrito en un artículo de revisión de N. Miyaura y A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457 y similares. El Compuesto (D-2) a usarse en la reacción también puede prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de yodo (R⁴¹-I) o un compuesto de bromo (R⁴¹-Br) con un alquillitio (tal como butillitio), seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con ésteres de borato para obtener derivados del éster boronato. Además, los derivados del éster boronato pueden hidrolizarse a los derivados de ésteres boronato correspondiente si fuese necesario. Además, de acuerdo con un método descrito en un artículo de revisión de Molander et al. Acc. Chem. Res. 2007, 40, 275 y similares, los derivados del éster boronato anteriormente mencionados pueden fluorarse con bifluoruro de potasio y similares para obtener las sales de trifluoroborato (BF₃⁻K⁺).

Ejemplos del catalizador a usarse en la reacción incluyen acetato de paladio (II), diclorobis(trifenilfosfina)paladio, tetraquitrifenilfosfinapaladio (0), acetato de paladio (II)/trisciclohexilfosfina, dicloruro de bis(difenilfosfina ferrocenil)paladio (II), dímero 1,3-bis(2,6-diisopropilfenil)imidazol-2-ilideno (1,4-naftoquinona)paladio, aril(cloro)(1,3-dimetil-1,3-dihidro-2H-imidazol-2-ilideno)paladio o acetato de paladio (II)/dicrohexil(2',4',6'-triisopropilbifenil-2-il)fosfina y tris(dibencilidenoacetona)dipaladio y similares.

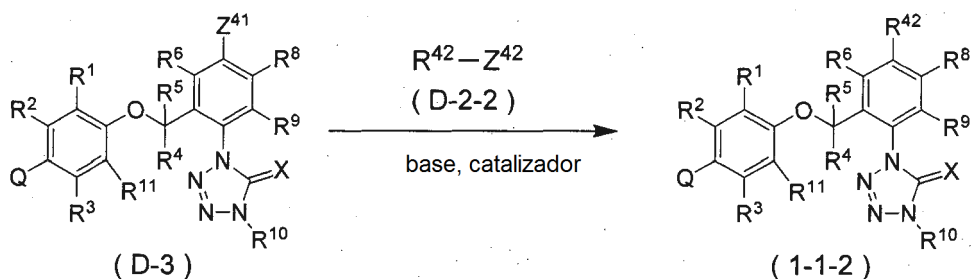
Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclonono; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, cloruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; fosfatos de metal alcalino, tales como fosfato de tripotasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

En la reacción, El Compuesto (D-2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares y el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,0001 a 1 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (D-1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

50 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-1). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

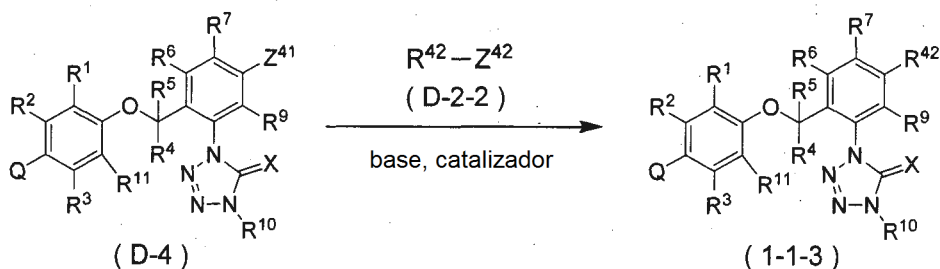
55 De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-1) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R⁷ representa R⁴², es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-1-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-1-2)), puede prepararse mediante el acoplamiento del Compuesto (D-3) (en lo sucesivo en el presente documento, se describe como Compuesto (D-3)) con un compuesto de a formula (D-2-2) (en lo sucesivo en el presente documento, se describe como Compuesto (D-2-2)) en presencia de una base y el catalizador.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, Q, Z⁴¹, Z⁴² y X son los mismos como se han definido anteriormente, R⁴² representa un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alquenilo C2-C3 o un grupo haloalquenilo C2-C3]

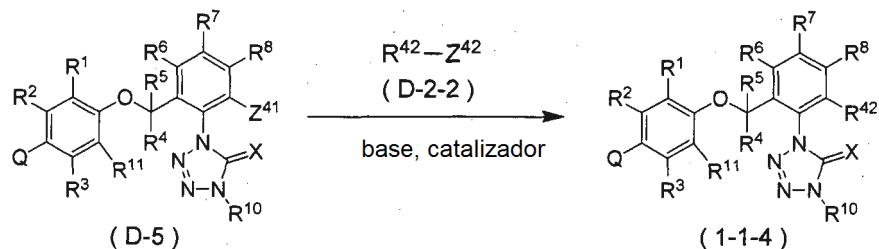
De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-1) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R⁸ representa R⁴², es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-1-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-1-3)), puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (D-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (D-4)) con el Compuesto (D-2-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (D-2-2)) en presencia de una base y un catalizador.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁴², X, Q, Z⁴¹, Z⁴² y X son los mismos como se han definido anteriormente]

De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-1) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R⁹ representa R⁴², es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-1-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-1-4)), puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (D-5) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (D-5)) con el Compuesto (D-2-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (D-2-2)) en presencia de una base y un catalizador.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰, R¹¹, R⁴², X, Q, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que R⁶ representa R⁴¹, y uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en R⁷, R⁸ y R⁹ es R⁴² puede prepararse de acuerdo con el Proceso D anteriormente mencionado.

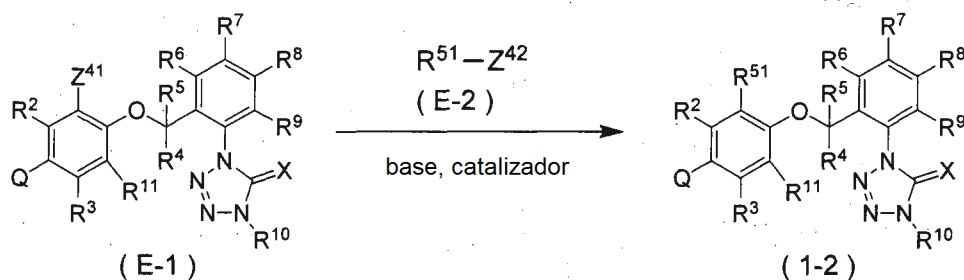
El Compuesto (1-1), el Compuesto (1-1-2), el Compuesto (1-1-3) y el Compuesto (1-1-4) pueden prepararse usando otra reacción de acoplamiento conocida en lugar de la reacción de acoplamiento del Proceso D anteriormente

mencionada.

(Proceso E)

- 5 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa R^{51} , es decir, el compuesto de una fórmula (1-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-2)), puede prepararse mediante el acoplamiento del Compuesto (E-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-1)) con un compuesto de a fórmula (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.

10



[en la que

- 15 $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Z^{41}, Z^{42}, X$ y Q son los mismos como se han definido anteriormente, R^{51} representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alqueniilo C2-C6, un grupo haloalqueniilo C2-C6, un grupo alquiniilo C2-C6, un grupo haloalquiniilo C2-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

20

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25

- 30 El Compuesto (E-2) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado o puede prepararse de acuerdo con un método descrito en un artículo de revisión de N. Miyaura y A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457 y similares. El Compuesto (E-2) a usarse en la reacción también puede prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de yodo ($R^{51}-I$) o un compuesto de bromo ($R^{51}-Br$) con un alquililitio (tal como butillitio), seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con ésteres de borato para obtener derivados del éster boronato. Además, los derivados del éster boronato pueden hidrolizarse a los derivados de ésteres boronato correspondiente si fuese necesario. Además, de acuerdo con un método descrito en un artículo de revisión de Molander et al. Acc. Chem. Res. 2007, 40, 275 y similares, los derivados del éster boronato anteriormente mencionados pueden fluorarse con bifluoruro de potasio y similares para obtener las sales de trifluoroborato ($BF_3^- K^+$).

40

Ejemplos del catalizador a usarse en la reacción incluyen acetato de paladio (II), diclorobis(trifenilfosfina)paladio, tetraquitrifenilfosfinapaladio (0), acetato de paladio (II)/trisciclohexilfosfina, dicloruro de bis(difenilfosfina ferrocenil)paladio (II), dímero 1,3-bis(2,6-diisopropilfenil)imidazol-2-ilideno (1,4-naftoquinona)paladio, aril(cloro)(1,3-dimetil-1,3-dihidro-2H-imidazol-2-ilideno)paladio o acetato de paladio (II)/diciclohexil(2',4',6'-trisisopropilbifenil-2-il)fosfina y tris(dibencilidenoacetona)dipaladio y similares.

45

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, cloruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; fosfatos de metal alcalino, tales como fosfato de tripotasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

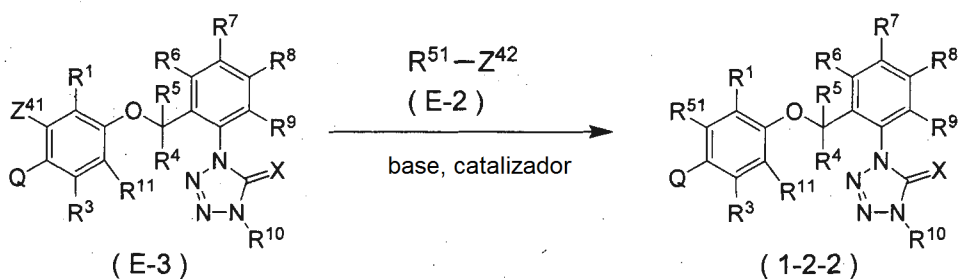
55

En la reacción, El Compuesto (E-2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares y el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,0001 a 1 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (E-1).

5 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

10 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-2). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

15 De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-2) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R² representa R⁵¹, es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-2-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-2-2)), puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (E-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-3)) con el Compuesto (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.

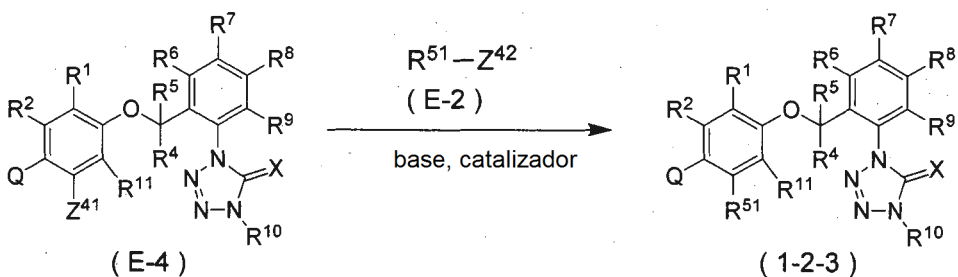


20

[en la que R¹, R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁵¹, X, Q, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

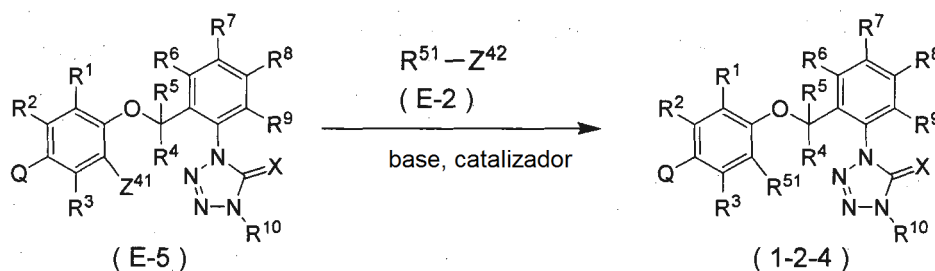
25 De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-2) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R³ representa R⁵¹, es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-2-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-2-3)), puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (E-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-4)) con el Compuesto (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.

30



35 [en la que R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁵¹, X, Q, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

40 De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-2) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R¹¹ representa R⁵¹, es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-2-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-2-4)), puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (E-5) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-5)) con el Compuesto (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R⁵¹, X, Q, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

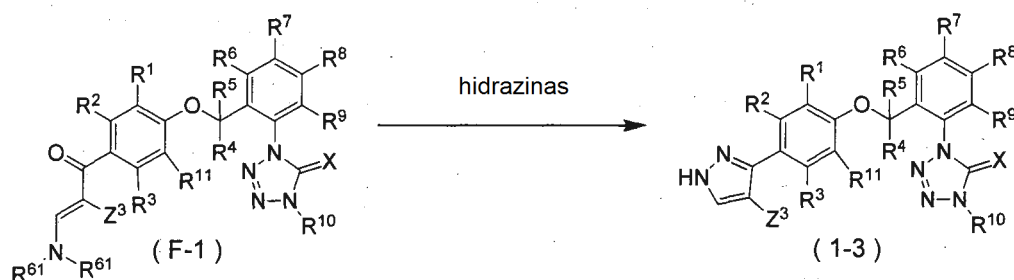
5 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que dos o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en R¹, R², R³ y R¹¹ es R⁵¹ puede prepararse de acuerdo con el Proceso E anteriormente mencionado.

10 El Compuesto (1-2), el Compuesto (1-2-2), el Compuesto (1-2-3) y el Compuesto (1-2-4) pueden prepararse usando otra reacción de acoplamiento conocida en lugar de la reacción de acoplamiento del Proceso E anteriormente mencionada.

(Proceso F)

15 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q₂, y Z¹ y Z² representan un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-3)), puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (F-1) anteriormente mencionada (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (F-1)) con hidrazinas.

20



[en la que

25 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente, y R⁶¹ representa un grupo metilo o un grupo etilo]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

30 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

35

Ejemplos de las hidrazinas a usarse en la reacción incluyen monohidrato de hidrazina, clorhidrato de hidrazina, sulfato de hidrozina, hidrazina anhidro y similares.

40 En la reacción, normalmente se usan hidrazinas dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (F-1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

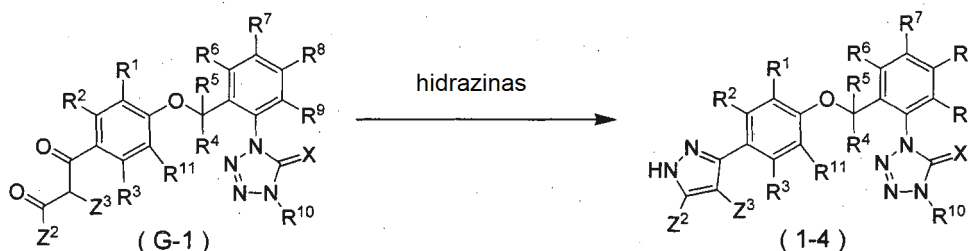
45

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente

compuesto de la fórmula (1-3). Como alternativa, la reacción se completa, las mezclas de reacción se someten a tratamiento (por ejemplo, concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-3). Además, este presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

5 (Proceso G)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, y Z¹ representa un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto de una fórmula mencionada a continuación (1-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-4)), puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (G-1) anteriormente mencionada (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (G-1)) con hidrazinas.



15 [en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

20 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos de las hidrazinas a usarse en la reacción incluyen monohidrato de hidrazina, clorhidrato de hidrazina, sulfato de hidroazina, hidrazina anhidro y similares.

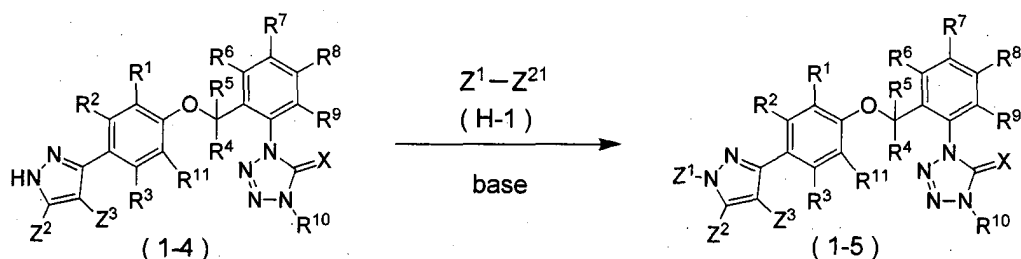
30 En la reacción, normalmente se usan hidrazinas dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (G-1).

35 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

40 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-4). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso H)

45 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, es decir, el compuesto de una fórmula (1-5) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-5)), puede prepararse mediante haciendo reaccionar el Compuesto (1-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-4)) con un compuesto fórmula (H-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (H-1)) en presencia de una base.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z¹, Z², Z³, Z²¹ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

5

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

15

El Compuesto (H-1) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen alquilos halogenados, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, bromuro de butilo, bromuro de pentilo, bromuro de hexilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, yoduro de propilo, yoduro de isopropilo, yoduro de isobutilo, yoduro de isoamilo, yoduro de 2-propinilo, yoduro de 2-butinilo, bromuro de alilo, bromuro de ciclopropilo, bromuro de 2-propinilo, bromuro de 2-butinilo, bromuro de ciclopropilmetilo, 1,1-difluoro-2-yodoetano y 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano; sulfonatos de alquilo o arilo, tales como sulfatos de dimetilo, p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo, metanosulfonato de etilo, metanosulfonato de propilo; haluros carboxílicos, tales como cloruro de acetilo; y haluros sulfónicos, tales como cloruro de metanosulfonilo, cloruro de etanosulfonilo, sulfonilcloruro de isopropinilo, sulfonilcloruro de ciclopropinilo y cloruro de N,N-dimetilsulfonilo.

20

25

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, cloruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio y *terc*-butóxido de potasio.

30

35

En la reacción, El compuesto (H-1) se usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de una relación de 1 a 10 molar, frente a 1 mol del Compuesto (1-4).

40

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-5). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

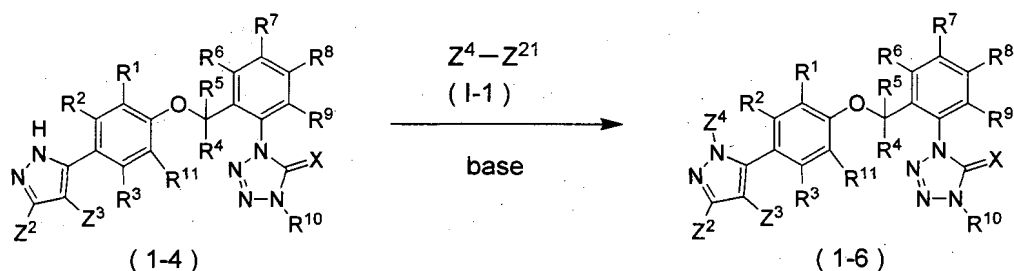
45

(Proceso I)

50

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4, es decir, el compuesto de una fórmula (1-6) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-6)), puede prepararse mediante haciendo reaccionar el Compuesto (1-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-4)) con un compuesto formula (I-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (I-1)) en presencia de una base.

55



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Z^2, Z^3, Z^4, Z^{21}$ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

5

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

10

El Compuesto (I-1) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen alquilos halogenados, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, bromuro de butilo, bromuro de pentilo, bromuro de hexilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, yoduro de propilo, yoduro de isopropilo, yoduro de isobutilo, yoduro de isoamilo, bromuro de alilo, bromuro de ciclopropilo y 1,1-difluoro-2-yodoetano; sulfonatos de alquilo o arilo, tales como sulfatos de dimetilo, p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo, metanosulfonato de etilo, metanosulfonato de propilo; haluros carboxílicos, tales como cloruro de acetilo; y haluros sulfónicos, tales como cloruro de metanosulfonilo, cloruro de etanosulfonilo, sulfonilcloruro de isopropinilo, sulfonilcloruro de ciclopropinilo y cloruro de N,N-dimetilsulfonilo.

15

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, cloruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio y *terc*-butóxido de potasio.

20

25

En la reacción, El compuesto (I-1) se usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de una relación de 1 a 10 molar, frente a 1 mol del Compuesto (1-4).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-6). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

35

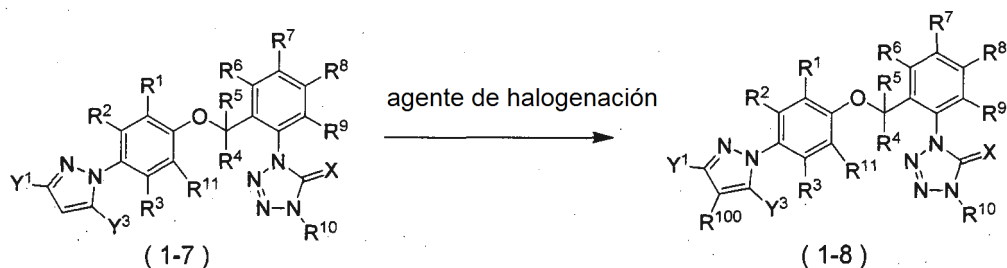
(Proceso J)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1 e Y² representa R¹⁰⁰, es decir, el compuesto de una fórmula (1-8) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-8)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-7) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-7)) con un agente de halogenación.

40

45

50



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Y¹, Y³ y X son los mismos como se han definido anteriormente, y R¹⁰⁰ representa un átomo de cloro, un átomo de bromo o un átomo de yodo.]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano y clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

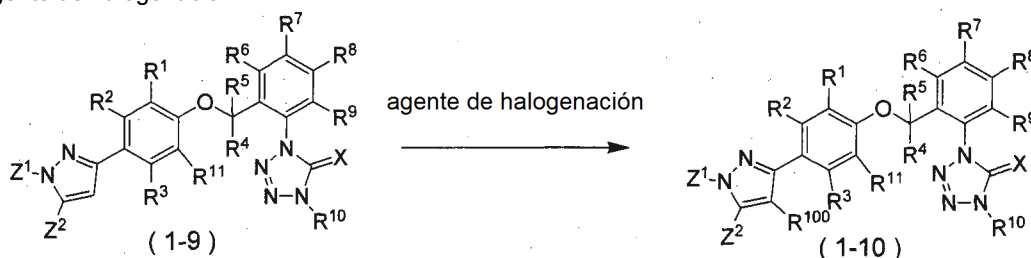
Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, N-yodosuccinimida, cloro, bromo, yodo y cloruro de sulfurilo.

En la reacción, el agente de halogenación se usa dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-7).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-8). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

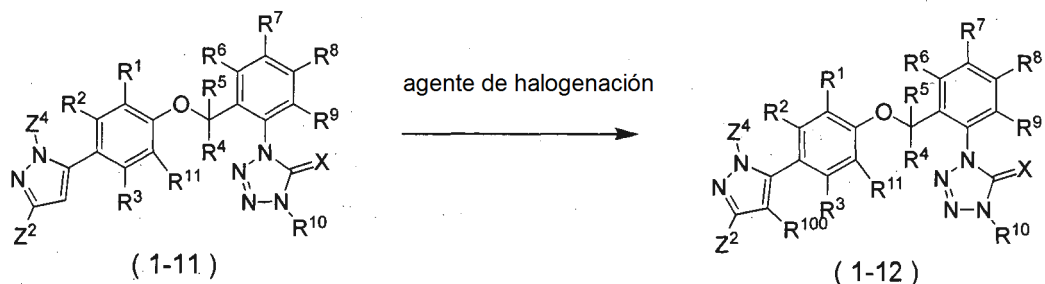
De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-8), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q₂ y Z³ representa un R 100, es decir, el compuesto de una fórmula (1-10) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-10)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-9) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-9)) con un agente de halogenación.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z¹, Z², R¹⁰⁰ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-8), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q₄ y Z³ representa un R 100, es decir, el compuesto de una fórmula (1-12) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-12)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-11) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-11)) con un agente de halogenación.

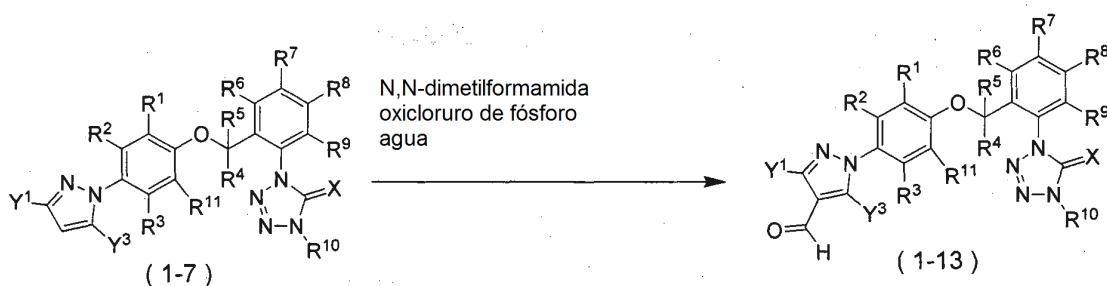


[en la que
 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z², Z⁴, R¹⁰⁰ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

5

(Proceso K)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1 e Y² representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (1-13) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-13)),
 10 puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-7) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-7)) con un agente de formilación, que se prepara a partir de N,N-dimetilformamida y oxiclورو de fósforo, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con agua.



15

[en la que
 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Y¹, Y³ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

20

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

25

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano y clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

30

En la reacción, el agente de formilación se usa como una mezcla de 1 a 10 relaciones molares de N,N-dimetilformamida y de 1 a 10 relaciones molares de oxiclورو de fósforo, frente a 1 mol del Compuesto (1-7), y se usa agua dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-7).

35

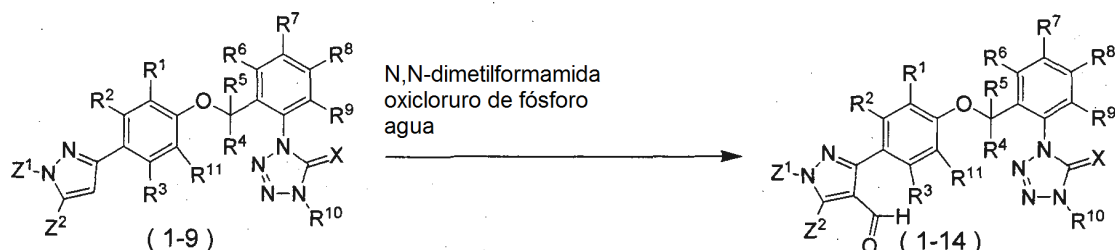
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

40

Cuando la reacción se completa, normalmente se añade a la misma 1 mol o más de agua, y las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-13). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

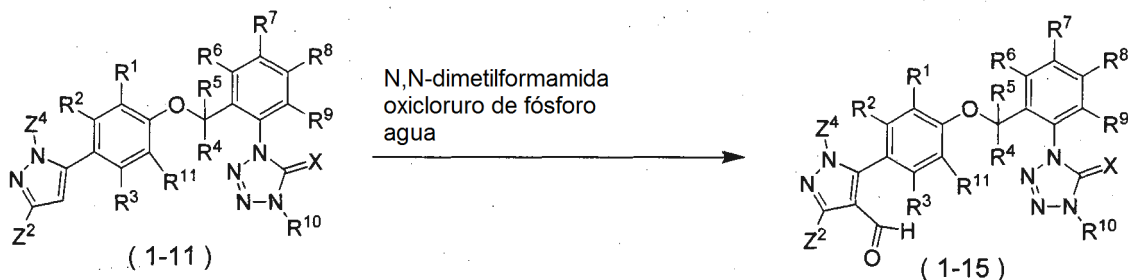
45

De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-13), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z³ representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (1-14) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-14)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-9) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-9)) con un agente de formilación, que se prepara a partir de N,N-dimetilformamida y oxiclورو de fósforo, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con agua.



[en la que
R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z¹, Z² y X son los mismos como se han definido anteriormente]

5 De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-13), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q₄ y Z³ representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (1-15) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-15)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-11) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-11)) con un agente de formilación, que se prepara a partir de N,N-dimetilformamida y oxicloruro de fósforo, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con agua.

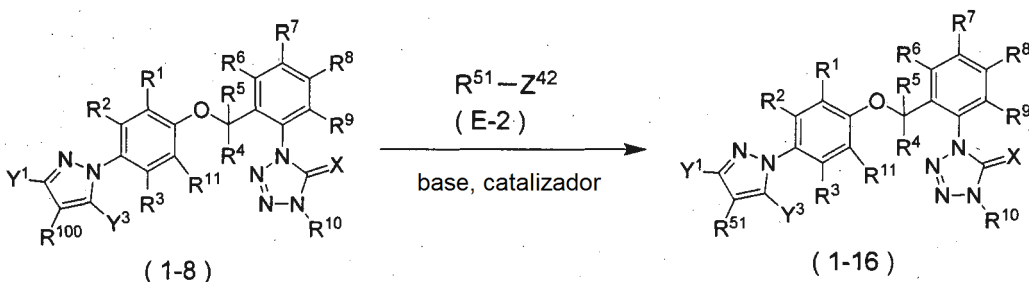


15 [en la que
R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z², Z⁴ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

(Proceso I)

20 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q₁ e Y² representa R⁵¹, es decir, el compuesto de una fórmula (1-16) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-16)), puede prepararse mediante el acoplamiento del Compuesto (1-8) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-8)) con un compuesto de a formula (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.

25



[en la que
R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁵¹, R¹⁰⁰, Y¹, Y³, X y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

30

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

35 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de

metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

5 El Compuesto (E-2) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado o puede prepararse de acuerdo con un método descrito en un artículo de revisión de N. Miyaura y A. Suzuki, Chem. Rev. 1995, 95, 2457 y similares. El Compuesto (E-2) a usarse en la reacción también puede prepararse, por ejemplo, haciendo reaccionar un compuesto de yodo ($R^{51}-I$) o un compuesto de bromo ($R^{51}-Br$) con un alquil-litio (tal como butillitio), seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con ésteres de borato para obtener ésteres boronato y además, si se necesitase, la hidrolización de los ésteres boronato obtenidos. Además, de acuerdo con un método descrito en un artículo de revisión de Molander et al. Acc. Chem. Res. 2007, 40, 275 y similares, el éster boronato anteriormente mencionado puede fluorarse con bifluoruro de potasio y similares para obtener las sales de trifluoroborato ($BF_3 \cdot K^+$).

15 Ejemplos del catalizador a usarse en la reacción incluyen acetato de paladio (II), diclorobis(trifenilfosfina)paladio, tetraquitrifenilfosfinapaladio (0), acetato de paladio (II)/trisciclohexilfosfina, dicloruro de bis(difenilfosfina ferrocenil)paladio (II), dímero 1,3-bis(2,6-diisopropilfenil)imidazol-2-ilideno (1,4-naftoquinona)paladio, aril(cloro)(1,3-dimetil-1,3-dihidro-2H-imidazol-2-ilideno)paladio o acetato de paladio (II)/díciclohexil(2',4',6'-trisisopropilbifenil-2-il)fosfina y tris(dibencilidenoacetona)dipaladio y similares.

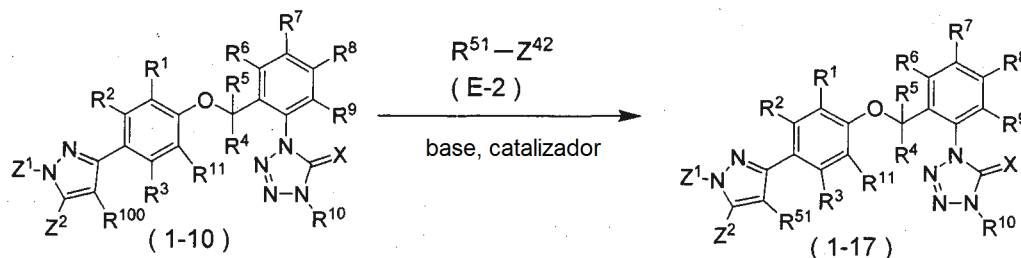
20 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio, cloruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; fosfatos de metal alcalino, tales como fosfato de tripotasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

30 En la reacción, El Compuesto (E-2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares y el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,0001 a 1 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-8).

35 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

40 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-16). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

45 De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-16), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z^3 representa un R 51, es decir, el compuesto de una fórmula (1-17) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-17)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-10) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-10)) con un compuesto de a formula (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.

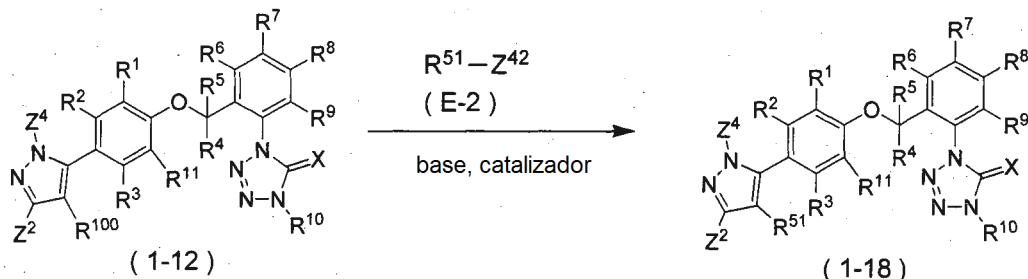


50 [en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{51}, R^{100}, X, Z^1, Z^2$ y Z^{42} son los mismos como se han definido anteriormente]

55 De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-16), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4 y Z^3 representa un R 51, es decir, el compuesto de una

fórmula (1-18) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-18)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-12) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-12)) con un compuesto de a fórmula (E-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (E-2)) en presencia de una base y un catalizador.

5

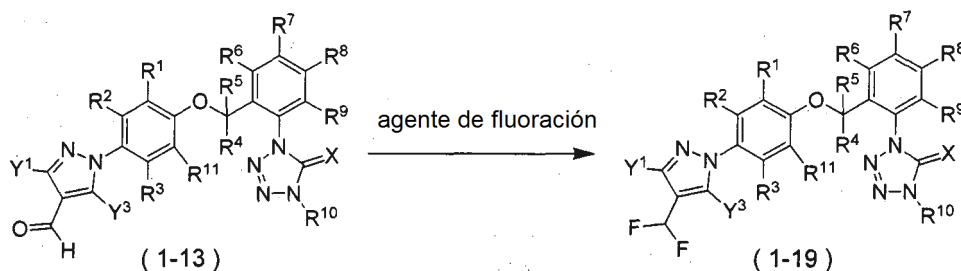


[en la que

10 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁵¹, R¹⁰⁰, X, Z², Z⁴ y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

(Proceso M)

15 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1 e Y² representa un grupo difluorometilo, es decir, el compuesto de una fórmula (1-19) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-19)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-13) con un agente de fluoración.



20 [en la que

R¹, R², R³, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Y¹, Y³ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

25 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

35 Un agente de fluoración a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado, e incluye, por ejemplo, trifluoruro de (dietilamino)-sulfuro, trifluoruro de bis(metoxietil)-aminosulfuro, trifluoruro de 4-*tert*-butil-2,6-dimetilfenilsulfuro, tetrahydroborato de (dietilamino)-difluorosulfonio y tetrahydroborato de difluoro(morfrino)sulfonio. En la reacción, también puede añadirse un acelerador de reacción, que incluye, por ejemplo, (1.8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno y trihydroborato de trietilamina.

40 En la reacción, el agente de fluoración se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 20 relaciones molares y el acelerador de reacción se usa normalmente dentro de un intervalo de 0 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-13).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

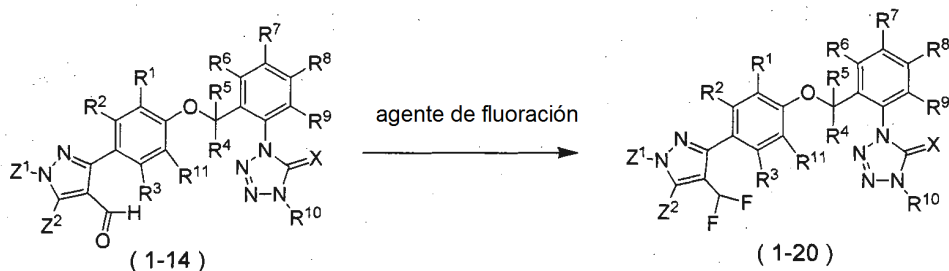
45

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las

capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-19). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

5 De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-19), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z³ representa un grupo difluorometilo, es decir, el compuesto de una fórmula (1-20) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-20)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-14) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-14)) con un agente de fluoración.

10

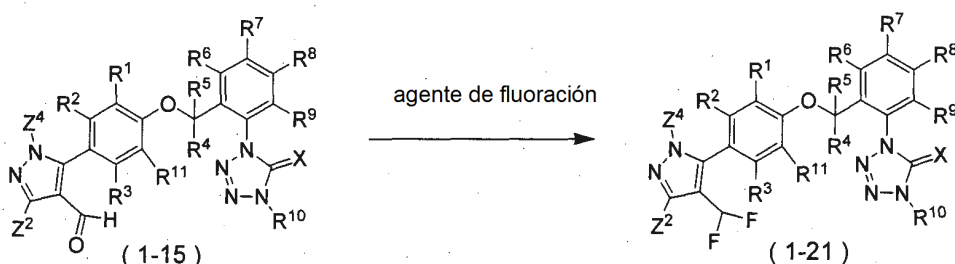


[en la que
15 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z¹, Z² y X son los mismos como se han definido anteriormente]

15

De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-19), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4 y Z³ representa un grupo difluorometilo, es decir, el compuesto de una fórmula (1-21) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-21)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-15) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-15)) con un agente de fluoración.

20

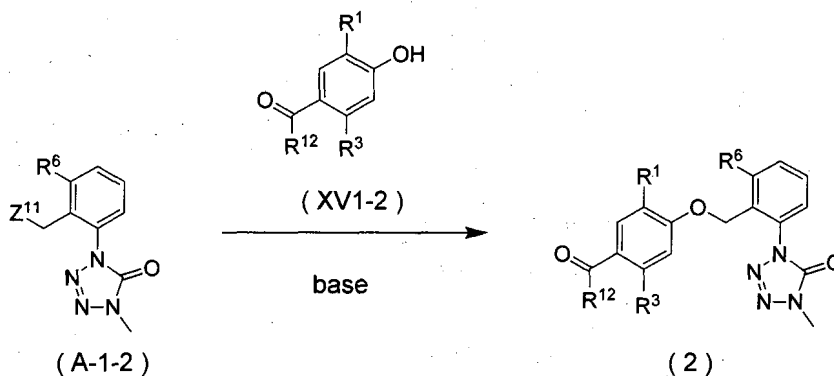


[en la que
25 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z², Z⁴ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

25

(Proceso N)

30 El presente compuesto de la fórmula (2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de a formula (A-1-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (A-1-2)) con un compuesto de una formula (XV1-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XV1-2)) en presencia de una base.



[en la que

R¹, R³, R⁶, R¹² y Z¹¹ son los mismos como se han definido anteriormente]. Esta reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente.

- 5 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

- 15 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

- 25 En la reacción, El compuesto (XV1-2) se usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de una relación de 1 a 10 molar, frente a 1 mol del Compuesto (A-1-2).

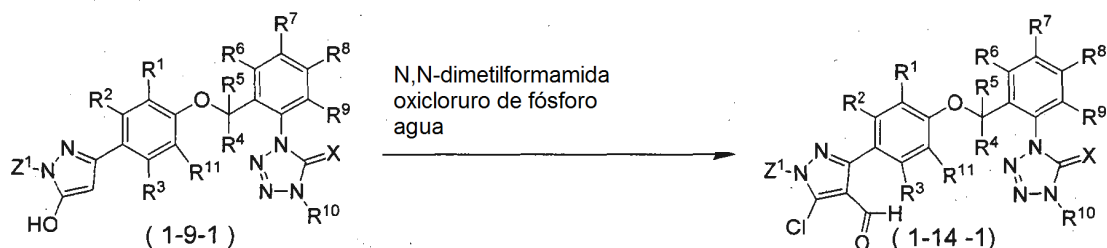
- La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 30 Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción yoduro de sodio, yoduro de tetrabutilamonio y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (A-1-2).

- 35 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (2). Como alternativa, la mezclas de reacción se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (2). Además, este presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso O)

- 40 De acuerdo con el proceso K, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, Z² representa un átomo de cloro, y Z³ representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (1-14-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-14-1)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-9) en el que Z² representa un grupo hidroxilo, es decir, el compuesto de una fórmula (1-9-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-9-1)) con un agente de formilación, que se prepara a partir de N,N-dimetilformamida y oxiclورو de fósforo, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con agua.



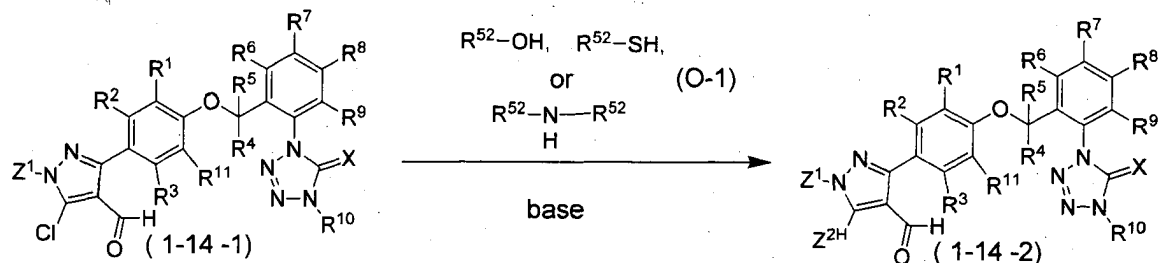
- 50 [en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z¹ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

(Proceso P)

- 55 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, Z² representa Z^{2H} y Z³ representa un grupo

aldehído, es decir, un compuesto de una fórmula (1-14-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-14-2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de a fórmula (1-14-1) con un compuesto de a fórmula (O-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (O-1)) en presencia de una base.

5



En la que

10 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Z^1$ y X son los mismos como se han definido anteriormente, R^{52} representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6 y un grupo haloalquino C2-C6, y Z^{2H} representa OR^{52}, SR^{52} o $N(R^{52})_2$

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

15 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

35 En la reacción, El compuesto (O-1) se usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de una relación de 1 a 10 molar, frente a 1 mol del Compuesto (1-14-1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

40 En la reacción, también pueden usarse sales metálicas del Compuesto (O-1), que se prepararan previamente haciendo reaccionar el Compuesto (O-1) con carbonatos de metal alcalino, bicarbonatos de metal alcalino, hidróxidos de metal alcalino, haluros de metal alcalino, hidruros de metal alcalino o alcóxidos de metal alcalino.

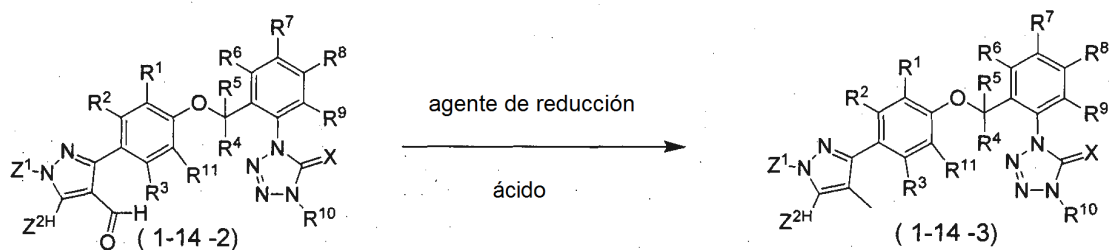
45 En la reacción, las sales metálicas del Compuesto (O-1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-14-1).

50 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-14-2). Como alternativa, la mezclas de reacción se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-14-2). Además, este presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso Q)

55 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, Z^2 representa Z^{2H} y Z^3 representa un grupo metilo, es decir, un compuesto de una fórmula (1-14-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-14-3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (1-14-2) con un agente

reductor en presencia de un ácido.



5 [en la que
 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, Z¹, Z^{2H} y X son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

10 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de reducción a usarse incluyen compuestos de boronato metálicos, tales como borohidruro de litio, borohidruro de sodio, borohidruro de potasio; y compuestos de trialquilsilano, tales como trietilsilano.

Ejemplos de los ácidos a usarse en la reacción incluyen trifluoruro de boro y ácido trifluoroacético.

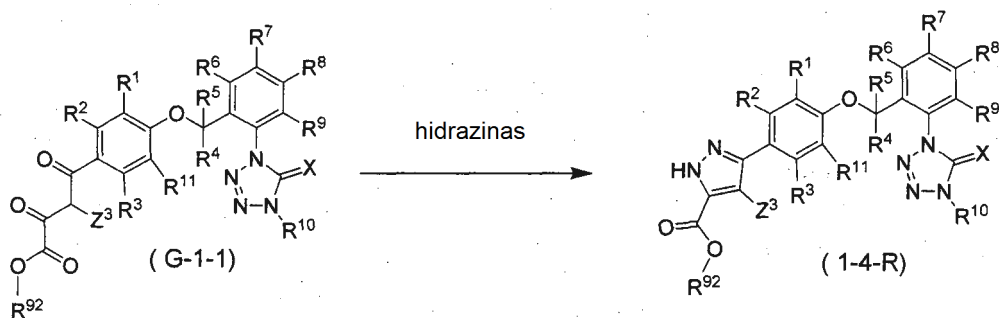
En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-14-2).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-14-3). Como alternativa, la mezclas de reacción se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-14-3). Además, este presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso R)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, Z¹ representa un átomo de hidrógeno y Z² representa un grupo alcocarbonilo C2-C6, es decir, un compuesto de una fórmula (1-4-R) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-4-R)), puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (G-1-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (G-1-1)) con hidrazinas.



45 [en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente, y R⁹² representa un grupo alquilo C1-C5]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

5 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

15 Ejemplos de las hidrazinas a usarse en la reacción incluyen monohidrato de hidrazina, clorhidrato de hidrazina, sulfato de hidrazina, hidrazina anhidro y similares.

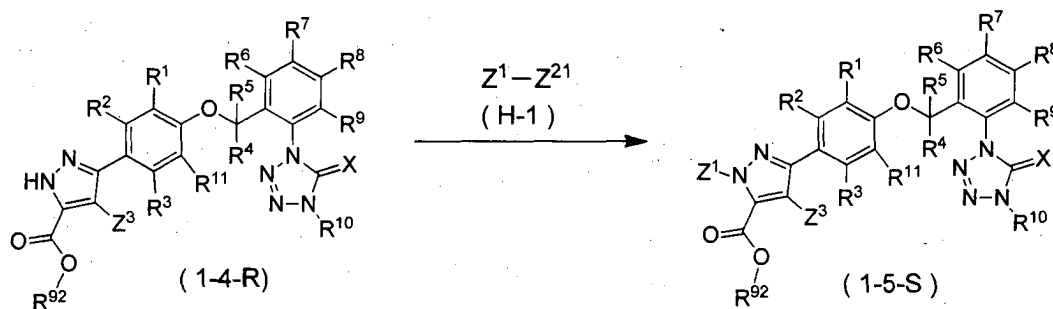
En la reacción, normalmente se usan hidrazinas dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (G-1-1).

20 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-4-R). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso S)

30 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z² representa un grupo alcoxicarbonilo C2-C6, es decir, un compuesto de una fórmula (1-5-S) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-5-S)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-4-R) con el Compuesto (H-1) opcionalmente en presencia de una base.



35

[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁹², X, Z¹, Z³ y Z²¹ son los mismos como se han definido anteriormente]

40 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

45 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

50 El Compuesto (H-1) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen haluros de alquilo, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, bromuro de butilo, bromuro de hexilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, yoduro de propilo, yoduro de isopropilo, yoduro de isobutilo, yoduro de isoamilo, yoduro de 2-propinilo, yoduro de 2-butililo, bromuro de alilo, bromuro de ciclopropilo, bromuro de 2-propinilo, bromuro de 2-butililo, bromuro de ciclopropilmetilo, 1,1-difluoro-2-yodoetano y 1,1,1-trifluoro-2-yodoetano; sulfonatos de alquilo o

55

arilo, tales como sulfatos de dimetilo, p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo, metanosulfonato de etilo, metanosulfonato de propilo; haluros carboxílicos, tales como cloruro de acetilo; y haluros sulfónicos, tales como cloruro de metanosulfonilo, cloruro de etanosulfonilo, sulfonilcloruro de isopropinilo, sulfonilcloruro de ciclopropinilo y cloruro de N,N-dimetilsulfonilo.

5 En la reacción, puede usarse una base, que incluye, por ejemplo, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

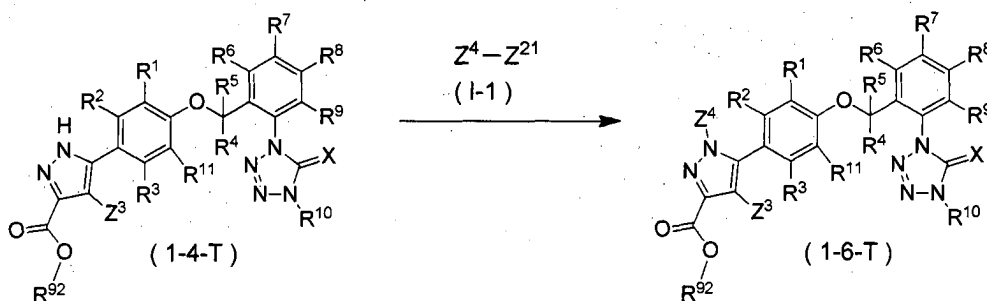
15 En la reacción, El compuesto (H-1 usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-4-R).

20 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-5-S). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso T)

30 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4 y Z² representa un grupo alcóxicarbonilo C2-C6, es decir, un compuesto de una fórmula (1-6-T) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-6-T)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (1-4-T) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-4-T)) con el Compuesto (I-1) opcionalmente en presencia de una base.



35 [en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁹², X, Z³, Z⁴ y Z²¹ son los mismos como se han definido anteriormente]

40 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

45 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

50 El Compuesto (I-1) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen haluros de alquilo, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, bromuro de butilo, bromuro de hexilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, yoduro de propilo, yoduro de isopropilo, yoduro de isobutilo, yoduro de isoamilo, bromuro de aliilo, bromuro de ciclopropilo y 1,1-difluoro-2-yodoetano; sulfonatos de alquilo o arilo, tales como sulfatos de dimetilo, p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo,

metanosulfonato de etilo, metanosulfonato de propilo; haluros carboxílicos, tales como cloruro de acetilo; y haluros sulfónicos, tales como cloruro de metanosulfonilo, cloruro de etanosulfonilo, sulfonilcloruro de isopropinilo, sulfonilcloruro de ciclopropinilo y cloruro de N,N-dimetilsulfonilo.

- 5 En la reacción, puede usarse una base, que incluye, por ejemplo, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.
- 10
- 15 En la reacción, el Compuesto (1-1) usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-4-T).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 20 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-6-T). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

25 (Proceso U)

- El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z² representa un grupo aminocarbonilo, es decir, un compuesto de una fórmula (1-5-U) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-5-U)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-5-S) con un agente de amidación.



- 35 [en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁹², X, Z¹ y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 40 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de amidación a usarse en la reacción incluyen amoníaco acuoso, sal clorhidrato de amoníaco, sal hidrosulfato de amoníaco y gas amoníaco. También puede usarse el agente de amidación como disolvente.

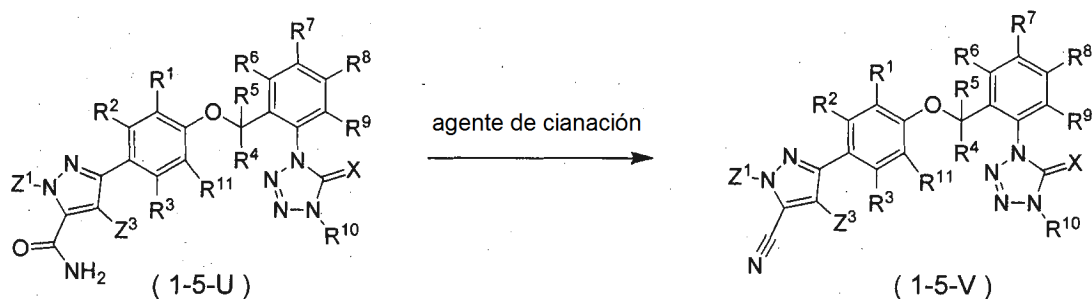
- 50 En la reacción, el agente de amidación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a una gran cantidad de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-5-S).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-5-U). Además, cuando se forman cualquier precipitado, los precipitados se retiran por filtración para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-5-U). Además, estos presentes compuestos aislados

(Proceso V)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z² representa un grupo ciano, es decir, un compuesto de una fórmula (1-5-V) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-5-V)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (1-5-U) con un agente de cianación opcionalmente en presencia de una base.



[en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, Z¹ y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de cianación a usarse en la reacción incluyen oxiclورو de fósforo, pentaclورو de fósforo y oxibromuro de fósforo.

En la reacción, puede usarse una base, que incluyen, por ejemplo, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno. La base también puede usarse como un disolvente.

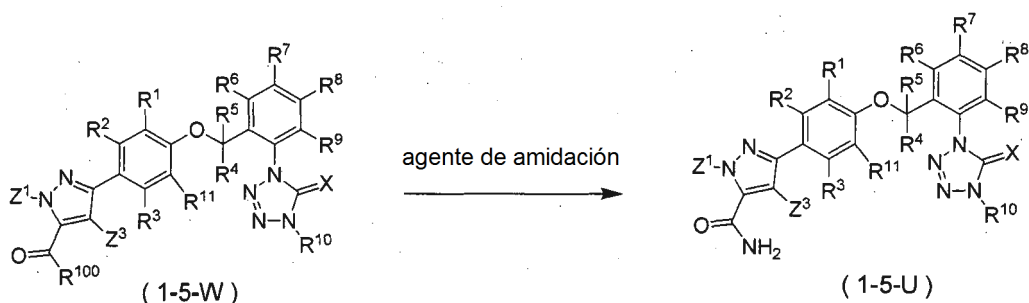
En la reacción, el agente de cianación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 20 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a una gran cantidad de relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-5-U).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-5-V). Además, cuando se forman cualquier precipitado, los precipitados se retiran por filtración para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-5-V). Además, estos presentes compuestos aislados pueden purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso W)

El Compuesto (1-5-U) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (1-5-W) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-5-W)) con un agente de amidación.



[en la que
 5 R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁰⁰, X, Z¹ y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

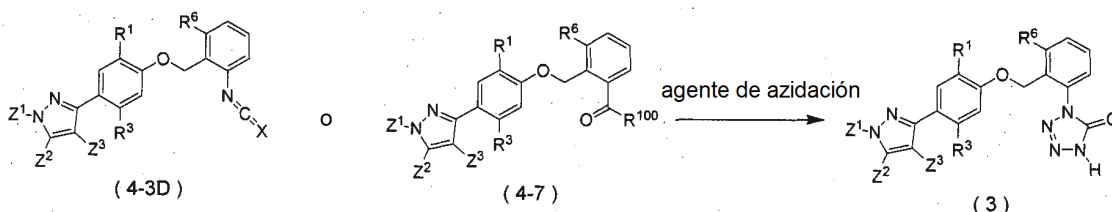
La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso U.

Se describe a continuación con detalle un proceso para la preparación de un compuesto representado por una fórmula (3).

El compuesto representado por la fórmula (3) puede prepararse, por ejemplo, de acuerdo con las síntesis mencionada a continuación.

(Síntesis AA)

Un compuesto representado por la fórmula (3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (4-3D) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-3D)) o un compuesto representado por la fórmula (4-7) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-7)) con un agente de azidación.



[en la que
 25 R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, X, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de azidación a usarse en la reacción incluyen azidas inorgánicas, tales como azida de sodio, azida de bario y azida de litio; y azidas orgánicas, tales como azida de trimetilsililo y azida de difenilfosforilo.

En la reacción, el agente de azidación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-3D) o del Compuesto (4-7).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, puede añadirse a la reacción un ácido de Lewis, tal como cloruro de aluminio y cloruro de cinc, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-3D) o del Compuesto (4-7).

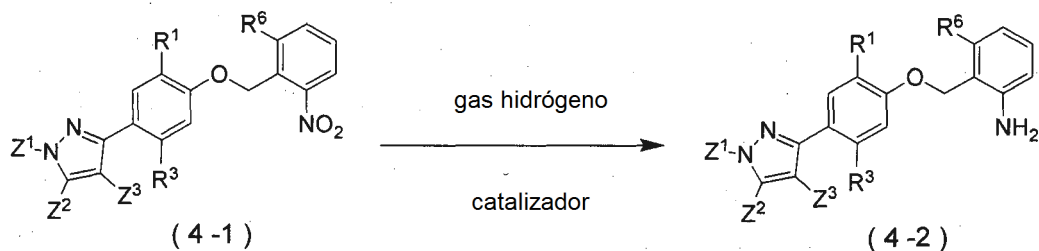
Quando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-1). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

5

(Síntesis B)

Un compuesto representado por la fórmula (4) en la que L¹ representa un grupo amino, es decir, un compuesto representado por la fórmula (4-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-2)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-1) anteriormente mencionado con un gas de hidrógeno en presencia de un catalizador.

10



15 [en la que R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

20 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de butilo; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25

Ejemplos del catalizador a usarse en la reacción incluyen paladio sobre carbono (Pd/C), platino sobre carbono (Pt/C), osmio sobre carbono (Os/C), rutenio sobre carbono (Ru/C), rodio sobre carbono (Rh/C) y níquel Raney.

30 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

En la reacción, el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,01 a 1 relaciones molares, y el gas de hidrógeno se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a una gran cantidad de relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (4-1).

35

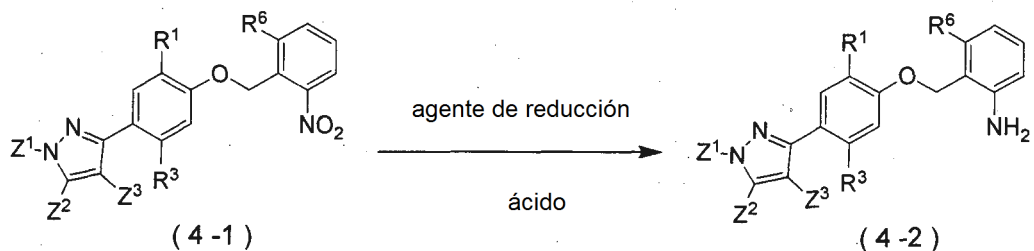
Quando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-2). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-2), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

40

(Síntesis C)

El Compuesto (4-2) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-1) anteriormente mencionado con un agente reductor en presencia de un ácido.

45



[en la que

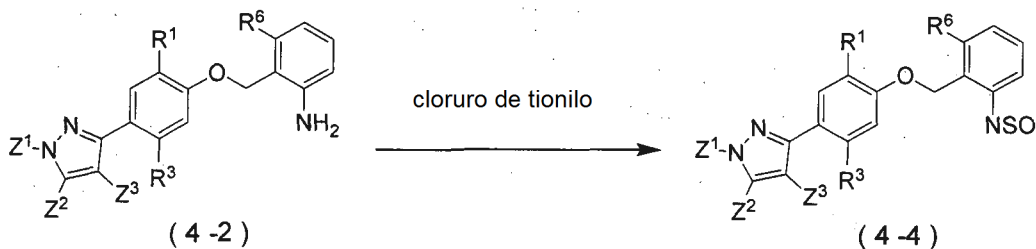
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-3). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

5

(Síntesis E)

El Compuesto (4-2) En el que L¹ es NSO, es decir, un compuesto de una fórmula (4-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-4)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-2) con un cloruro de tionilo.

10



[en la que

15 R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

25

En la reacción, se usa normalmente cloruro de tionilo dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-2).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30

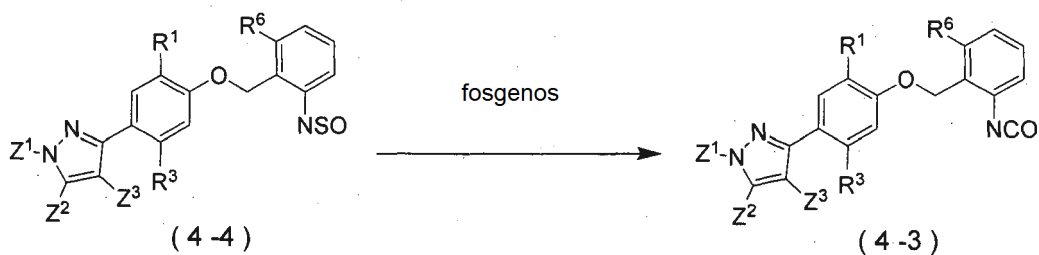
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-4). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-4), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

35

(Síntesis F)

El Compuesto (4-3) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-4) con fosgenos.

40



[en la que

45 R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos de los fosgenos a usarse en la reacción incluyen fosgeno, difosgeno y trifosgeno.

En la reacción, normalmente se usan fosgenos dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-4).

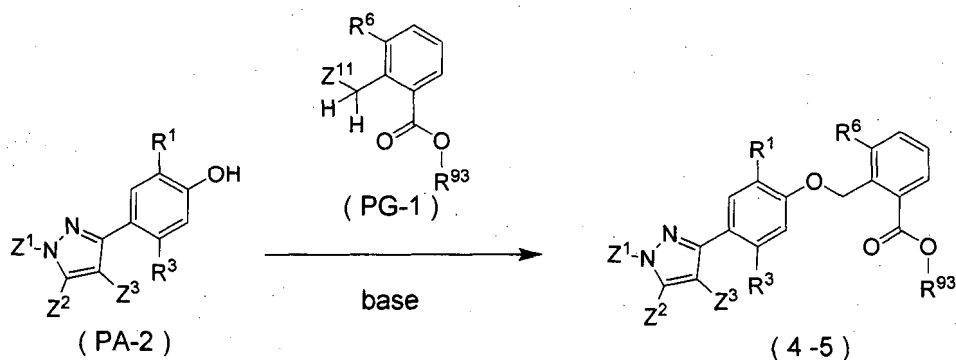
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicicloundeceno y diazabiciclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares pueden añadirse a la reacción, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-4).

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-3). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Síntesis G)

El Compuesto (4) en el que L¹ representa un grupo alcocarbonilo C2-C6, es decir, un compuesto de una fórmula (4-5) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-5)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (PA-2) con el Compuesto (PG-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (PG-1)) en presencia de una base.



[en la que R¹, R³, R⁶, Z¹, Z², Z³ y Z¹¹ son los mismos como se han definido anteriormente, y R⁹³ representa un grupo alquilo C1-C5]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicicloundeceno, diazabiciclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio,

bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

5 En la reacción, el Compuesto (PG-1) usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,5 a 5 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (PA-2).

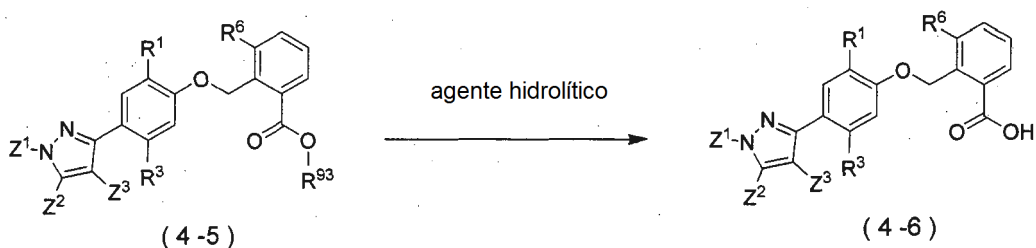
10 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

15 Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción yoduro de sodio, yoduro de tetrabutilamonio y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (PA-2).

20 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-5). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-5), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Síntesis H)

25 El Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo carboxilo, es decir, un compuesto de una fórmula (4-6) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-6)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-5) con un agente hidrolítico.



30 [en la que R¹, R³, R⁶, R⁹³, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

35 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen agua; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; y disolventes mezclas de los mismos.

40 Ejemplos del agente hidrolítico a usarse en la reacción incluyen bases, tales como una solución acuosa de hidróxido de potasio y una solución acuosa de hidróxido de sodio; y ácidos, tales como ácido clorhídrico y ácido sulfúrico.

45 En la reacción, el agente hidrolítico se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,5 a 20 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-5).

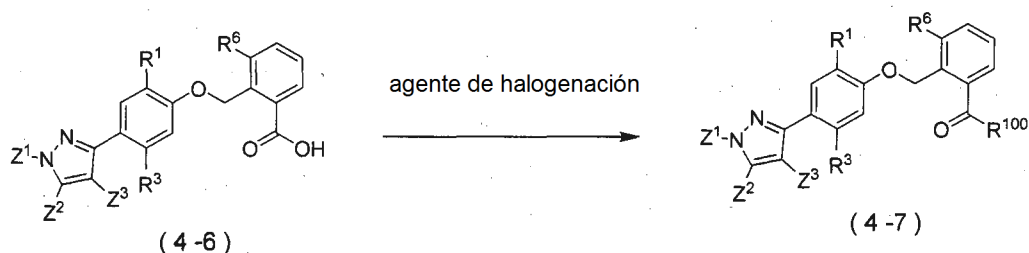
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

50 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-6). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-6), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

55 (Síntesis I)

El Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo halocarbonilo, es decir, un compuesto de una fórmula (4-7) (en lo

sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-7)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-6) con un agente de halogenación.



5

[en la que
R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

10

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

15

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

20

Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen oxiclorigenato de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, cloruro de tionilo, oxibromuro de fósforo, tribromuro de fósforo, pentabromuro de fósforo, triyoduro de fósforo, dicloruro de oxalilo, dibromuro de oxalilo, trifosgeno, difosgeno, fosgeno y cloruro de sulfurilo.

25

En la reacción, el agente de halogenación se usa dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-6).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30

Puede añadirse un catalizador a la reacción, que incluye, por ejemplo, N,N-dimetilformida, trietilamina y diisopropiletilamina. El catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-6).

35

Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-6).

40

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-7). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-7), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

45

(Síntesis J)

El Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo C(O)N₃, es decir, un compuesto de una fórmula (4-8) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-8)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-7) con una azida de sodio.



[en la que
 5 R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-
 10 dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

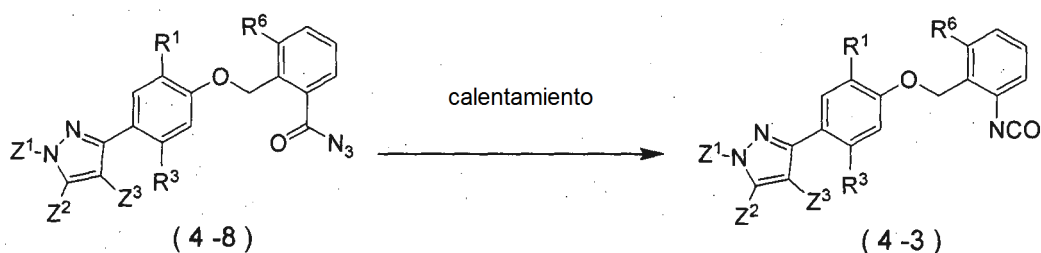
15 En la reacción, la azida de sodio se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-7).

20 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 50 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-8). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-8), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Síntesis K)

30 El Compuesto (4-3) puede prepararse calentando el Compuesto (4-8).



[en la que
 35 R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-
 40 dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

45 La temperatura de reacción normalmente está dentro de un intervalo de temperatura ambiente a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción normalmente está dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

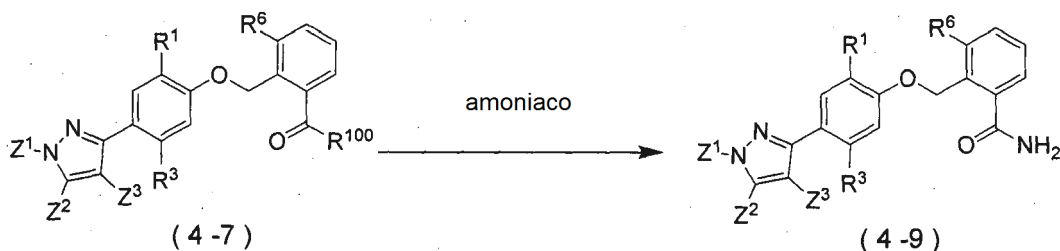
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-3). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-3), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

5

(Síntesis L)

El Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo C(O)NH₂, es decir, un compuesto de una fórmula (4-9) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-9)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-7) con un amoníaco.

10



[en la que

15 R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

20 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; 25 alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

Un amoníaco a usarse en la reacción puede estar en forma de un gas o una solución de amoníaco disuelta en disolventes, tales como agua, metanol, etanol, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y éter dietílico.

30 En la reacción, normalmente se usa amoníaco dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-7).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 50 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

35

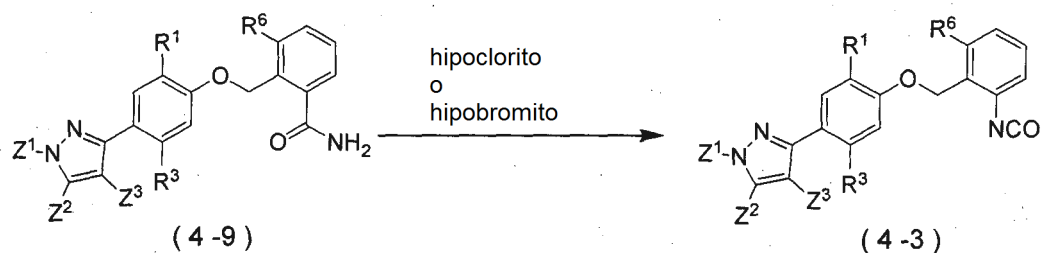
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-9). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-9), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

40

(Síntesis M)

El Compuesto (4-3) también puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-9) con hipoclorito o hipobromito.

45



[en la que

R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

5

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

10

Ejemplos del hipoclorito o hipobromito a usarse en la reacción incluyen hipobromito de sodio, hipoclorito de sodio, hipobromito de potasio, hipoclorito de potasio, hipobromito de bario, hipoclorito de bario, hipobromito de calcio e hipoclorito de calcio.

15

También se mezcla cloro o bromo con hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de bario, hidróxido de calcio y similares para formar un hipoclorito o un hipobromito, que también puede usarse.

20

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

En la reacción, el hipoclorito o hipobromito se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-9).

25

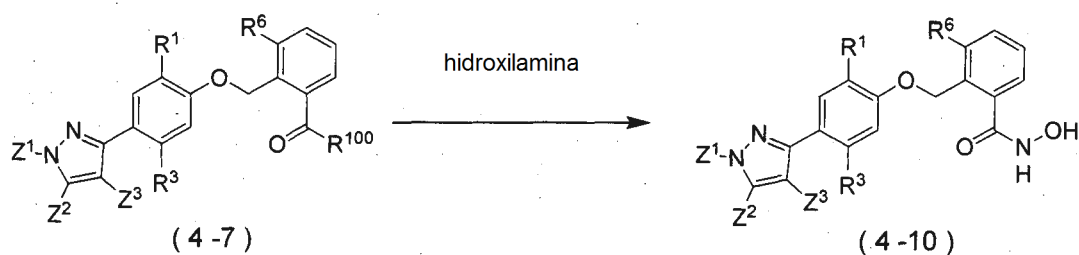
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-3). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

30

(Síntesis N)

El Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo CONHOH, es decir, un compuesto de una fórmula (4-10) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-10)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-7) con hidroxilamina.

35



40 [en la que

R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

45

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

50

En la reacción, la hidroxilamina se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-7).

55

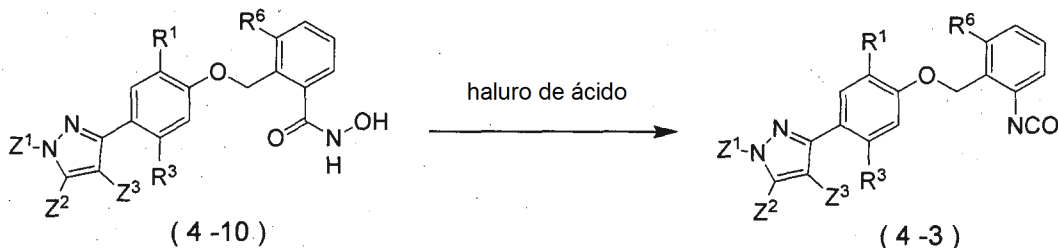
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 50 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-10). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-10), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

5

(Síntesis O)

El Compuesto (4-3) también puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-10) con un haluro de ácido.



10

[en la que

R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

15 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

20

25 Ejemplos del haluro de ácido a usarse en la reacción incluyen anhídrido ácido, tal como anhídrido acético y anhídrido propiónico; haluros de ácido, tales como cloruro de acetilo, bromuro de acetilo y cloruro de benzoilo; cloruros de sulfonilo, tales como cloruro de p-toluenosulfonilo y cloruro de metanosulfonilo; y un complejo trióxido de azufre-piridina y cloruro de tionilo.

30 Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción bases orgánicas, tales como piridina, trietilamina, tributilamina y diazabicycloundeceno, y bases inorgánicas, tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-10).

35 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

En la reacción, el haluro de ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-10).

40

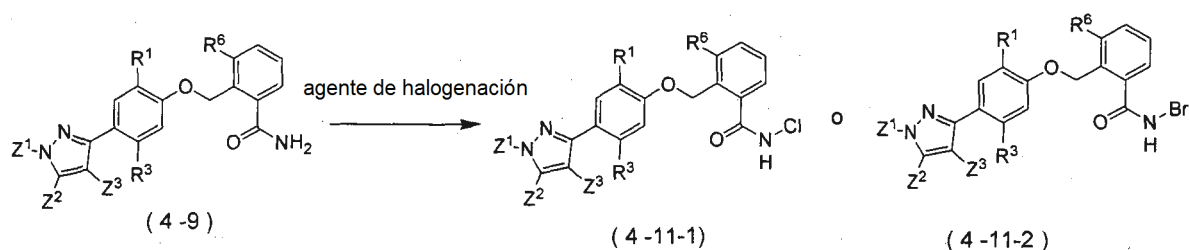
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-3). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-3), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

45

(Síntesis P)

El Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo C(O)NHCl, es decir, un compuesto de una fórmula (4-11-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-11-1)) o Compuesto (4) en el que L¹ es un grupo C(O)NHBr, es decir, un compuesto de una fórmula (4-11-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-11-2)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (4-9) con un agente de halogenación.

50



[en la que
 R¹, R³, R⁶, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

5

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

10

Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen hipoclorito de sodio, hipoclorito de *tert*-butilo, ácido tricloroisocianúrico, cloro y cloruro de sulfurilo.

15

En la reacción, el agente de halogenación se usa dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-9).

20

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Puede añadirse una catalizador a la reacción, y los ejemplos específicos del catalizador incluyen dimetilformamida y similares. El catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-9).

25

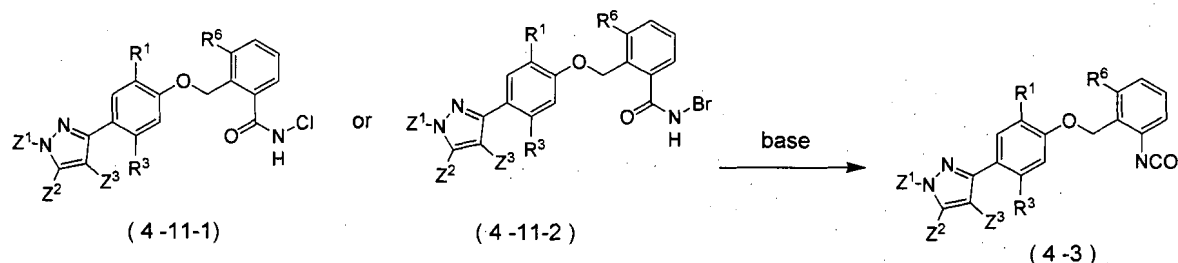
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-11-1) o el Compuesto (4-11-2). Además, el Compuesto aislado (4-11-1) o el Compuesto (4-11-2) puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

30

(Síntesis Q)

También puede prepararse el Compuesto (4-3) haciendo reaccionar el Compuesto (4-11-1) o el Compuesto (4-11-2) con una base.

35



[en la que
 R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

40

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo,

45

propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

- 5 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como piridina, trietilamina, tributilamina y diazabicycloundeceno; y bases inorgánicas, tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio.

En la reacción, la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (4-11-1) o del Compuesto (4-11-2).

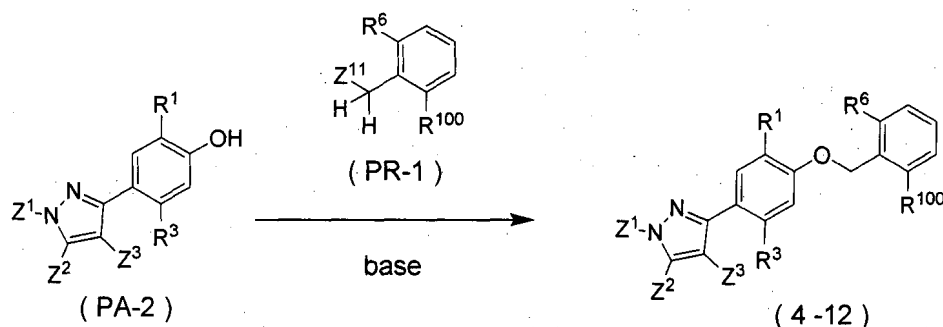
- 10 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 15 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-3). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-3), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Síntesis R)

- 20 El (4) en el que L¹ es un átomo de halógeno, es decir, un compuesto de una fórmula (4-12) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (4-12)), puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (PA-2) con el Compuesto (PR-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (PR-1)) en presencia de una base.

25



[en la que R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z², Z³ y Z¹¹ son los mismos como se han definido anteriormente]

30

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 35 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

40

- 45 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

- 50 En la reacción, el Compuesto (PR-1) usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,5 a 5 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (PA-2).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción yoduro de sodio, yoduro de tetrabutilamonio y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (PA-2).

- 5 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-12). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-12), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

10 (Síntesis S)

También puede prepararse el Compuesto (4-6) haciendo reaccionar el Compuesto (4-12) con un compuesto de metal o metálico, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con un agente de homologación de carbono.



15

[en la que
R¹, R³, R⁶, R¹⁰⁰, Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

- 20 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; y disolventes mezclas de los mismos.

25

Ejemplos del compuesto de metal o metálico a usarse en la reacción incluyen magnesio, bromuro de isopropilmagnesio, bromuro de isopropilmagnesio, butillitio, *sec*-butillitio, *tert*-butillitio y diisopropilamida de litio, y los ejemplos del agente de homologación de carbono incluyen dióxido de carbono.

- 30 En la reacción, el compuesto de metal o metálico se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 20 relaciones molares, y el agente de homologación de carbono se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (4-12).

35 Cuando se usa dióxido de carbono como agente de homologación de carbono, los ejemplos del dióxido de carbono incluyen gas del ácido carbónico y hielo seco.

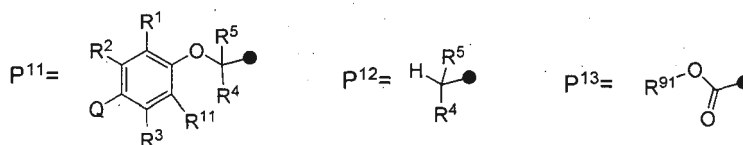
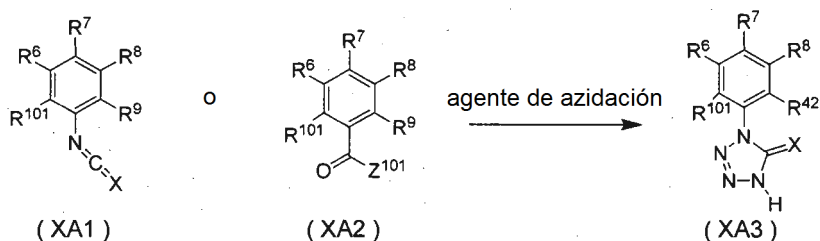
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -80 a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

- 40 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (4-6). Además, puede purificarse el Compuesto aislado (4-6), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización

- 45 A continuación, los métodos para la preparación de los compuestos intermedios se describen a continuación con detalle.

(Proceso de Referencia A)

- 50 Un compuesto de una fórmula (XA3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XA3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XA1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XA1)) o un compuesto de una fórmula (XA2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XA1)) con un agente de azidación.



[en la que

- 5 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{11}, X$ y Q son los mismos como se han definido anteriormente; R^{101} representa p^{11}, p^{12} o p^{13} ; R^{91} representa un grupo alquilo C1-C12; Z^{101} representa un átomo de cloro o un átomo de bromo; y un punto representa un sitio de unión]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 10 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

- 20 Ejemplos del agente de azidación a usarse en la reacción incluyen azidas inorgánicas, tales como azida de sodio, azida de bario y azida de litio; y azidas orgánicas, tales como azida de trimetilsililo y azida de difenilfosforilo.

En la reacción, el agente de azidación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XA1) o del Compuesto (XA2).

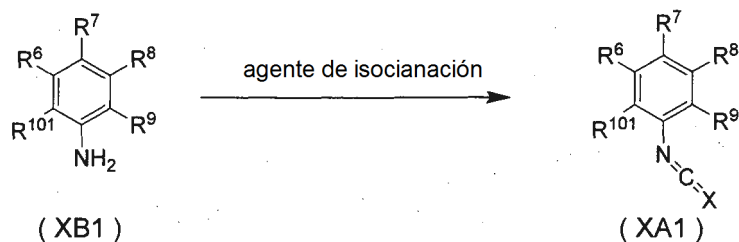
- 25 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 30 Si fuese necesario, puede añadirse a la reacción un ácido de Lewis, tal como cloruro de aluminio y cloruro de cinc, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XA1) o del Compuesto (XA2).

- 35 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XA3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XA3), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia B)

- 40 Puede prepararse el Compuesto (XA1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XB1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XB1)) con un agente de isocianación.



[en la que
 R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰¹ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

5

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

10

Ejemplos del agente de isocianación a usarse en la reacción incluyen fosgeno, difosgeno, trifosgeno, tiosfosgenos, N,N-carbodiimidazol y N,N-tiocarbodiimidazol.

15

En la reacción, el agente de isocianación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XB1).

20

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicicloundeceno y diazabiciclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, pueden añadirse a la reacción bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XB1).

25

30

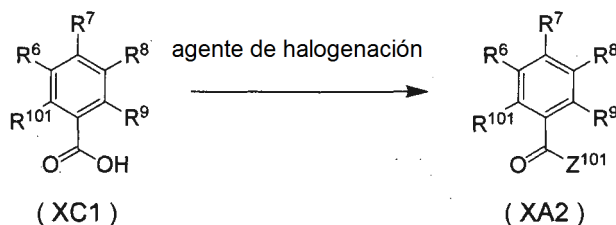
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XA1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XA1), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

35

(Proceso de Referencia C)

Puede prepararse el Compuesto (XA2) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XC1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XC1)) con un agente de halogenación.

40



[en la que
 R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰¹ y Z¹⁰¹ son los mismos como se han definido anteriormente]

45

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter,

anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano y clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

5 Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen oxiclورو de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, cloruro de tionilo, oxibromuro de fósforo, tribromuro de fósforo, pentabromuro de fósforo, trioduro de fósforo, dicloruro de oxalilo, dibromuro de oxalilo, trifosgeno, difosgeno, fosgeno y cloruro de sulfurilo.

10 En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XC1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

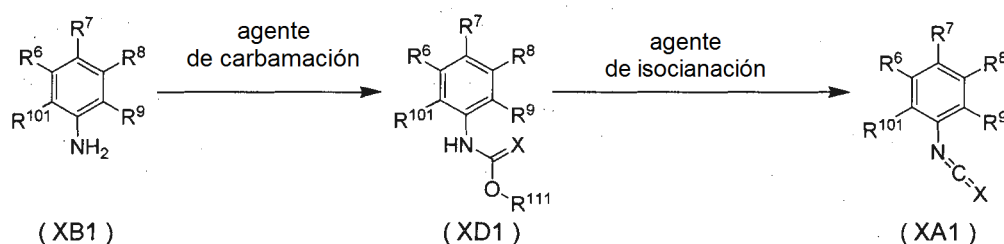
15 Puede añadirse un catalizador a la reacción, que incluye, por ejemplo, N,N-dimetilformida. El catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XC1).

20 Si fuese necesario, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, pueden añadirse a la reacción bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XC1).

25 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XA2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XA2), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

30 (Proceso de Referencia D)

35 Puede prepararse el Compuesto (XA1) haciendo reaccionar el Compuesto (XB1) con un agente de carbamación para formar un compuesto de una fórmula (XD1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XD1)), seguido de hacer reaccionar el Compuesto (XD1) resultante con un agente de isocianación.



40 [en la que R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰¹ son los mismos como se han descrito anteriormente; R¹¹¹ representa un grupo alquilo C1-C12 o un grupo fenilo]

45 En lo sucesivo en el presente documento, se explica el proceso para la preparación del Compuesto (XD1) a partir del Compuesto (XB1).

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

50 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

55 Ejemplos del agente de carbamación a usarse en la reacción incluyen clorocarbonato de fenilo, clorocarbonato de

metilo, clorocarbonato de etilo, clorocarbonato de propilo, clorocarbonato de isopropilo, clorocarbonato de butilo, clorocarbonato de *terc*-butilo, dicarbonato de di-*terc*-butilo, dicarbonato de dimetilo, dicarbonato de dietilo, clorotioformiato de fenilo, clorotioformiato de metilo y clorotioformiato de etilo.

- 5 En la reacción, el agente de carbamación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XB1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 10 Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XB1).

- 20 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XD1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XD1), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

- 25 En lo sucesivo en el presente documento, se explica el proceso para la preparación del Compuesto (XA1) a partir del Compuesto (XD1).

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 30 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, dioxano, etilenglicol dimetil éter, metil *terc*-butil éter; hidrocarburos, tales como tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, 1,2-dicloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; y disolventes mezclas de los mismos.

- 35 Ejemplos del agente de isocianación a usarse en la reacción incluyen pentacloruro de fósforo, oxiclورو de fósforo, pentóxido de difósforo, triclorosilano, diclorosilano, monoclorosilano, tricloruro de boro, 2-cloro-1,3,2-benzodioxaborol, diyodosilano, triclorosilano de metilo, diclorosilano de dimetilo y clorotrimetilsilano.

- 40 En la reacción, el agente de isocianación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XD1).

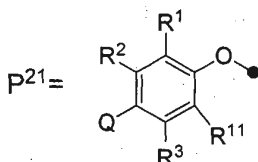
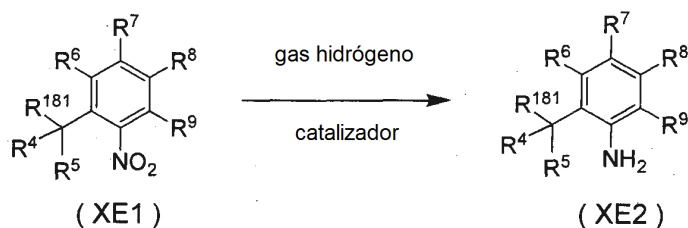
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 250 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 45 Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares y estas bases se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,05 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XD1).

- 50 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XA1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XA1), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia E)

- 60 Un compuesto de una fórmula formula (XE2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XE2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XE1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XE1)) con gas hidrógeno en presencia de un catalizador.



5 [en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹¹ y Q son los mismos como se han descrito anteriormente; R¹⁸¹ representa un átomo de hidrógeno o P²¹; y un punto representa un sitio de unión]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

10 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de butilo; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; ácido acético; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

15 Ejemplos del catalizador a usarse en la reacción incluye paladio sobre carbono (Pd/C), platino sobre carbono (Pt/C), osmio sobre carbono (Os/C), rutenio sobre carbono (Ru/C), rodio sobre carbono (Rh/C) y níquel Raney.

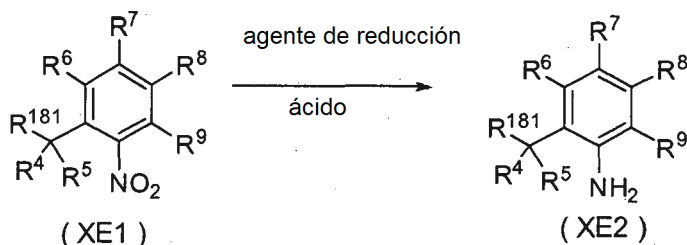
20 En la reacción, el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 1 relaciones molares, y normalmente se usa gas hidrógeno en una cantidad en exceso, frente a 1 mol del Compuesto (XE1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Cuando la reacción se completa, el catalizador se retira por filtración, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, concentración) para aislar el Compuesto (XE2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XE2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia F)

30 Puede prepararse el Compuesto (XE2) haciendo reaccionar el Compuesto (XE1) anteriormente mencionado con un agente reductor en presencia de un ácido.



35 [en la que R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁸¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

40 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen ácidos carboxílicos alifáticos, tales como ácido acético; alcoholes, tales como metanol, etanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de reducción a usarse en la reacción incluyen hierro; compuestos de estaño, tales como estaño; y compuestos de cinc, tales como cinc.

5 Ejemplos del ácido a usarse en la reacción incluyen ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido acético, solución acuosa de cloruro de amonio.

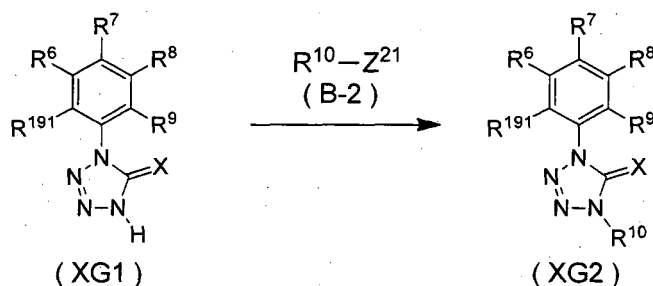
En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 30 relaciones molares, y el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XE1).

10 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

15 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XE2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XE2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia G)

20 Un compuesto de una fórmula (XG2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XG2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XG1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XG1)) y Compuesto (B-2) en presencia de una base.



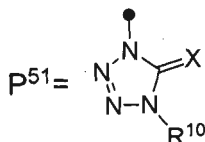
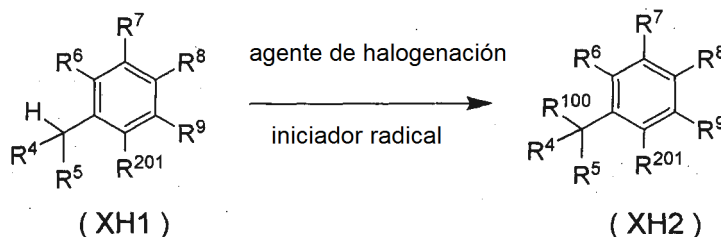
25

[en la que R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, X y Z²¹ son los mismos como se han descrito anteriormente; y R¹⁹¹ representa P¹² o P¹³]

30 La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el proceso B mencionado anteriormente.

(Proceso de Referencia H)

35 Un compuesto de una fórmula (XH2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XH2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XH1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XH1)) con un agente de halogenación en presencia de un iniciador radical.



[en la que

R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹⁰⁰ y X son los mismos como se han descrito anteriormente; y R²⁰¹ representa P⁵¹ o un grupo nitro]

5 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, fluorobenceno, difluorobenceno, trifluorobenceno, clorobenceno, diclorobenceno, triclorobenceno, α,α,α -trifluorotolueno, α,α,α -triclorotolueno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

15 Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen un agente de cloración, un agente de bromación o un agente de yodación, tal como cloro, bromo, yodo, cloruro de sulfurilo, N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, 1,3-dibromo-5,5-dimetilhidantoina, yodosuccinimida, hipoclorito de *tert*-butilo, N-cloroglutarimida, N-bromoglutarimida, N-cloro-N-ciclohexil-bencenosulfonamida y N-bromoftalimida.

20 Ejemplos del iniciador radical a usarse en la reacción incluyen peróxido de benzoilo, azobisisobutironitrilo (AIBN), 1,1-azobis(cianociclohexano)isobutironitrilo, diacilperóxido, peroxidicarbonato de dialquilo, *tert*-alquil peroxiéster, monoperóxido carbonato, di(*tert*-alquilperoxi)cetal, peróxido de cetona y trietilborano.

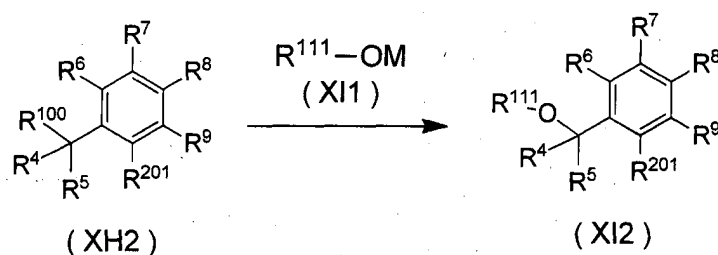
25 En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y el iniciador radical se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,01 a 5 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XH1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XH2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XH2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

35 (Proceso de Referencia I)

40 Un compuesto de una fórmula (XI2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XI2)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (XH2) con un compuesto de una fórmula (XI1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XI1)).



[en la que

45 R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰⁰, R²⁰¹ y R¹¹¹ son los mismos como se han descrito anteriormente; y M representa sodio, potasio o litio]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

50 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del Compuesto (XI1) incluyen metóxido de sodio, etóxido de sodio, propóxido de sodio, butóxido de sodio,

isopropóxido de sodio, *sec*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, metóxido de sodio, etóxido de sodio, propóxido de potasio, butóxido de potasio, isopropóxido de potasio, *sec*-butóxido de potasio, *terc*-butóxido de potasio y fenóxido de sodio.

5 En la reacción, el Compuesto (X11) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XH2).

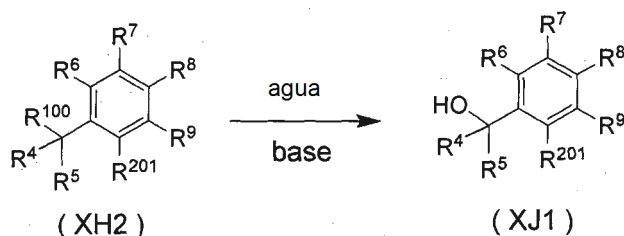
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

10 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (X12). Además puede purificarse el Compuesto aislado (X12), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

15 (Proceso de Referencia J)

Un compuesto de una fórmula (XJ1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XJ1)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (XH2) y agua en presencia de una base.

20



[en la que

R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰⁰ y R²⁰¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

25

Esta reacción se lleva a cabo normalmente en agua o un disolvente que contiene agua.

Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; y disolventes mezclas de los mismos.

35

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; sales de ácido orgánico metálico, tales como formiato de litio, acetato de litio, formiato de sodio, acetato de sodio, formiato de potasio, acetato de potasio; nitratos de metal, tales como nitrato de plata, nitrato de sodio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

45 En la reacción, la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XH2).

En la reacción, se usa normalmente agua dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XH2).

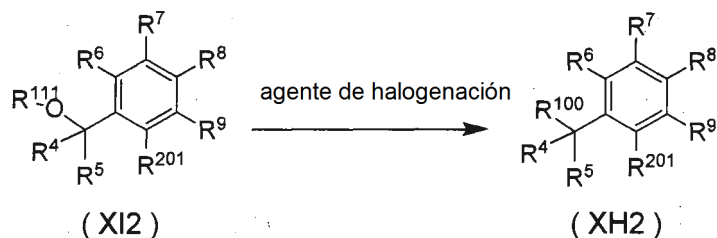
50

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

55 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XJ1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XJ1), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia K)

Puede prepararse el Compuesto (XH2) haciendo reaccionar el Compuesto (XI2) y un agente de halogenación.



5

[en la que

$R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{100}, R^{111}$ y R^{201} son los mismos como se han descrito anteriormente]

10 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

15

20 Ejemplos del agente de halogenación incluyen ácido clorhídrico, ácido bromhídrico y ácido yodhídrico.

En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente en 1 o más relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XI2).

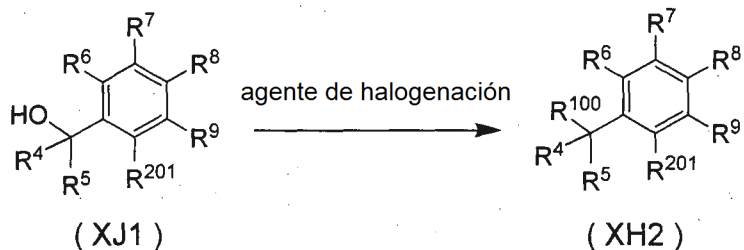
25 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XH2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XH2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

30

(Proceso de Referencia L)

35 Puede prepararse el Compuesto (XH2) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XJ1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XJ1)) y un agente de halogenación.



40 [en la que

$R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{100}$ y R^{201} son los mismos como se han descrito anteriormente]

45

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente. Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; ácidos orgánicos, tales como ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen bromo, cloro, cloruro de sulfurilo, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido yodhídrico, tribromuro de boro, tribromuro de fósforo, cloruro de trimetilsililo, bromuro de trimetilsililo, yoduro de trimetilsililo, cloruro de tionilo, bromuro de tionilo, oxiclóruo de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, cloruro de tionilo, oxibromuro de fósforo, pentabromuro de fósforo, triyoduro de fósforo, dicloruro de oxalilo, dibromuro de oxalilo, cloruro de acetilo, tetrabromuro de carbono, N-bromosuccinimida, cloruro de litio, yoduro de sodio y bromuro de acetilo.

En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XJ1).

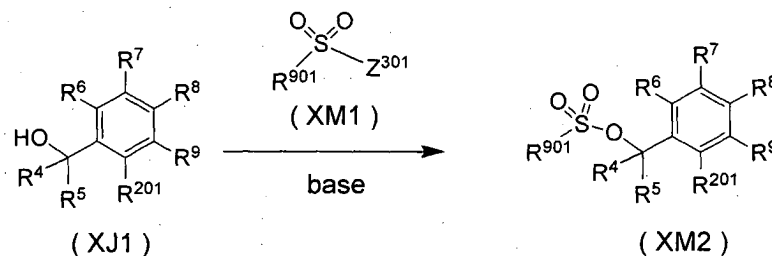
Para promover la reacción, puede añadirse un agente aditivo dependiendo del agente de halogenación usado, e incluye específicamente cloruro de cinc para cloruro de acetilo; trifenilfosfina para tetrabromuro de carbono; sulfuro de dimetilo para N-bromosuccinimida; complejo trifluoruro de boro dietileterato para yoduro de sodio; complejo trifluoruro de boro dietileterato para bromuro de acetilo; trietilamina y cloruro de metanosulfonilo para cloruro de litio; cloruro de aluminio para yoduro de sodio; y cloruro de trimetilsililo para yoduro de sodio. La cantidad del agente aditivo se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,01 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XJ1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XH2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XH2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de referencia M)

Un compuesto de una fórmula (XM2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XM2)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (XJ1) con un compuesto de una fórmula (XM1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XM1)) en presencia de una base.



[en la que R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{201} son los mismos como se han descrito anteriormente; R^{901} representa un grupo p-metilfenilo, un grupo metilo o un grupo trifluorometilo; Z^{301} representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo metanosulfonilo o un grupo trifluorometanosulfonilo]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

En la reacción, El Compuesto (XM1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 5 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XJ1).

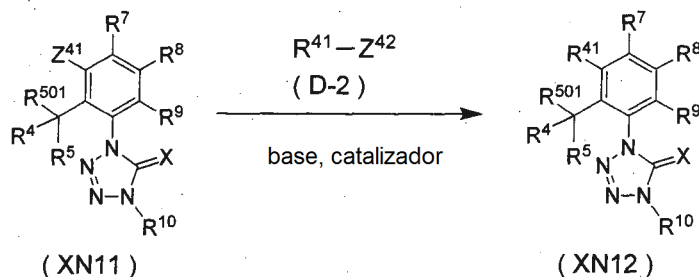
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, puede añadirse un agente aditivo a la reacción, y específicamente, incluye yoduro de sodio y yoduro de tetrabutilamonio y similares. Estos agentes aditivos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XJ1).

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XM2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XM2), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia N)

Un compuesto de una fórmula (XN12) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN12)) puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula (XN11) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN11)) con el Compuesto (D-2) en presencia de una base y un catalizador.

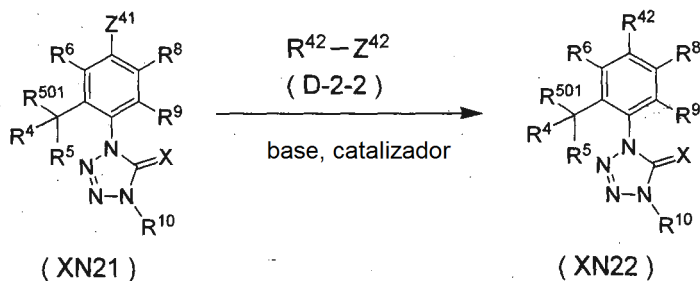


[en la que

R⁵⁰¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo OR¹¹¹; R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R⁴¹, X, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

Un compuesto de una fórmula (XN22) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN22)) puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula (XN21) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN21)) con el Compuesto (D-2-2) en presencia de una base y un catalizador.

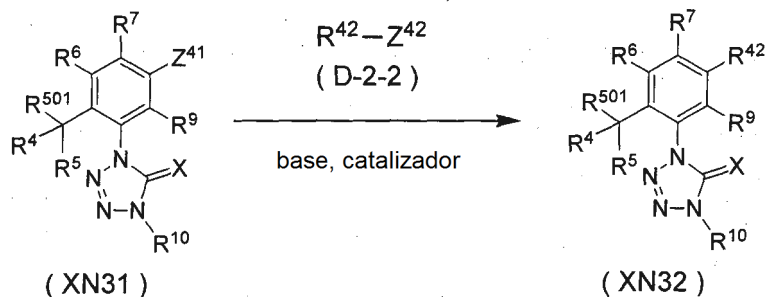


[en la que

R⁴, R⁵, R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R⁴², R⁵⁰¹, X, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

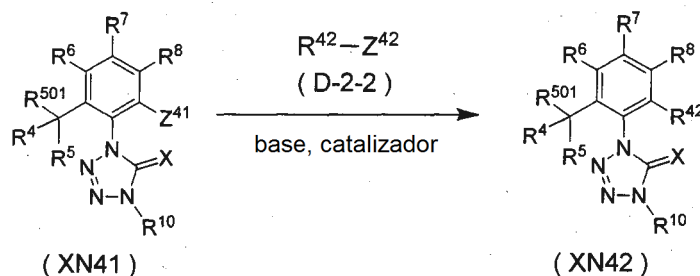
Un compuesto de una fórmula (XN32) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN32)) puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula (XN31) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN31)) con el Compuesto (D-2-2) en presencia de una base y un catalizador.



[en la que
 5 $\text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{42}, \text{R}^{501}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

10 Un compuesto de una fórmula (XN42) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN42)) puede prepararse mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula (XN41) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XN41)) con el Compuesto (D-2-2) en presencia de una base y un catalizador.

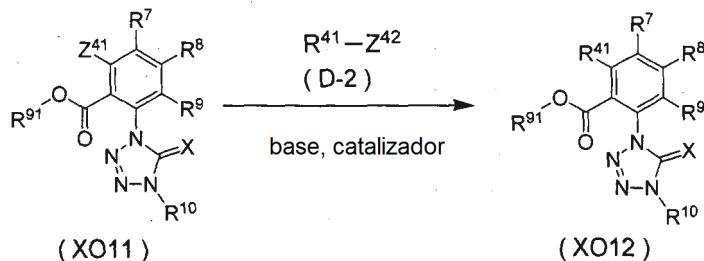


15 [en la que
 $\text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{42}, \text{R}^{501}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

20 (Proceso de referencia O)

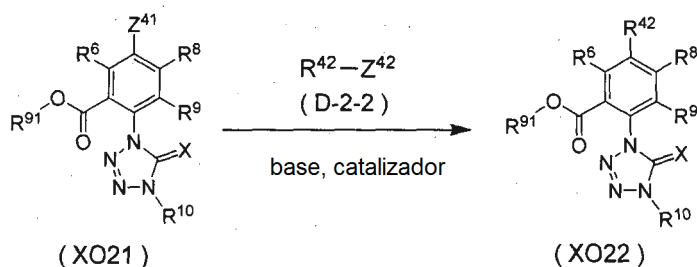
25 Un compuesto de una fórmula (XO12) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO12)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XO11) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO11)) con el Compuesto (D-2) en presencia de una base y un catalizador.



[en la que
 30 $\text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{41}, \text{R}^{91}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

35 Un compuesto de una fórmula (XO22) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO22)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XO21) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO21)) con el Compuesto (D-2-2) en presencia de una base y un catalizador.



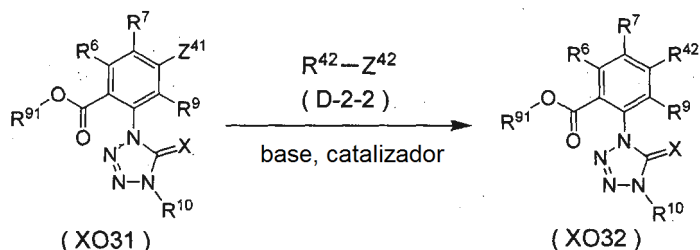
[en la que R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R⁴², R⁹¹, X, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han descrito anteriormente]

5

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

Un compuesto de una fórmula (XO32) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO32)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XO31) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO31)) con el Compuesto (D-2-2) en presencia de una base y un catalizador.

10



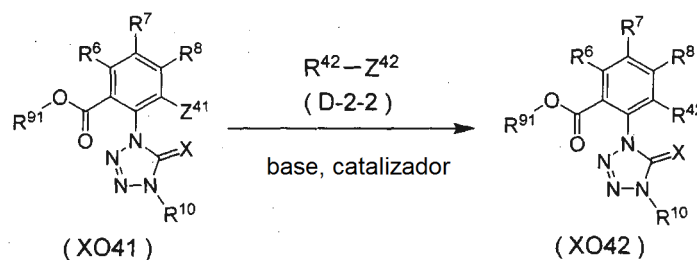
15

[en la que R⁶, R⁷, R⁹, R¹⁰, R⁴², R⁹¹, X, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

Un compuesto de una fórmula (XO42) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO42)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XO41) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XO41)) con el Compuesto (D-2-2) en presencia de una base y un catalizador.

20



25

[en la que R⁶, R⁷, R⁸, R¹⁰, R⁴², R⁹¹, X, Z⁴¹ y Z⁴² son los mismos como se han descrito anteriormente]

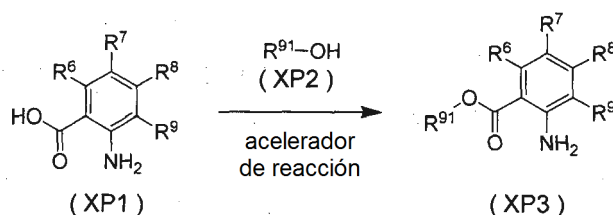
La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D mencionado anteriormente.

30

(Proceso de referencia P)

Un compuesto de una fórmula (XP3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XP3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XP1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XP1)) con un compuesto de una fórmula (XP2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XP2)) en presencia de un acelerador de reacción.

35



[en la que
 5 R^6 , R^7 , R^8 y R^{91} son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos, y puede usarse el Compuesto (XP2) como disolvente.

Ejemplos del Compuesto (XP2) a usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, sec-butanol, t-butanol y pentanol.

Ejemplos del acelerador de reacción a usarse incluyen ácidos minerales, tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico; carbodiimidas, tales como dicitclohexilcarbodiimida, diisopropilcarbodiimida, N'-(3-dimetilaminopropil)-N-etilcarbodiimida; ácidos orgánicos, tales como ácido metanosulfónico, ácido toluenosulfónico; Los reactivos de Mitsunobu, tales como trifenilfosfina/azodicarboxilato de dietilo; cloruro de tionilo; complejo trifluoruro de boro-éter etílico. En la reacción, el acelerador de reacción se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,01 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonatos de cesio y similares y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

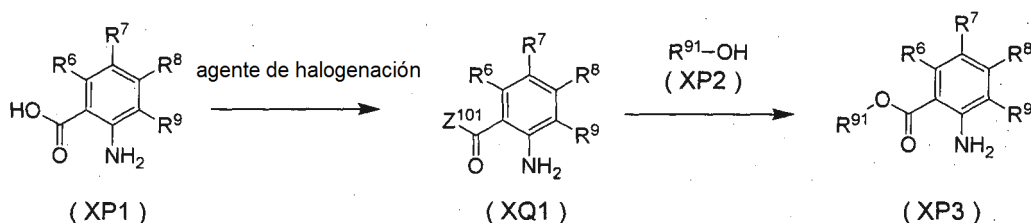
En la reacción, el Compuesto (XP2) se usa normalmente en un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 100 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XP3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XP3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia Q)

Puede prepararse el Compuesto (XP3) haciendo reaccionar el Compuesto (XP1) con un agente de halogenación para formar un de una fórmula (XQ1) mencionado a continuación (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XQ1)), seguido de hacer reaccionar el Compuesto (XQ1) resultante con el Compuesto (XP2).



[en la que

R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R⁹¹ y Z¹⁰¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

5 El proceso para la preparación del Compuesto (XQ1) haciendo reaccionar el Compuesto (XP1) y un agente de halogenación puede realizarse de acuerdo con el Proceso de Referencia C.

En lo sucesivo en el presente documento, se explica un proceso para preparar el Compuesto (XP3) a partir del Compuesto (XQ1).

10 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos, y puede usarse el Compuesto (XP2) como disolvente.

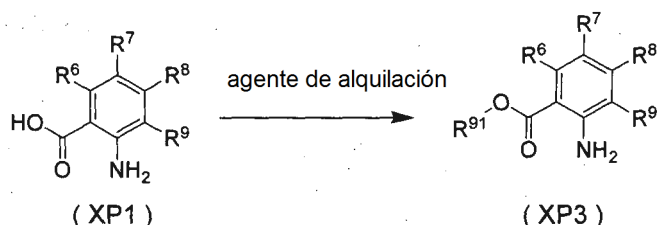
20 Ejemplos del Compuesto (XP2) a usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, sec-butanol, t-butanol y pentanol. En la reacción, el Compuesto (XP2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 50 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XQ1).

25 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 100 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XP3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XP3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia R)

35 Puede prepararse el Compuesto (XP3) haciendo reaccionar el Compuesto (XP1) con un agente de alquilación.



[en la que

40 R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R⁹¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

45 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

55 Ejemplos del agente de alquilación a usarse en la reacción incluyen compuestos diazo, tales como diazometano, trimetilsilildiazometano; alquilos halogenados, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, bromuro de propilo, bromuro de arilo, bromuro de ciclopropilo, bromuro de bencilo, 1,1-difluoro-2-yodometano; sulfatos de dialquilo, tales como sulfatos de dimetilo, sulfatos de dietilo, sulfatos de di-propilo; y sulfonatos de alquilo o arilo, tales como p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo, metanosulfonato de etilo, metanosulfonato de propilo.

En la reacción, el agente de alquilación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

5 Si fuese necesario, puede añadirse un agente aditivo a la reacción, y específicamente, incluye bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonato cesio; y sales de amonio cuaternario, tales como hidróxido de tetra(butil)amonio. Este agente aditivo, se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

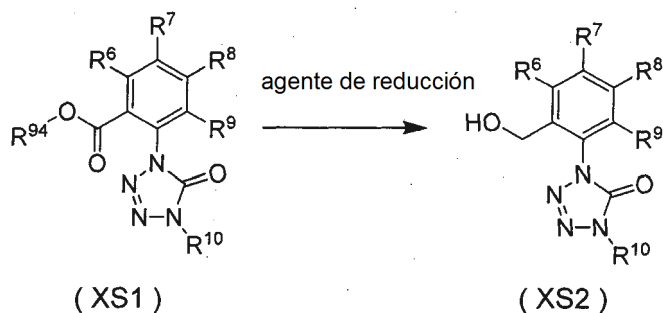
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 100 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

15 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XP3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XP3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

20 (Proceso de referencia S)

Un compuesto de una fórmula (XS2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XS2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XS1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XS1)) con un agente reductor.

25



[en la que

30 R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son los mismos como se han descrito anteriormente; R⁹⁴ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

35 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

40 Ejemplos del agente de reducción a usarse en la reacción incluyen trietilborohidruro de litio, hidruro de diisobutilaluminio, aminoborohidruro de litio, borohidruro de litio, borohidruro de sodio, borano, complejo borano-sulfuro de dimetilo y complejo borano-tetrahidrofurano.

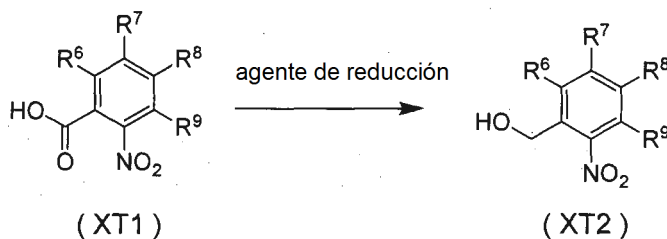
45 En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XS1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 100 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

50 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XS2). Además, el Compuesto (XS2) puede purificarse, por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia T)

Un compuesto de una fórmula (XT2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XT2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XT1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XT1)) con un agente reductor.



[en la que
10 R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano,
15 pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de reducción a usarse en la reacción incluyen, borano, complejo borano-tetrahidrofurano, complejo borano-sulfuro de dimetilo. Además, borohidruros, tales como borohidruro de sodio y borohidruro de potasio se mezclan con ácidos, tales como ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, ácido metanosulfónico y complejo trifluoruro de boro dietiliterato para desarrollar un borano, que también puede usarse.

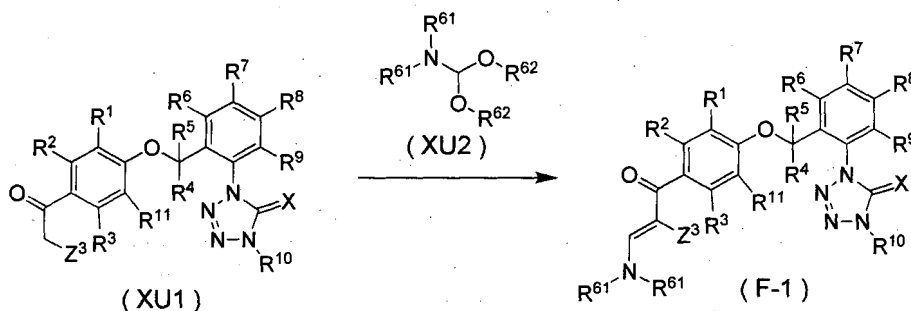
En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XT1).

30 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 100 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XT2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XT2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia U)

40 Puede prepararse el Compuesto (F-1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XU1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XU1)) con un compuesto de una fórmula (XU2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XU2)).



45 [en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁶¹, X y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente; R⁶² representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo butilo o un grupo bencilo]
Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 5 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

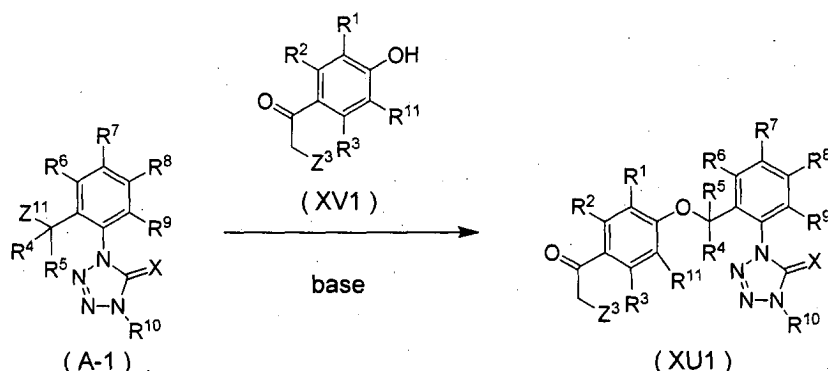
15 En la reacción, el Compuesto (XU2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

20 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (F-1). Como alternativa, las mezclas de reacciones se someten a tratamiento (por ejemplo, concentración) para aislar el Compuesto (F-1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (F-1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

25 (Proceso de Referencia V)

Puede prepararse el Compuesto (XU1) haciendo reaccionar el Compuesto (A-1) con un compuesto de una fórmula (XV1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XV1)) en presencia de una base.



30

[en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, Z³ y Z¹¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

35 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

40 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

45 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabiciclundeceno, diazabiciclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, fluoruro de sodio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio;

50

y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

En la reacción, El Compuesto (XV1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (A-1).

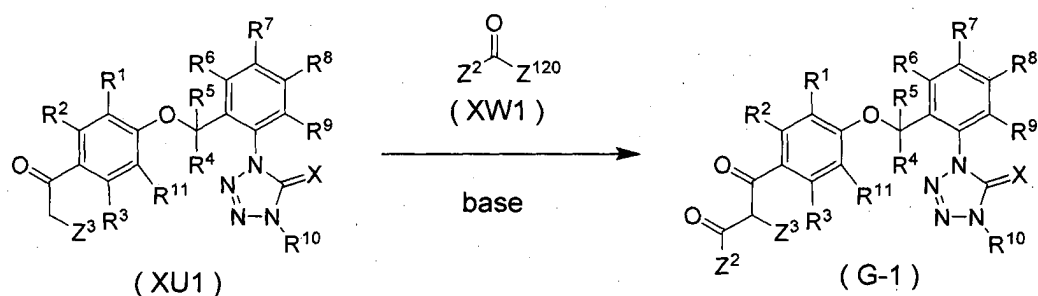
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción yoduro de sodio, yoduro de tetrabutilamonio y similares, y estos compuestos se usan normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (A-1).

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XU1). Como alternativa, las mezclas de reacciones se someten a tratamiento (por ejemplo, concentración) para aislar el Compuesto (XU1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XU1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia W)

Puede prepararse el Compuesto (G-1) haciendo reaccionar el Compuesto (XU1) con un compuesto de una fórmula (XW1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XW1)) en presencia de una base.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, X, Z² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente; y Z¹²⁰ representa un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo acetiloxi o un grupo fenoxi]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente. Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

En la reacción, El Compuesto (XW1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, puede añadirse a la reacción un agente aditivo, e incluye específicamente, por ejemplo, 18-

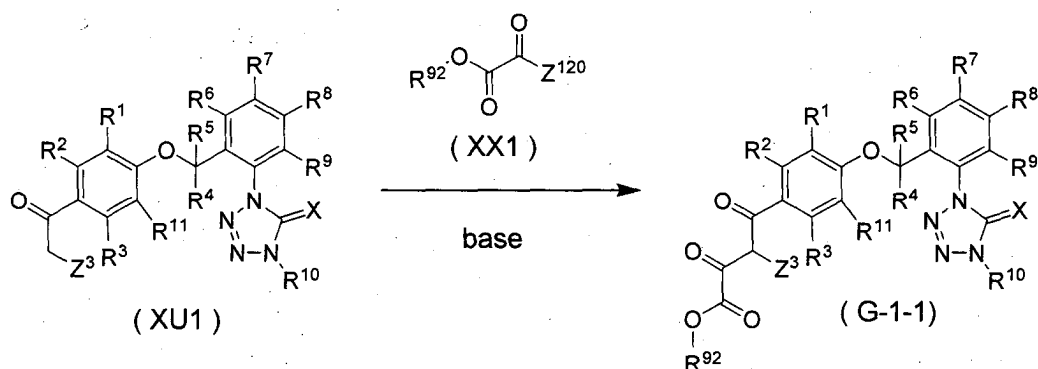
corona-6, dibenzo-18-corona-6 y similares. Este agente aditivo se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

5 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (G-1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (G-1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia X)

10

Puede prepararse el Compuesto (G-1-1) haciendo reaccionar el Compuesto (XU1) con un compuesto de una fórmula (XX1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XX1)) en presencia de una base.



15

[en la que
R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁹², X, Z³ y Z¹²⁰ son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

20

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25

30

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

35

40

En la reacción, El Compuesto (XX1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

45

Si fuese necesario, puede añadirse a la reacción un agente aditivo, e incluye específicamente, por ejemplo, 18-corona-6, dibenzo-18-corona-6 y similares. Este agente aditivo se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

50

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (G-1-1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (G-1-1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia Y)

Puede prepararse el Compuesto (1-5-W) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (1-5-Y) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-5-Y)) con un agente de halogenación.

5



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹⁰⁰, X, Z¹ y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

10

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con la Síntesis I.

(Proceso de Referencia Z)

15 Puede prepararse el Compuesto (1-5-Y) haciendo reaccionar un Compuesto (1-5-S) con un agente hidrolítico.



[en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁹², X, Z¹ y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

20

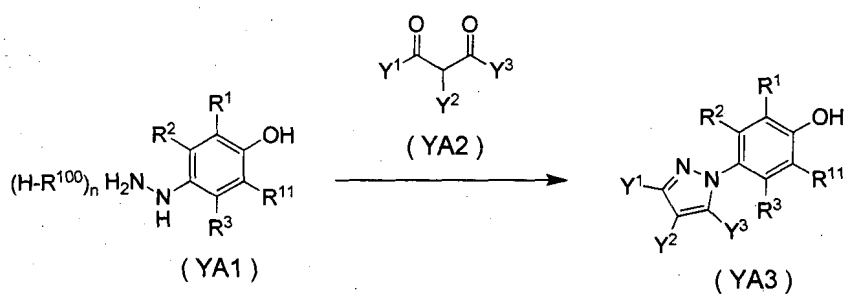
La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con la Síntesis H.

(Proceso de Referencia AA)

25

Un compuesto de una fórmula (YA3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YA3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YA1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YA1)) con un compuesto de una fórmula (YA2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YA2)).

30



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{100}, Y, Y^2$ e Y^3 son los mismos como se han descrito anteriormente; y n representa 0 o 1]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 5 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

10 En la reacción, el Compuesto (YA2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YA1).

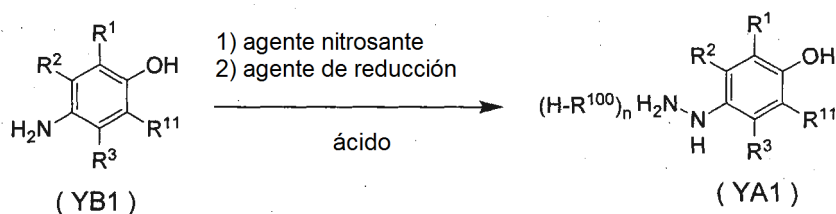
15 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

20 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YA3). Como alternativa, las mezclas de reacciones se someten a tratamiento (por ejemplo, concentración) para aislar el Compuesto (YA3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (YA3), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

25 (Proceso de Referencia AB)

Puede prepararse el Compuesto (YA1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YB1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YB1)) con un agente de nitrosación, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con un agente reductor.

30



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{100}$ y n son los mismos como se han descrito anteriormente]

35

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

40

Ejemplos del agente de nitrosación a usarse en la reacción incluyen nitrito de sodio, nitrito de potasio, nitrito de *tert*-butilo y nitrito de isoamilo.

45 Ejemplos del ácido a usarse en la reacción incluyen ácido acético, ácido clorhídrico y ácido bromhídrico, y estas soluciones acuosas pueden usarse como disolvente.

Ejemplos del agente de reducción a usarse en la reacción incluyen hierro, cinc y estaño, y específicamente, incluyen cloruro de estaño (II).

50 En la reacción, el agente de nitrosación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares y el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a un exceso de relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YB1).

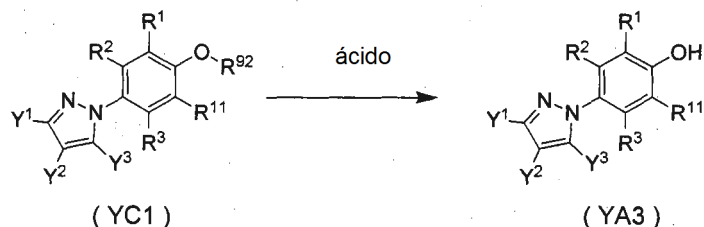
55 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Quando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YA1). Como alternativa, las mezclas de reacciones se someten a tratamiento (por ejemplo,

concentración) para aislar el Compuesto (YA1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (YA1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AC)

- 5 Puede prepararse el Compuesto (YA3) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YC1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YC1)) con un ácido.



- 10 [en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Y^1, Y^2$ e Y^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 15 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; ácido acético; y disolventes mezclas de los mismos.

- 20 Ejemplos del ácido a usarse en la reacción incluyen ácido acético, ácido clorhídrico y ácido bromhídrico, y estas soluciones acuosas pueden usarse como disolvente.

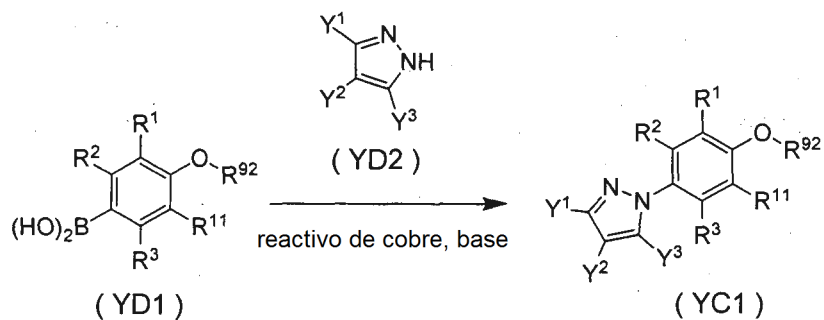
En la reacción, el ácido se usa normalmente en un intervalo de un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YC1).

- 25 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 100 horas.

- 30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YA3). Como alternativa, las mezclas de reacciones se someten a tratamiento (por ejemplo, concentración) para aislar el Compuesto (YA3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (YA3), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AD)

- 35 Puede prepararse el Compuesto (YC1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YD1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YD1)) con un compuesto de una fórmula (YD2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YD2)) en presencia de un reactivo de cobre y una base.



- 40 [en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Y^1, Y^2$ e Y^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

- 45 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

5 Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

10 Ejemplos del reactivo de cobre a usarse en la reacción incluyen acetato de cobre (II).

15 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

20 En la reacción, el Compuesto (YD2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, el reactivo de cobre se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YD1).

25 Si fuese necesario, puede usarse en la reacción un agente de deshidratación, tal como un tamiz molecular, y el agente de deshidratación se usa normalmente dentro de un intervalo de 100 a 500 por ciento en masa frente a 1 mol del Compuesto (YD1).

30 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 120 horas.

35 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YC1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (YC1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AE)

40 Un compuesto de una fórmula (YE2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1)) con un ácido.



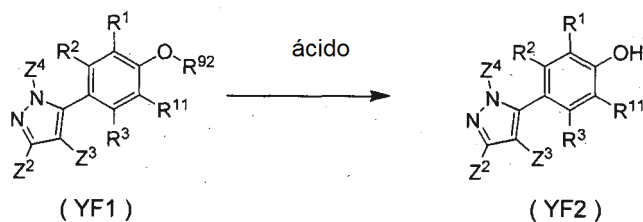
45 [en la que R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z¹, Z² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso de Referencia AC.

50 (Proceso de Referencia AF)

Un compuesto de una fórmula (YF2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YF2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YF1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YF1)) con un ácido.

55



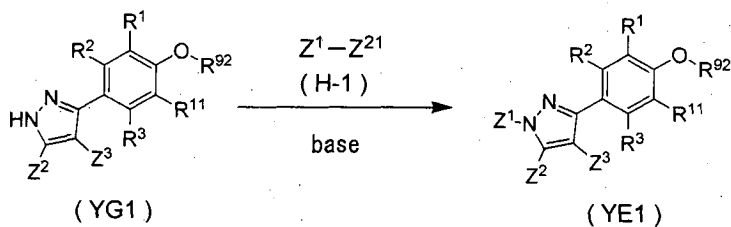
[en la que
R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z², Z³ y Z⁴ son los mismos como se han descrito anteriormente]

5

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso de Referencia AC.

(Proceso de Referencia AG)

- 10 Puede prepararse el Compuesto (YE1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YG1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YG1)) con el Compuesto (H-1) en presencia de una base.

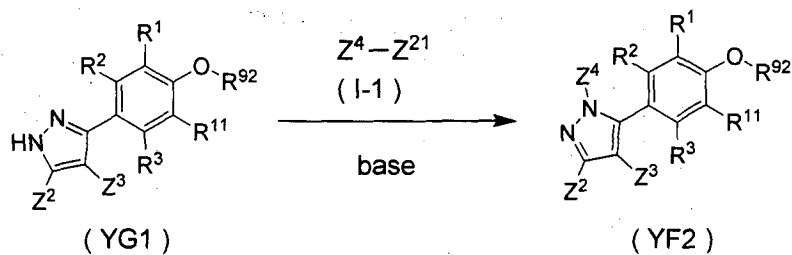


- 15 [en la que
R¹¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z¹, Z², Z³ y Z²¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso H.

- 20 (Proceso de Referencia AH)

Puede prepararse el Compuesto (YF2) haciendo reaccionar el Compuesto (YG1) con el Compuesto (I-1) en presencia de una base.



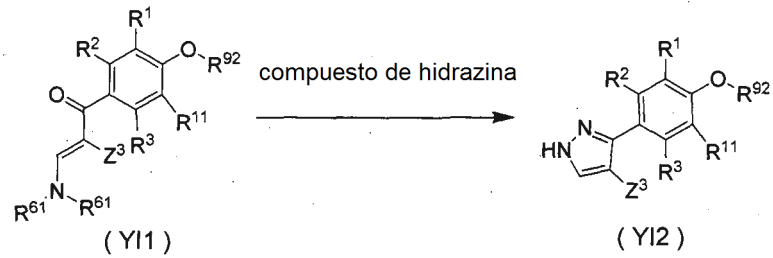
25

[en la que
R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z², Z³, Z⁴ y Z²¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

- 30 La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso I.

(Proceso de Referencia AI)

- 35 Un compuesto de una fórmula (YI2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YI2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YI1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YI1)) con un compuesto de hidrazina.

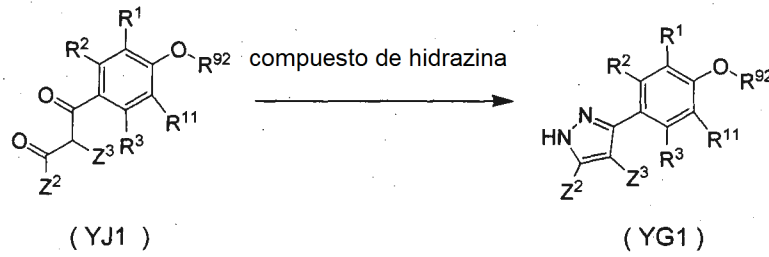


[en la que
 5 R¹, R², R³, R¹¹, R⁶¹, R⁹² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso F.

(Proceso de Referencia AJ)

- 10 Puede prepararse el Compuesto (YG1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YJ1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YJ1)) con un compuesto de hidrazina.

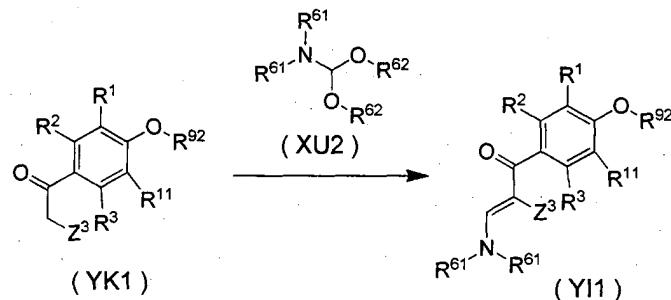


- 15 [en la que
 R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso G.

- 20 (Proceso de Referencia AK)

Puede prepararse el Compuesto (YI1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YK1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YK1)) con el Compuesto (XU2).



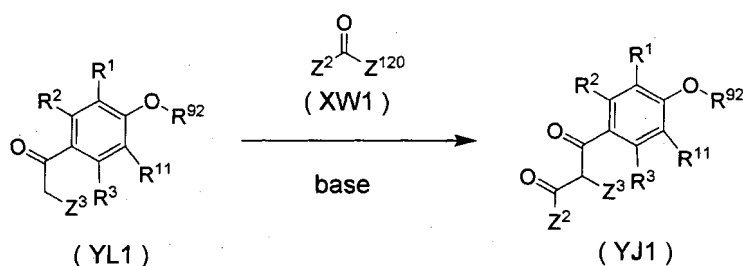
- 25

[en la que
 R¹, R², R³, R¹¹, R⁶¹, R⁶², R⁹² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

- 30 La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso de Referencia U.

(Proceso de Referencia AL)

- 35 Puede prepararse el Compuesto (YJ1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YL1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YL1)) con el Compuesto (XW1) en presencia de una base.



[en la que

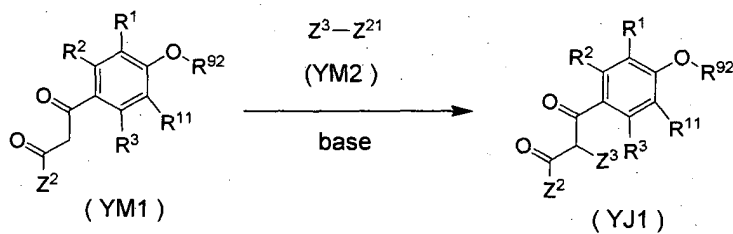
R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z², Z³ y Z¹²⁰ son los mismos como se han descrito anteriormente]

5

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso de Referencia W.

(Proceso de Referencia AM)

- 10 También puede prepararse el Compuesto (YJ1) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YM1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YM1)) con un compuesto de una fórmula (YM2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YM2)) en presencia de una base.



15

[en la que

R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z², Z³ y Z²¹ son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

20

Ejemplos del disolvente a usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25

El Compuesto (YM2) a usarse en la reacción, normalmente puede usarse como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen haluros de alquilo, tales como clorodifluorometano, bromuro de metilo, bromuro de etilo, bromuro de propilo, yoduro de metilo, yoduro de etilo, bromuro de propilo, bromuro de arilo, bromuro de ciclopropilo, 1,1-difluoro-2-yodoetano; sulfatos de alquilo o arilo, tales como sulfato de dimetilo, p-toluenosulfonato de metilo, p-toluenosulfonato de etilo, p-toluenosulfonato de propilo, metanosulfonato de metilo, metanosulfonato de etilo y metanosulfonato de propilo.

35

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

40

- 45 Si fuese necesario, puede añadirse un agente aditivo a la reacción, y específicamente, incluye bromuro de tetrabutilamonio y fluoruro de tetrabutilamonio y similares.

En la reacción, el Compuesto (YM2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, la

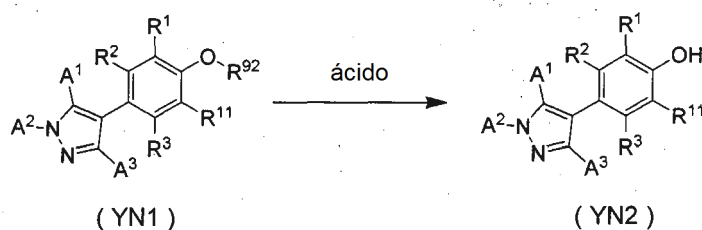
base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y el agente aditivo se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,01 a 1 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YM1).

5 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

10 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YJ1). Además, el presente Compuesto (YJ1) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AN)

15 Un compuesto de una fórmula (YN2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YN2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YN1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YN1)) con un ácido.

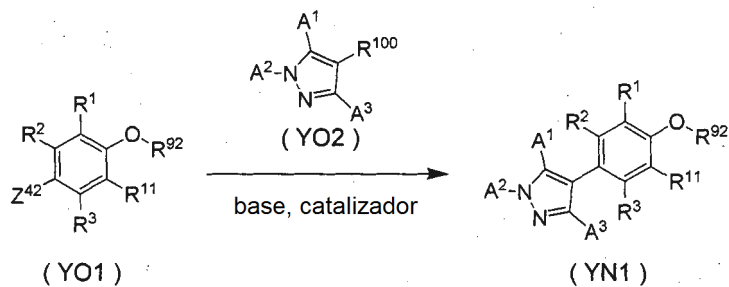


20 [en la que R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², A¹, A² y A³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso de Referencia AC.

25 (Proceso de Referencia AO)

30 Puede prepararse el Compuesto (YN1) mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula (YO1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YO1)) con un compuesto de una fórmula (YO2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YO2)) en presencia de una base y un catalizador.

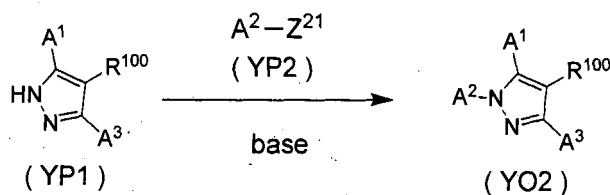


35 [en la que R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², R¹⁰⁰, A¹, A², A³ y Z⁴² son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso D.

(Proceso de Referencia AP)

40 Puede prepararse el Compuesto (YO2) mediante el acoplamiento de un compuesto de una fórmula (YP1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YP1)) con un compuesto de una fórmula (YP2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YP2)) en presencia de una base.



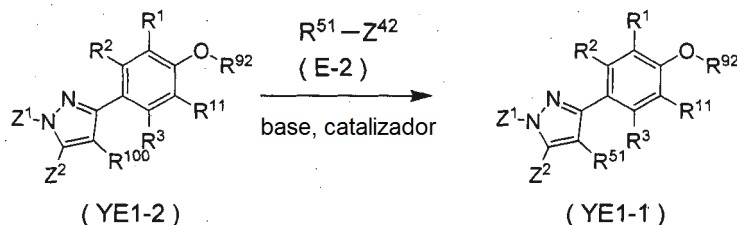
[en la que
 5 R^{100} , A^1 , A^2 , A^3 y Z^{21} son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso H.

(Proceso de Referencia AQ)

10 El Compuesto (YE1) en el que Z^3 representa R^{51} , es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-1)) puede prepararse mediante el acoplamiento en un compuesto de una fórmula (YE1) en la que Z^3 representa R^{100} , es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-2)) con el Compuesto (E-2) en presencia de una base y un catalizador.

15



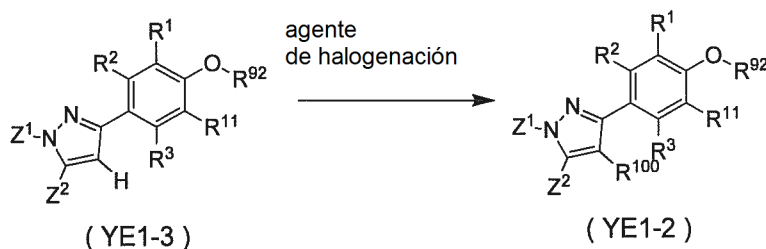
[en la que
 20 R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} , R^{51} , R^{92} , R^{100} , Z^1 , Z^2 y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso L.

(Proceso de Referencia AR)

25 Puede prepararse el Compuesto (YE1-2) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1) en la que Z^3 representa un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-3)) con un agente de halogenación.

30



[en la que
 35 R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} , R^{92} , R^{100} , Z^1 y Z^2 son los mismos como se han descrito anteriormente]

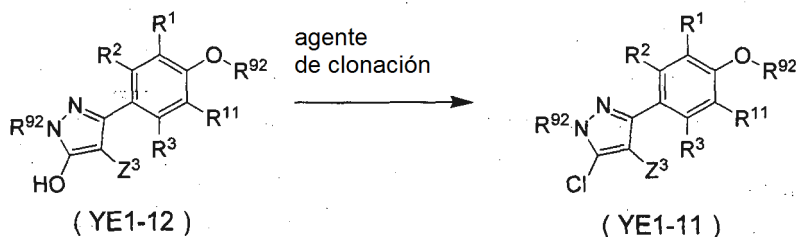
La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso J.

35

(Proceso de Referencia AS)

40 Un compuesto de una fórmula (YE1) en la que Z^1 representa R^{92} y Z^2 representa un átomo de cloro, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-11) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1) en la que Z^1 representa R^{92} y Z^2 representa un grupo hidroxilo, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-12) (en lo sucesivo en el presente

documento, descrito como Compuesto (YE1-12)) con un agente de cloración.



5 [en la que
R¹, R², R³, R¹¹, R⁹² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente o en un sistema libre de disolvente.

10 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

15 El agente de cloración a usarse en la reacción, puede usarse normalmente como un producto disponible en el mercado. Los ejemplos específicos incluyen cloruro de tionilo, oxiclorigenato de fósforo, pentacloruro de fósforo y mezclas de los mismos. Si fuese necesario, puede añadirse una base a la reacción, y específicamente, incluye bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletamina, lutidina, colidina, diazabicicoundeceno y diazabiciclononeno.

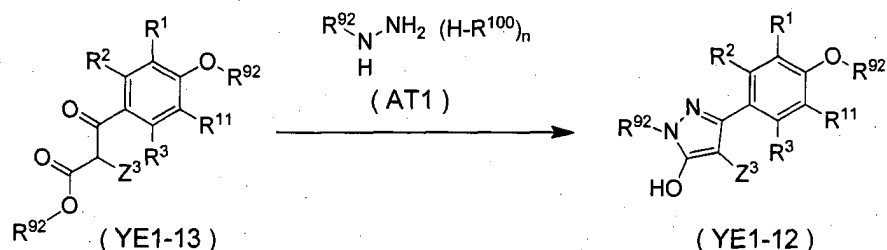
20 En la reacción, el agente de cloración se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YE1-12).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YE1-11). Además, el presente Compuesto (YE1-11) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

35 (Proceso de Referencia AT)

Puede prepararse el Compuesto (YE1-12) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1-13) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-13)) con el Compuesto (AT1).



40 [en la que
R¹, R², R³, R¹¹, R⁹² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente; y n es 0 o 1]

45 Esta reacción se lleva a cabo normalmente en un disolvente o en un sistema libre de disolvente.

Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol

dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos. Si fuese necesario, y puede añadirse un ácido a la reacción, y ejemplos de ácido a usarse en la reacción incluyen ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido acético, ácido bromhídrico y ácido p-toluenosulfónico.

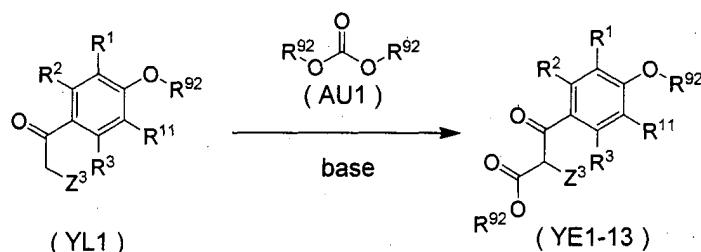
En la reacción, el Compuesto (AT1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares, y el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YE1-13).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado, concentración y filtración) para aislar el Compuesto (YE1-12). Además, el presente Compuesto (YE1-12) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AU)

Puede prepararse el Compuesto (YE1-13) haciendo reaccionar el Compuesto (YL1) con un compuesto de una fórmula (AU1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (AU1)) en presencia de una base.



[en la que R¹, R², R³, R¹¹, R⁹² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

En la reacción, El Compuesto (AU1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YL1).

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

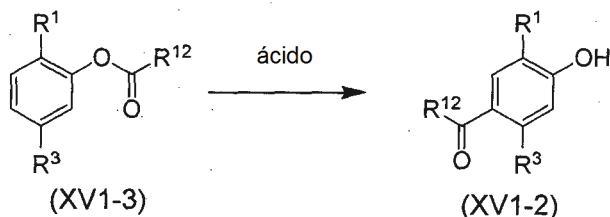
Si fuese necesario, puede añadirse a la reacción un agente aditivo, e incluye específicamente, por ejemplo, 18-corona-6, dibenzo-18-corona-6 y similares. Este agente aditivo se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001

a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XL1).

- 5 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YE1-13). Además, el presente Compuesto (YE1-13) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AV)

- 10 puede prepararse el Compuesto (XV1-2) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XV1-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XVI-3)) en presencia de un ácido.



- 15 [en la que R¹, R³ y R¹² son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 20 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como nitrometano, acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

- 25 Ejemplos del ácido a usarse, en la reacción incluyen tricloruro de aluminio, cloruro de titanio, tricloruro de hierro, fluoruro de hidrógeno, ácido hipocloroso y ácido polifosfórico.

- 30 En la reacción, el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XV1-3).

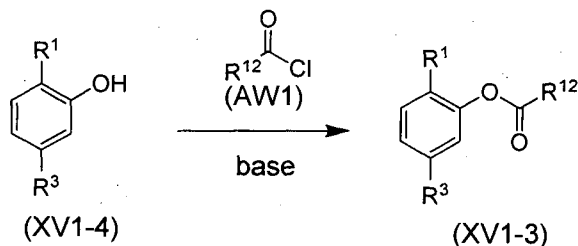
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

- 35 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YV1-2). Además, el presente Compuesto (YV1-2) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

- 40 (Proceso de Referencia AW)

Puede prepararse el Compuesto (XV1-3) haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (XV1-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (XV1-4)) con un compuesto de una fórmula (AW1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (AW1)) en presencia de una base.

- 45



[en la que

R¹, R³ y R¹² son los mismos como se han descrito anteriormente]

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

5 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; nitrilos, tales como nitrometano, acetonitrilo, propionitrilo; y disolventes mezclas de los mismos.

10 Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

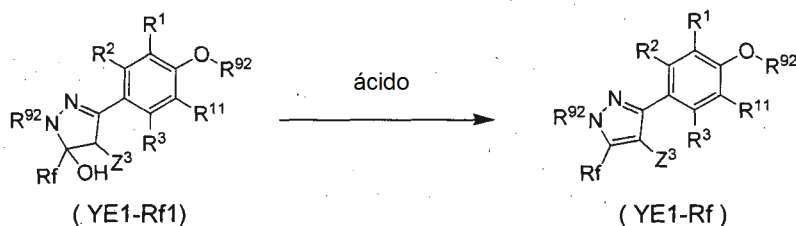
20 En la reacción, El Compuesto (AW1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XV1-4).

25 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

30 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YV1-3). Además, el presente Compuesto (YV1-3) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de referencia AX)

35 El Compuesto (YE1) en el que Z¹ representa R⁹², y Z² representa R_f, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-R_f) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-R_f), puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1-R_f1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-R_f1)) en presencia de un ácido.



40 [en la que R¹, R², R³, R¹¹, R⁹² y Z³ son los mismos como se han descrito anteriormente; y R_f representa un grupo perfluoroalquilo C1-C6, un grupo 1,1-difluoroetil, un grupo 1,1-difluoropropilo o un grupo 2,2-difluoropropilo]

45 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

50 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

55 Ejemplos del ácido a usarse en la reacción incluyen ácido acético, ácido clorhídrico y ácido bromhídrico, y estas soluciones acuosas pueden usarse como disolvente.

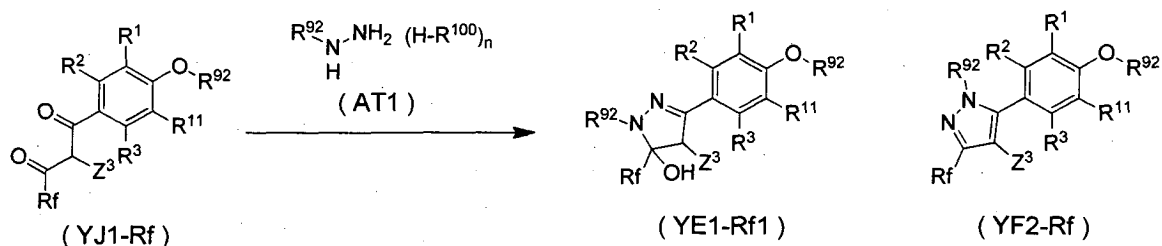
En la reacción, el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YE1-Rf1).

5 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

10 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YE1-Rf). Además, el presente Compuesto (YE1-Rf) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de referencia AZ)

15 El Compuesto (YE1-Rf1) y un compuesto de una fórmula (YF2) en el que Z² representa Rf y Z⁴ representa R⁹², es decir, un compuesto de una fórmula (YF2-Rf) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YF2-Rf)), puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YJ1) en la que Z² representa Rf, es decir, un compuesto de una fórmula (YJ1-Rf) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YJ1-Rf)) con el Compuesto (AT1).



20

[en la que R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z³ y Rf son los mismos como se han descrito anteriormente; y n es 0 o 1]

25 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

30 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

35 En la reacción, el Compuesto (AT1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YJ1-Rf1).

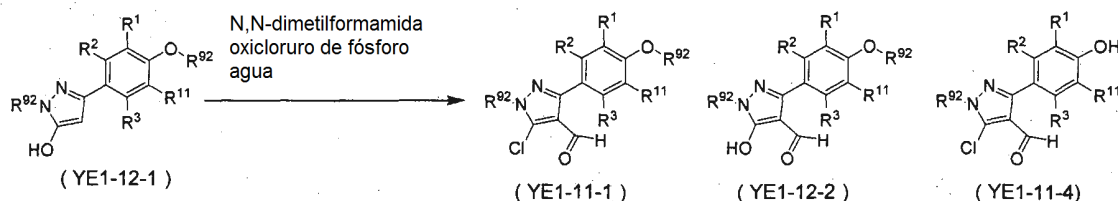
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -78 a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 72 horas.

40 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YE1-Rf1) y el Compuesto (YF2-Rf). Además, el presente Compuesto (YE1-Rf1) aislado y el presente Compuesto (YF2-Rf) aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

45 (Proceso de referencia BA)

50 El Compuesto (YE1-11) en el que Z³ representa un grupo aldehído, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-11-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-1)), un compuesto de una fórmula (YE1-12-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-12-2)), y un compuesto de una fórmula (YE1-11-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-4)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1-12) en la que Z³ representa un átomo de hidrógeno, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-12-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-12-1)) con un agente de formilación, que se prepara a partir de N,N-dimetilformamida y oxicluro de fósforo, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con agua.

55

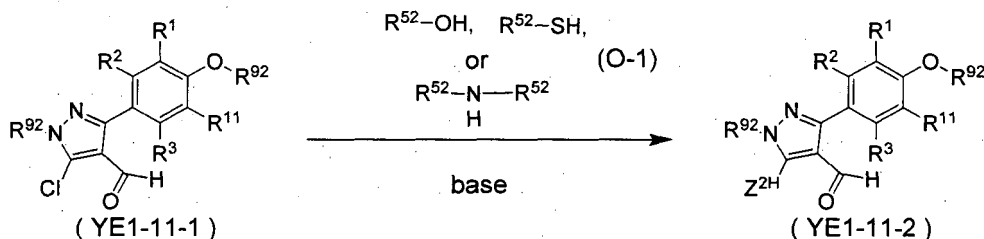


[en la que R^1, R^2, R^3, R^{11} y R^{92} son los mismos como se han definido anteriormente]

5 La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso K.

(Proceso de referencia BB)

10 El Compuesto (YE1) en el que Z^2 representa Z^{2H} y Z^3 representa un grupo aldehído, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-11-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1-11-1) con el Compuesto (O-1) en presencia de una base.

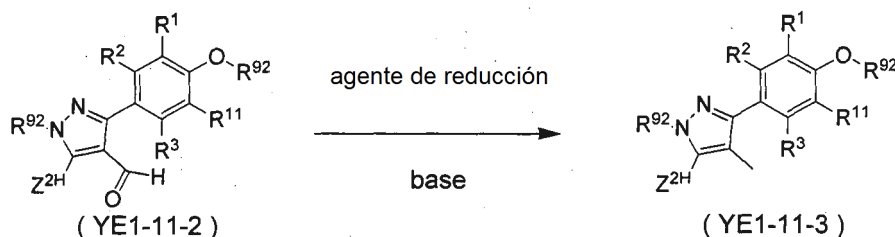


[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{52}, R^{92}$ y Z^{2H} son los mismos como se han definido anteriormente]

20 La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso P.

(Proceso de referencia BC)

25 El Compuesto (YE1) en el que Z^2 representa Z^{2H} y Z^3 representa un grupo metilo, es decir, un compuesto de una fórmula (YE1-11-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1-11-2) con un agente reductor en presencia de una base.

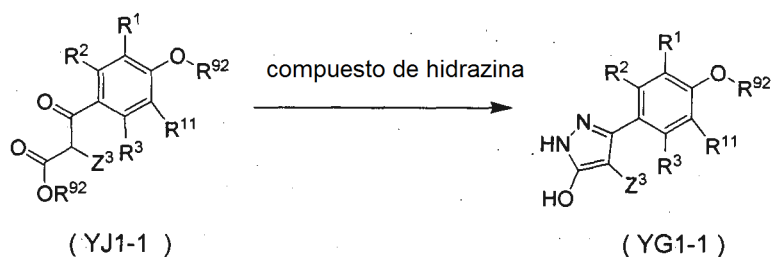


[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}$ y Z^{2H} son los mismos como se han definido anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso Q.

(Proceso de referencia BD)

40 El Compuesto (YG1) en el que Z^2 representa un grupo hidroxilo, es decir, un compuesto de una fórmula (YG1-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YG1-1)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YJ1) en el que Z^2 representa $O-R^{92}$, un compuesto de una fórmula (YJ1-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YJ 1-1)) con un compuesto de hidrazina.



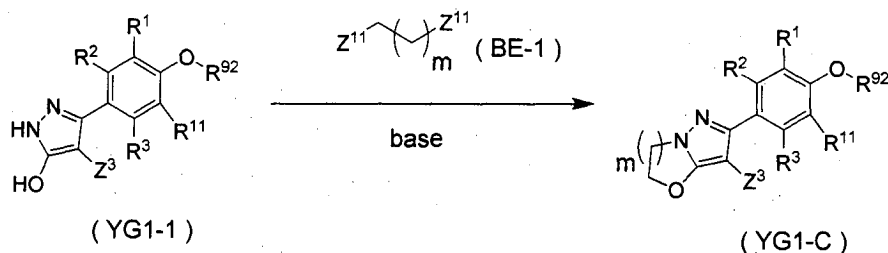
[en la que
 5 R¹, R², R³, R¹¹, R⁹² y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente]

La reacción puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso Q.

(Proceso de referencia BE)

- 10 El Compuesto (YE1) en el que Z¹ y Z² se combinan junto con los átomos de carbono a los que están unidos para formar un anillo que contiene un átomo de oxígeno, es decir, Un compuesto de una fórmula (YG1-C) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YG1-C)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (YG1-1) con un compuesto de una fórmula (BE-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (BE-1)) en presencia de una base.

15



20 R¹, R², R³, R¹¹, R⁹², Z¹¹ y Z³ son los mismos como se han definido anteriormente; m es un número entero de 1 a 3; y puede sustituirse un átomo de hidrógeno del Compuesto (BE-1) con átomos o grupos seleccionados entre el Grupo P¹]

20

Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

- 25 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

30

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

35

40

En la reacción, El Compuesto (BE-1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XG1-1).

45

La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

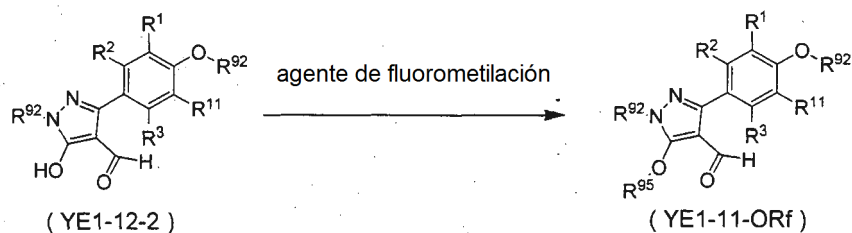
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el

Compuesto (YG1-C). Además, el presente Compuesto (YG1-C) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de referencia BF)

5

Un compuesto de una fórmula (YE1-11-ORf) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-ORf)) puede prepararse haciendo reaccionar el Compuesto (YE1-12-2) con un agente de fluoración en presencia de una base.



10

R¹, R², R³, R¹¹ y R⁹² son los mismos como se han definido anteriormente; y R⁹⁵ representa un grupo trifluorometilo o un grupo difluorometilo]

15 Esta reacción, normalmente se lleva a cabo en un disolvente.

Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen hidrocarburos, tales como heptano, hexano, ciclohexano, pentano, tolueno, xileno; éteres, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, etilenglicol dimetil éter, anisol, metil *tert*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, 1,2-dicloroetano, tetracloroetano, clorobenceno; amidas ácidas, tales como N,N-dimetilformamida, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, N-metilpirrolidona; ésteres, tales como acetato de etilo, acetato de metilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

25 Ejemplos del agente de fluorometilación a usarse en la reacción incluyen cloruro de trifluorometilo, bromuro de trifluorometilo, yoduro de trifluorometilo, difluorometilcloruro, difluorometilbromuro, difluorometilyoduro, 3,3-dimetil-1-(trifluorometil)-1,2-benziodoxol, 5-(trifluorometil)dibenzotiofeno-tetrafluoroborato, 5-(trifluorometil)dibenzotiofeno-trifluorometanosulfonato, 3,3-dimetil-1-(difluorometil)-1,2-benziodoxol, 5-(difluorometil)dibenzotiofeno-tetrafluoroborato, 5-(difluorometil)dibenzotiofeno-trifluorometanosulfonato y dimetilfosfonato de bromodifluorometilo.

30

Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalino, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalino, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalino, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalino, tales como fluoruro de sodio, fluoruro de potasio, fluoruro de cesio; hidruros de metal alcalino, tales como hidruro de litio, hidruro de sodio, hidruro de potasio; y alcóxidos de metal alcalino, tales como *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

40 En la reacción, el agente de fluorometilación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YE1-12-2).

45 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

50 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (YE1-11-ORf). Además, el presente Compuesto (YE1-11-ORf) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

55 Aunque una forma usada para el presente compuesto puede ser el presente compuesto por sí mismo, el presente compuesto se prepara normalmente mezclando el presente compuesto con vehículos sólidos, vehículos líquidos, vehículos gaseosos, tensioactivos y similares, y si fuese necesario, añadiendo espesantes, dispersantes y estabilizadores, para formular en polvos humectables, gránulos dispersables en agua, fluidos, gránulos, fluidos secos, concentrados emulsionables, soluciones acuosas, soluciones oleosas, agentes de humo, aerosoles, microcápsulas y similares. En estas formulaciones, normalmente se contiene el presente compuesto en un intervalo

de 0,1 al 99 %, preferentemente del 0,2 al 90 % en peso.

5 Ejemplos del vehículo sólido incluyen arcillas (por ejemplo, caolína, tierra de diatomeas, dióxido de silicio hidratado sintético, arcilla de Fubasami, bentonita y arcilla ácida), talcos u otros minerales inorgánicos (por ejemplo, sericita, polvo de cuarzo, polvo de azufre, carbón vegetal activado, carbonato de calcio y sílice hidratada) en forma de polvos finos o partículas, y ejemplos de los vehículos líquidos incluyen agua, alcoholes (por ejemplo, metanol y etanol), cetonas (por ejemplo, acetona y metil etil cetona), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, etilbenceno y metil naftaleno), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, hexano, ciclohexano y queroseno), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo y acetato de butilo), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo y isobutironitrilo), éteres (por ejemplo, dioxano y diisopropiléter), amidas ácidas (por ejemplo, N,N-dimetilformamida (DMF) y dimetilacetamida), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, tricloro etileno and tetracloruro de carbono) y similares.

10 Ejemplos de los tensioactivos incluyen sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilo, sulfonatos de alquil arilo, éteres de alquil arilo y compuestos polioxietilenados de los mismos, polietilenglicol éteres, poliol ésteres y derivados del alcohol del azúcar

15 Ejemplos de otros agentes auxiliares para la formulación incluyen espesantes, dispersantes y estabilizadores, específicamente caseína, gelatina, polisacáridos (por ejemplo, almidón, goma arábiga, derivados de celulosa y ácido algínico), derivados de lignina, bentonita, azúcares, polímeros sintéticos solubles en agua (por ejemplo, alcohol polivinílico, polivinil pirrolidona y ácidos poliacrílicos), PAP (isopropil fosfato ácido), BHT (2,6-di-*terc*-butil-4-metilfenol), BHA (a mezcla de 2-*terc*-butil-4-metoxifenol y 3-*terc*-butil-4-metoxifenol), aceites vegetales, aceites minerales, ácidos grasos y ésteres de ácidos grasos de los mismos y similares.

20 El método para aplicar el presente compuesto no está particularmente limitado, en la medida en que la forma de aplicación es una forma mediante la cual el presente compuesto puede aplicarse sustancialmente e incluye, por ejemplo, una aplicación a plantas como una aplicación de follaje; una aplicación al área para cultivar plantas tales como un tratamiento del suelo; y una aplicación a la semilla tal como desinfección de la semilla.

25 La dosis de aplicación varía dependiendo de las condiciones climáticas, formas de dosificación, calendario de aplicación, métodos de aplicación, áreas a aplicarse, enfermedades diana y cultivos diana, etc., pero normalmente está en el intervalo de 1 a 500 g, y preferentemente de 2 a 200 g por 1.000 m² del área a aplicarse. El concentrado emulsionable, el polvo humectable o el concentrado de suspensión, etc., se aplican normalmente diluyéndolo con agua. En este caso, la concentración del presente compuesto después de la dilución está normalmente en el intervalo del 0,0005 al 2 % en peso, y preferentemente del 0,005 al 1 % en peso. La formulación de polvo o la formulación granular, etc., se aplica normalmente como si mismo sin diluirlo. En la aplicación a semillas, la cantidad del presente compuesto está en el intervalo normalmente de 0,001 a 100 g, y preferentemente de 0,01 a 50 g por 1 kg de las semillas.

30 En el presente documento, ejemplos del lugar donde viven las plagas son los arrozales, campos, jardines de té, huertos, tierras no agrícolas, casas, bandejas de cultivo, cajas de cultivo, suelos de cultivo y lecho de cultivo.

35 Además, en otra realización, por ejemplo, el presente compuesto puede administrarse al interior (dentro del cuerpo) o al exterior (superficie corporal) del vertebrado mencionado a continuación para exterminar sistémica o no sistémicamente los seres vivos o parásitos que son parásitos en el vertebrado. Ejemplos de un método de la medicación interna incluyen una administración, una administración anal, un trasplante, una administración a través de inyección subcutánea, intramuscular o intravenosamente. Ejemplos de un método de medicación externa incluyen una administración transdérmica. Además, el presente compuesto puede ser ingerido en un animal de ganado para exterminar insectos sanitarios que se producen en el excremento del animal.

40 Cuando el presente compuesto se aplica a los animales, tales como animales de ganado y animales domésticos en los que las plagas son parasitarias, la dosis varía dependiendo del método de administración, etc., pero es deseable en general administrar el presente compuesto de modo que una dosis del principio activo (el presente compuesto o sus sales) esté en el intervalo de generalmente de 0,1 mg a 2000 mg y preferentemente de 0,5 mg a 1.000 mg por 1 kg de peso corporal del animal.

45 El presente compuesto se puede usar como agente para el control de enfermedades de plantas en tierras de cultivo tales como campos, arrozales, prados, y huertos. El compuesto de la presente invención puede controlar enfermedades que tienen lugar en las tierras de cultivo o en otras para cultivar las siguientes "plantas".

60 Cultivos:

maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, alforfón, remolacha, colza, girasol, caña de azúcar, tabaco y otros;

65 Hortalizas:

5 hortalizas solanáceas (por ejemplo, berenjena, tomate, pimiento, pimienta y patata),
 hortalizas cucurbitáceas (por ejemplo, pepino, calabaza, calabacín, sandía y melón),
 hortalizas cucurbitáceas (por ejemplo, rábano japonés, nabo blanco, rábano picante, colinabo, col china,
 repollo, hojas de mostaza, brócoli, coliflor),
 5 hortalizas asteráceas (por ejemplo, bardana, margarita corona, alcachofa y lechuga),
 hortalizas liliáceas (por ejemplo, cebolleta, cebolla, ajo y espárragos),
 hortalizas ammiáceas (por ejemplo, zanahoria, perejil, apio y chirivía),
 hortalizas quenopodiáceas (por ejemplo, espinacas y acelgas),
 10 hortalizas lamiáceas (por ejemplo, *Perilla frutescens*, menta y albahaca),
 fresa, batata, *Dioscorea japonica*, colocasia y otras;

Flores:

15 Plantas ornamentales de follaje:

Frutas:

20 frutas pomáceas (por ejemplo, manzana, pera, pera japonesa, membrillo chino y membrillo),
 frutas de hueso (por ejemplo, melocotón, ciruela, nectarina, *Prunus mume*, cereza, albaricoque y ciruela
 pasa),
 frutas cítricas (por ejemplo, *Citrus unshiu*, naranja, limón, lima y pomelo),
 frutos secos (por ejemplo, castaña, nueces, avellana, almendra, pistacho, anacardos y nueces de
 macadamia),
 25 bayas (por ejemplo, arándano azul, arándano rojo, mora y frambuesa),
 uva, caqui, aceituna, ciruelo japonés, plátano, café, palmera datilera, cocos y otros;

Árboles que no sean árboles frutales:

30 árbol del té, morera, planta con flor,
 árboles de cuneta (por ejemplo, fresno, abedul, cornejo, *Eucalyptus*, *Ginkgo biloba*, lila, arce, *Quercus*, álamo,
 árbol de Judas, *Liquidambar formosana*, plátanos de sombra, zelkova, arborvitae japonés, abeto, *cicuta*,
 enebro, *Pinus*, *Picea* y *Taxus cuspidate*);

35 y otros.

Las "plantas" mencionadas anteriormente incluyen cultivos modificados genéticamente.

40 Las plagas en las que el presente compuestos tienen una eficacia de control incluyen patógenos de planta tales
 como hongos filamentosos, así como artrópodos perjudiciales tales como insectos perjudiciales y ácaros
 perjudiciales y nematelmintos tales como nemátodos, e incluyen de manera específica los siguientes ejemplos,
 pero no se limitan a los mismos.

45 Enfermedades del arroz: tizón del arroz (*Magnaporthe grisea*), mancha marrón (*Cochliobolus miyabeanus*), tizón
 de la vaina del arroz (*Rhizoctonia solani*), enfermedad de Bakanae (*Gibberella fujikuroi*) y marchitez amarilla del
 arroz (*Sclerophthora macrospora*);

50 Enfermedades del trigo: oídio del trigo (*Erysiphe graminis*), fusariosis (*Fusarium graminearum*, *F. avenaceum*, *F.*
culmorum, *Microdochium nivale*), roya del trigo (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*), moho de la nieve
 de color rosa (*Micronectriella nivale*), podredumbre de la nieve *Typhula* (*Typhula* sp.), carbón desnudo (*Ustilago*
tritici), tizón (*Tilletia caries*, *T. controversa*), mancha ocular (*Pseudocercospora herpotrichoides*), septoriosis en
 hojas (*Septoria tritici*), tizón de las glumas (*Stagonospora nodorum*), mancha amarilla (*Pyrenophora tritici-*
repentis), podredumbre por rhizoctonia (*Rhizoctonia solani*) y enfermedad mal de pie (*Gaeumannomyces*
graminis);

55 Enfermedades de la cebada: oídio (*Erysiphe graminis*), fusariosis de la espiga (*Fusarium graminearum*, *F.*
avenaceum, *F. culmorum*, *Microdochium nivale*), roya de la cebada (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. hordei*),
 carbón desnudo (*Ustilago nuda*), escala dura (*Rhynchosporium secalis*), mancha en red (*Pyrenophora teres*),
 mancha borrosa (*Cochliobolus sativus*), estría de la hoja (*Pyrenophora graminea*), enfermedad de *Ramularia*
(Ramularia colloctygni) y podredumbre por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*);

60 Enfermedades del maíz: roya del maíz (*Puccinia sorghi*), roya del sur (*Puccinia polysora*), tizón norteño de la hoja
 (*Setosphaeria turcica*), tizón sureño de la hoja (*Cochliobolus heterostrophus*), antracnosis (*Colletotrichum*
gfaminicola), cercosporiosis (*Cercospora zea-maydis*), mancha ocular (*Kabatiella zea*) y mancha de la hoja por
phaeosphaeria (*Phaeosphaeria maydis*);

Enfermedades del algodón: antracnosis (*Colletotrichum gossypii*), mildiú gris (*Ramularia areola*), mancha de la
 hoja por *alternaria* (*Alternaria macrospora*, *A. gossypii*);

Enfermedades del café: roya (*Hemileia vastatrix*);

65 Enfermedades de la colza: podredumbre por *sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*), mancha negra (*Alternaria*
brassicae) y pie negro (*Phoma lingam*);

- Enfermedades de cítricos: melanosis (*Diaporthe citri*), roña (*Elsinoe Fawcetti*) y podredumbre del fruto (*Penicillium digitatum*, *P. italicum*); Enfermedades de la manzana: tizón de la flor (*Monilinia mali*), cancro (*Valsa ceratosperma*), oidio (*Podosphaera leucotricha*), mancha de la hoja por *Alternaria* (*Alternaria alternata*, patotipo de la manzana), roña (*Venturia inaequalis*) y podredumbre amarga (*Colletotrichum acutatum*);
- 5 Enfermedades de la pera: roña (*Venturia nashicola*, *V. pirina*), mancha negra (*Alternaria alternata*, patotipo de la pera japonesa) y roya (*Gymnosporangium haraeaeum*);
- Enfermedades del melocotón: podredumbre parda (*Monilinia fructicola*), roña (*Cladosporium carpophilum*) y podredumbre por *Phomopsis* (*Phomopsis* sp.);
- 10 Enfermedades de la uva: antracnosis (*Elsinoe ampelina*), podredumbre madura (*Glomerella cingulata*), oidio (*Uncinula necator*), roya (*Phakopsora ampelopsidis*), podredumbre negra (*Guignardia bidwellii*) y mildiu (*Plasmopara viticola*); Enfermedades del caqui japonés: antracnosis (*Gloeosporium kaki*) y mancha de la hoja (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*);
- Enfermedades de la familia de la calabaza: antracnosis (*Colletotrichum lagenarium*), oidio (*Sphaerotheca fuliginea*), tizón gomoso del tallo (*Didymella bryoniae*), mancha anillada (*Corynespora cassiicola*), marchitamiento por *Fusarium* (*Fusarium osysporum*), mildiú veloso (*Pseudoperonospora cubensis*), podredumbre por *Phytophthora* (*Phytophthora* sp.), y podredumbre de las semillas (*Pythium* sp.); Enfermedades del tomate: tizón temprano (*Alternaria solani*), moho de la hoja (*Cladosporium fulvum*), moho de la hoja (*Pseudocercospora fuligena*) y tizón tardío (*Phytophthora infestans*);
- 15 Enfermedades de la berenjena: mancha marrón (*Phomopsis vexans*) y oidio (*Erysiphe cichoracearum*);
- Enfermedades de hortalizas crucíferas: mancha foliar por *Alternaria* (*Alternaria japonica*), mancha blanca (*Cercospora brassicae*), hernia de la col (*Plasmodiophora parasitica*), mildiú (*Peronospora parasitica*);
- Enfermedades de la cebolla de Gales; roya (*Puccinia allii*);
- Enfermedades de la soja: mancha púrpura (*Cercospora kikuchii*), roña por *Sphaceloma* (*Elsinoe glycines*), tizón del tallo y la vaina (*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*), roya (*Phakopsora pachyrhizi*), mancha anillada (*Corynespora cassiicola*), antracnosis (*Colletotrichum glycines*, *C. truncatum*), podredumbre por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), mancha de ojo de rana en la hoja (*Cercospora sojae*);
- 25 Enfermedades de la alubia roja: antracnosis (*Colletotrichum lindemthianum*);
- Enfermedades del cacahuete: mancha temprana de la hoja (*Cercospora personata*), mancha tardía de la hoja (*Cercospora arachidicola*) y tizón del sur (*Sclerotium rolfsii*);
- 30 Enfermedades del guisante de jardín: oidio (*Erysiphe pisi*);
- Enfermedades de la patata: tizón temprano (*Alternaria solani*), tizón tardío (*Phytophthora infestans*) y verticilosis (*Verticillium albo-atrum*, *V. dahliae*, *V. nigrescens*);
- Enfermedades de la fresa: oidio (*Sphaerotheca humuli*);
- Enfermedades del té: tizón vesicular de red (*Exobasidium reticulatum*), roña blanca (*Elsinoe leucospila*), tizón gris (*Pestalotiopsis* sp.) y antracnosis (*Colletotrichum theae-sinensis*);
- 35 Enfermedades del tabaco: mancha marrón (*Alternaria longipes*), oidio (*Erysiphe cichoracearum*), antracnosis (*Colletotrichum tabacum*), mildiú (*Peronospora tabacina*) y pata negra (*Phytophthora nicotianae*);
- Enfermedades de la remolacha azucarera: mancha foliar por *Cercospora* (*Cercospora beticola*), tizón de la hoja (*Thanatephorus cucumeris*), podredumbre de la raíz (*Thanatephorus cucumeris*) y podredumbre de la raíz por *Aphanomyces* (*Aphanomyces sochlioides*);
- 40 Enfermedades de la rosa: mancha negra (*Diplocarpon rosae*) y oidio (*Sphaerotheca pannosa*);
- Enfermedades del crisantemo: tizón de la hoja (*Septoria chrysanthemiindici*) y roya blanca (*Puccinia horiana*);
- Enfermedades de la cebolla: tizón de la hoja por *Botrytis* (*Botrytis cinerea*, *B. byssoidea*, *B. squamosa*), podredumbre del cuello por moho gris (*Botrytis alli*) y podredumbre pequeña de la esclerótica (*Botrytis squamosa*);
- 45 Enfermedades de diversos grupos: moho gris (*Botrytis cinerea*) y podredumbre por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*);
- Enfermedades del rábano japonés: mancha foliar por *Alternaria* (*Alternaria brassicicola*);
- Enfermedades del césped: mancha de dólar (*Sclerotinia homeocarpa*), mancha marrón y mancha grande (*Rhizoctonia solani*); y
- 50 Enfermedades del plátano: enfermedad de Sigatoka (*Mycosphaerella fijiensis*, *Mycosphaerella musicola*).
- Hemiptera:
- 55 Delphacidae (por ejemplo, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens* o *Sogatella furcifera*); Deltocephalidae (por ejemplo, *Nephotettix cincticeps* o *Nephotettix virescens*);
- Aphididae (por ejemplo, *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Brevicoryne brassicae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Aulacorthum solani*, *Rhopalosiphum padi*, *Toxoptera citricidus*); Pentatomidae (por ejemplo, *Nezara antennata*, *Riptortus clavatus*, *Leptocorisa chinensis*, *Eysarcoris parvus*, *Halyomorpha mista* o *Lygus lineolaris*);
- 60 Aleyrodidae (por ejemplo, *Trialeurodes vaporariorum* o *Bemisia argentifolii*);
- Coccoidea (por ejemplo, *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens* o *Icerya purchasi*);
- Tingidae;
- Psyllidae;
- 65 chinches (*Cimex lectularius*) y otros;

Lepidoptera:

- 5 Pyralidae (por ejemplo, *Chilo suppressalis*, *Tryporyza incertulas*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Notarcha derogata*, *Plodia interpunctella*, *Ostrinia furnacalis*, *Hellula undalis*, *Pediasia teterrellus*);
 Noctuidae (por ejemplo, *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Pseudaletia separata*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Trichoplusia* spp., *Heliothis* spp o *Helicoverpa* spp.);
 Pieridae (por ejemplo, *Pieris rapae*);
 10 Tortricidae (por ejemplo, *Adoxophyes* spp., *Grapholita molesta*, *Cydia pomonella*, *Leguminivora glycinivorella*, *Matsumuraeses azukivora*, *Adophyes orana fasciata*, *Adoxophyes* sp., *Homona magnanima*, *Archips fuscocupreanus*, *Cydia pomonella*);
 Gracillariidae (por ejemplo, *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoneella*);
 Carposinidae (por ejemplo, *Carposina niponensis*); Lyonetiidae (por ejemplo, *Lyonetia* spp.);
 Lymantriidae (por ejemplo, *Lymantria* spp. o *Euproctis* spp.);
 15 Yponomeutidae (por ejemplo, *Plutella xylostella*); Gelechiidae (por ejemplo, *Pectinophora gossypiella* o *Phthorimaea operculella*);
 Arctiidae (por ejemplo, *Hyphantria cunea*);
 Tineidae (por ejemplo, *Tinea translucens* o *Tineola bisselliella*); y otros;

Thysanoptera:

- 20 Thysanoptera (por ejemplo, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci*, *Frankliniella intonsa*, *Frankliniella fusca*);

Diptera:

- 25 *Musca domestica*, *Culex popiens pallens*, *Tabanus trigonus*, *Hylemya antiqua*, *Hylemya platura*, *Anopheles sinensis*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Chlorops oryzae*, *Dacus cucurbitae*, *Ceratitis capitata*, *Liriomyza trifolii* y otros;

Coleoptera:

- 30 *Epilachna vigintioctopunctata*, *Aulacophora femoralis*, *Phyllotreta striolata*, *Oulema oryzae*, *Echinocnemus squameus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Anthonomus grandis*, *Callosobruchus chinensis*, *Sphenophorus venatus*, *Popillia japonica*, *Anomala cuprea*, *Diabrotica* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Agriotes* spp.,
 35 *Lasioderma serricorne*, *Anthrenus verbasci*, *Tribolium castaneum*, *Lyctus brunneus*, *Anoplophora malasiaca*, *Tomicus piniperda*) y otros;

Orthoptera:

- 40 *Locusta migratoria*, *Gryllotalpa africana*, *Oxya yezoensis*, *Oxya japonica* y otros;

Hymenoptera:

- 45 *Athalia rosae*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp. y otros;

Nemátodos:

- 50 *Aphelenchoides besseyi*, *Nothotylenchus acris*, *Heterodera glycines*, *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus*, *Nacobbus aberrans* y otros;

Blattariae:

- 55 *Blattella germanica*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Blatta orientalis* y otros;

Acarina:

- 60 *Tetranychidae* (por ejemplo, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri* o *Oligonychus* spp.);
Eriophyidae (por ejemplo, *Aculops pelekassi*);
Tarsonemidae (por ejemplo, *Polyphagotarsonemus latus*); *Tenuipalpidae*;
Tuckerellidae;
Acaridae (por ejemplo, *Tyrophagus putrescentiae*);
Pyroglyphidae (por ejemplo, *Dermatophagoides farinae* o *Dermatophagoides pteronyssinus*);
Cheyletidae (por ejemplo, *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis* o *Cheyletus moorei*);
 65 *Dermanyssidae*;

y otros.

También, la formulación que comprende el presente compuesto o sales del mismo se puede usar en el campo relacionado con el tratamiento de enfermedades del ganado o la industria ganadera, y por ejemplo, puede exterminar los seres vivos o parásitos que son parásitos en el interior y/o en el exterior de un vertebrado como el ser humano, vaca, oveja, cerdo, aves de corral, perro, gato y peces, con el fin de mantener la salud pública. Los ejemplos de las plagas incluyen *Isodes* spp. (por ejemplo, *Isodes scapularis*), *Boophilus* spp. (por ejemplo, *Boophilus microplus*), *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (por ejemplo, *Rhipicephalus sanguineus*), *Haemaphysalis* spp. (por ejemplo, *Haemaphysalis longicornis*), *dermacentor* spp., *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*), *Dermahyssus gallinae*, *Ornithonyssus sylviarum*, *Sarcoptes* spp. (por ejemplo, *Sarcoptes scabiei*), *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Demodex* spp., *Eutrombicula* spp., *Ades* spp. (por ejemplo, *Aedes albopictus*), *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Culicodes* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Haematobia* spp., *Tabanus* spp., *Simulium* spp., *Triatoma* spp., *Phthiraptera* (por ejemplo, *Damalinia* spp.), *Linognathus* spp., *Haematopinus* spp., *Ctenocephalides* spp. (por ejemplo, *Ctenocephalides felis*) *Xenosylla* spp., *monomorium pharaonis* y nemátodos [por ejemplo, gusano capilar (por ejemplo, *Nippostrongylus brasiliensis*, *Trichostrongylus axei*, *Trichostrongylus colubriformis*), *Trichinella* spp. (por ejemplo, *Trichinella spiralis*), *Haemonchus contortus*, *Nematodirus* spp. (por ejemplo, *Nematodirus battus*), *Ostertagia circumcincta*, *Cooperia* spp., *Hymenolepis nana* y otros.

20 Ejemplos

Los siguientes Ejemplos incluyen los Ejemplos de Preparación, Ejemplos de Formulación y Ejemplos de Prueba, sirven para ilustrar la presente invención con más detalle, que no debe pretender limitar la presente invención.

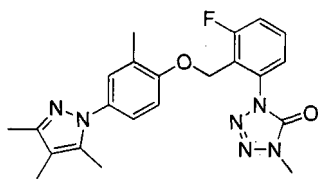
25 Los Ejemplos de preparación se muestran a continuación. RMN ¹H RMN significa una resonancia magnética nuclear de protones, espectro y se usa tetrametilsilano como patrón interno y el desplazamiento químico (δ) se expresa en ppm.

Ejemplo de la preparación 1

30 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 1), 0,24 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,19 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 35 0,33 g de 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetilpirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 1").

Presente compuesto 1

40



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, td, J = 8,2, 5,8 Hz), 7,35-7,27 (2H, m), 7,15-7,13 (1H, m), 7,10 (1H, dd, J = 8,6, 2,3 Hz), 6,88 (1H, d, J = 8,7 Hz), 5,29 (2H, d, J = 1,0 Hz), 3,63 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,96 (3H, s).

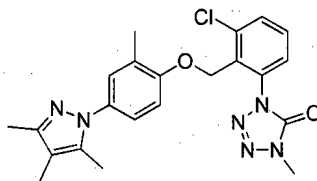
45

Ejemplo de la preparación 2

50 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 2), 0,23 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,17 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,28 g de 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetilpirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 2").

55

Presente compuesto 2



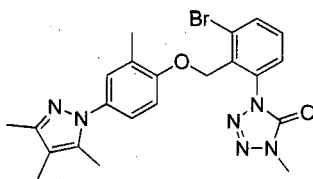
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,1, 1,1 Hz), 7,48 (1H, t, *J* = 8,1 Hz), 7,41 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,1 Hz), 7,15 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,10 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,33 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 3

- 10 Una mezcla de 2,5 g de 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 5), 1,6 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 1,29 g de carbonato de potasio y 70 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,1 g de 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 3").

Presente compuesto 3

20



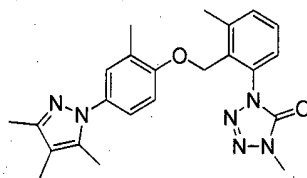
- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 7,7, 1,4 Hz), 7,46-7,38 (2H, m), 7,15 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,10 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,5 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,32 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 4

- 30 Una mezcla de 0,35 g de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 14), 0,28 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,22 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,24 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 4").

35

Presente compuesto 4



- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,39 (2H, m), 7,31-7,27 (1H, m), 7,16 (1H, d, *J* = 2,0 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,6 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,05 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,97 (3H, s).

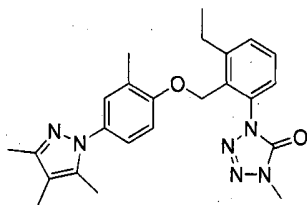
Ejemplo de la preparación 5

- 45 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 17), 0,23 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,18 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar

0,22 g de 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetilpirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 5").

Presente compuesto 5

5



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51-7,44 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,9 Hz), 7,16 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,5 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,07 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,23 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,97 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

10

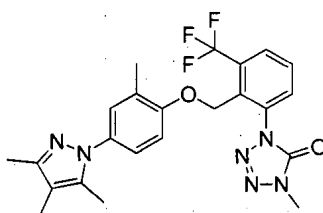
Ejemplo de la preparación 6

Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-trifluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 11), 0,12 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,17 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,30 g de 1-{3-trifluorometil-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 6").

15

20

Presente compuesto 6



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,92 (1H, dd, *J* = 6,8, 2,4 Hz), 7,72-7,66 (2H, m), 7,15 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,5 Hz), 6,85 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,32 (2H, s), 3,57 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,97 (3H, s).

25

Ejemplo de la preparación 7

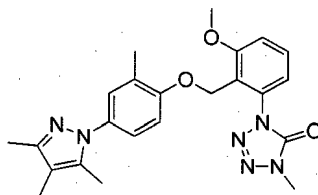
Una mezcla de 0,35 g de 1-(2-bromometil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 9), 0,27 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,21 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,18 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 7").

30

35

Presente compuesto 7

40



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,11 (1H, s), 7,07 (3H, d, *J* = 8,0 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 3,91 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,95 (3H, s).

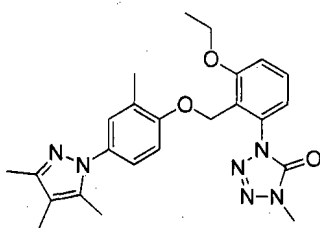
45

Ejemplo de la preparación 8

Una mezcla de 0,30 g de 1-(3-etoxi-2-bromometil-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 16), 0,22 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 28), 0,17 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,29 g de 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetilpirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 8").

10

Presente compuesto 8

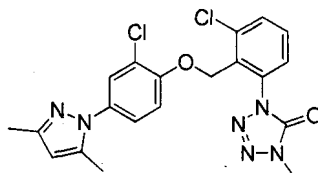


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,12-7,04 (4H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,30 (2H, s), 4,14 (2H, c, *J* = 7,0 Hz), 3,61 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,96 (3H, s), 1,44 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

Ejemplo de la preparación 9

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 20) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 9").

25 Presente compuesto 9

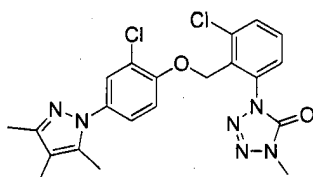


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,4 Hz), 7,50-7,43 (2H, m), 7,42 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,22 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 6,96 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,96 (1H, s), 5,53 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 10

35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 19) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 10").

40 Presente compuesto 10

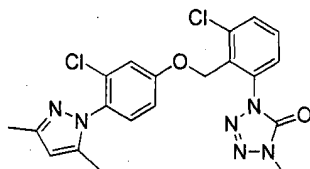


45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, dd, *J* = 7,3, 2,2 Hz), 7,50-7,43 (2H, m), 7,39 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,19 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,7 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,52 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 11

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 3-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 29) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[3-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 11").

Presente compuesto 11

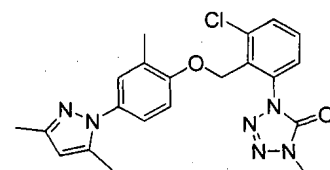


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,5 Hz), 7,50 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,42 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,2 Hz), 7,28 (1H, s), 6,98 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 6,82 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 5,96 (1H, s), 5,31 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 12

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 30) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 12").

Presente compuesto 12

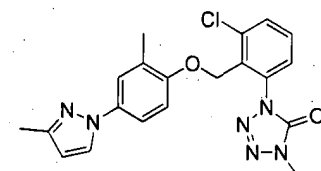


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,2 Hz), 7,48 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,2 Hz), 7,17 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,12 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,95 (1H, s), 5,34 (2H, s), 3,67-3,59 (3H, m), 2,28 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 13

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 36) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 13").

Presente compuesto 13



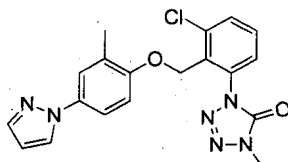
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,5 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,42-7,39 (2H, m), 7,34-7,30 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,19 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,33 (2H, s), 3,60 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 14

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en

Ejemplo de Preparación de Referencia 37) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-(2-metil-4-pirazol-1-il-fenoximetil)-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 14").

5 Presente compuesto 14

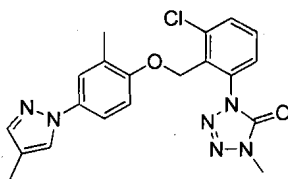


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,68 (1H, d, J = 1,7 Hz), 7,62 (1H, dd, J = 8,0, 1,3 Hz), 7,48 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,45-7,37 (3H, m), 6,89 (1H, d, J = 8,7 Hz), 6,42 (1H, t, J = 2,2 Hz), 5,34 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 15

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 34) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 15").

20 Presente compuesto 15

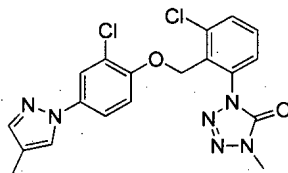


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,71 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,60-7,58 (1H, m), 7,56-7,48 (3H, m), 7,45 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,32 (1H, dd, J = 8,8, 2,7 Hz), 6,82 (1H, d, J = 8,8 Hz), 5,18 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 16

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 44) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 16").

Presente compuesto 16

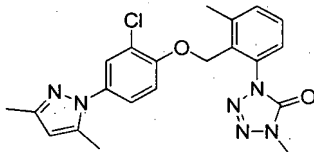


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,64 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,61-7,57 (2H, m), 7,50-7,40 (4H, m), 6,95 (1H, d, J = 8,9 Hz), 5,51 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,14 (3H, s).

40 Ejemplo de la preparación 17

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 20) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 17").

Presente compuesto 17

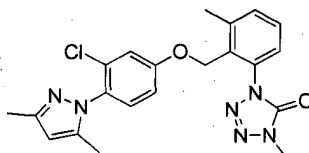


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,38 (3H, m), 7,31-7,28 (1H, m), 7,22 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,6 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,96 (1H, s), 5,18 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 18

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 3-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 29) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[3-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 18").

- 15 Presente compuesto 18



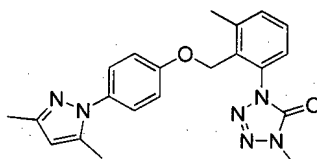
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47-7,40 (2H, m), 7,31-7,27 (2H, m), 7,01 (1H, d, *J* = 2,8 Hz), 6,85 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,8 Hz), 5,97 (1H, s), 5,05 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 19

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 31) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 19").

Presente compuesto 19

30

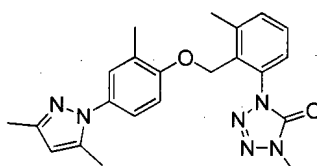


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (2H, m), 7,32-7,27 (3H, m), 6,94-6,89 (2H, m), 5,96 (1H, s), 5,05 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 20

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 30) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 20").

Presente compuesto 20



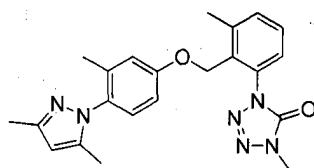
45

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,9, 2,2 Hz), 7,18 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,13 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,4 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,95 (1H, s), 5,06 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,11 (3H, s).

5 Ejemplo de la preparación 21

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 3-metil-4-(3,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 32) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[3-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 21").

Presente compuesto 21

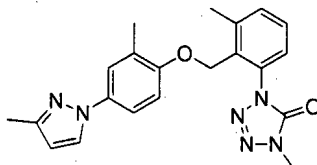


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,39 (2H, m), 7,30-7,26 (1H, m), 7,11 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,79-6,72 (2H, m), 5,93 (1H, s), 5,03 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,49 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,99 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 22

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 36) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 22").

25 Presente compuesto 22

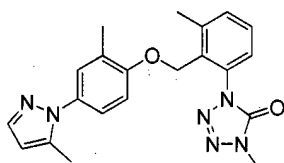


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,69 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,45-7,39 (3H, m), 7,33 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 7,29-7,26 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,20 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,05 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 23

35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 35) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 23").

40 Presente compuesto 23



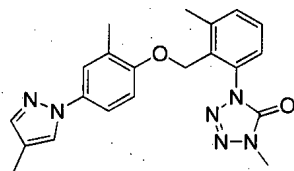
45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 7,46-7,41 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 7,21-7,19 (1H, m), 7,17 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,16 (1H, dd, *J* = 1,7, 0,7 Hz), 5,07 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,30 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 24

50 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de

Preparación de Referencia 34) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 24").

5 Presente compuesto 24

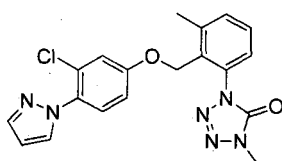


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60-7,59 (1H, m), 7,48 (1H, s), 7,45-7,39 (3H, m), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,7 Hz), 7,29-7,26 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,06 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 25

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 3-cloro-4-(pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 33) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-(3-cloro-4-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 25").

20 Presente compuesto 25

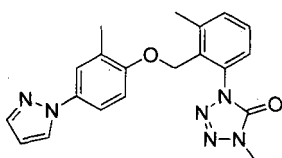


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,74 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,72 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,47-7,41 (3H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,6 Hz), 7,02 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 6,86 (1H, dd, *J* = 8,9, 2,7 Hz), 6,44 (1H, t, *J* = 2,2 Hz), 5,06 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,50 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 26

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 37) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-(2-metil-4-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 26").

35 Presente compuesto 26

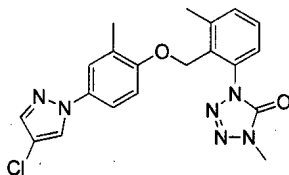


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,68 (1H, d, *J* = 2,1 Hz), 7,47-7,37 (4H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,4 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,43 (1H, t, *J* = 2,1 Hz), 5,07 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,15 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 27

45 Una mezcla de 0,5 g de 1-{3-metil-2-(2-metil-4-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 26), 0,19 g de N-clorosuccinimida y 15 ml de cloroformo se agitó a temperatura ambiente durante doce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-(2-metil-4-(4-cloro-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 27") 0,51 g.

Presente compuesto 27



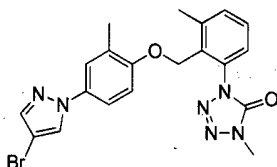
- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,80-7,78 (1H, m), 7,60-7,58 (1H, m), 7,47-7,37 (3H, m), 7,34 (1H, dd, $J = 8,5, 2,4$ Hz), 7,30-7,25 (1H, m), 6,87 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 5,07 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 28

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 27 usando N-bromosuccinimida en lugar de N-clorosuccinimida dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-bromo-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 28").

Presente compuesto 28

15



- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,82 (1H, s), 7,63 (1H, s), 7,46-7,39 (3H, m), 7,34 (1H, dd, $J = 8,6, 2,8$ Hz), 7,30-7,26 (1H, m), 6,88 (1H, d, $J = 8,6$ Hz), 5,07 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,14 (3H, s).

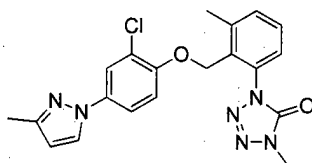
20

Ejemplo de la preparación 29

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 39) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 29").

Presente compuesto 29

30

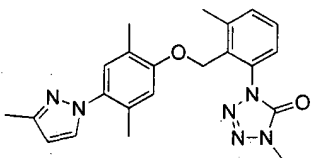


- 30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,68 (2H, dd, $J = 9,5, 2,4$ Hz), 7,45-7,37 (3H, m), 7,29 (1H, dd, $J = 7,2, 1,8$ Hz), 6,91 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,22 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,18 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,36 (3H, s).

- 35 Ejemplo de la preparación 30

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 40) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "(Presente compuesto 30)").

Presente compuesto 30



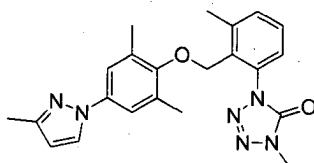
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,39 (3H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 7,06 (1H, s), 6,70 (1H, s), 6,17 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,05 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,35 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 31

5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2,6-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 38) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2,6-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 31").

10

Presente compuesto 31

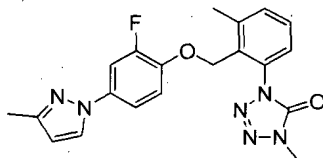


15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,71 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,43-7,36 (2H, m), 7,23-7,19 (3H, m), 6,19 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 4,99 (2H, s), 3,59 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,07 (6H, s).

Ejemplo de la preparación 32

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-fluoro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 43) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-fluoro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 32").

25 Presente compuesto 32



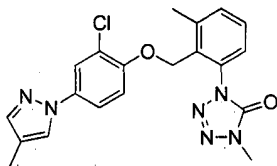
30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,69 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,44-7,36 (3H, m), 7,29-7,24 (2H, m), 6,95 (1H, t, $J = 8,8$ Hz), 6,21 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 5,14 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,35 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 33

35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 44) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 33").

Presente compuesto 33

40



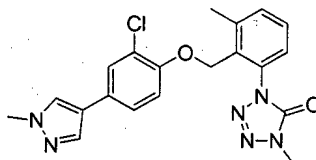
45 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,66 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,59 (1H, s), 7,49 (1H, s), 7,44-7,37 (3H, m), 7,31-7,27 (1H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 5,17 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 34

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol (descrito en

Ejemplo de Preparación de Referencia 52) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 34").

5 Presente compuesto 34



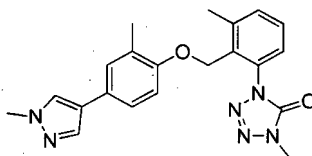
10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67-7,66 (1H, m), 7,52 (1H, s), 7,44-7,37 (3H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,3, 2,0 Hz), 7,26-7,23 (1H, m), 6,87 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,16 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,67 (3H, s), 2,54 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 35

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 53) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 35").

Presente compuesto 35

20



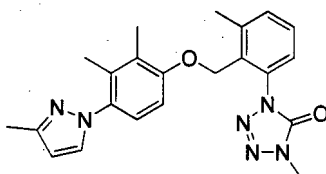
25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, s), 7,52 (1H, s), 7,45-7,39 (2H, m), 7,30-7,27 (1H, m), 7,24-7,21 (2H, m), 6,83 (1H, d, J = 8,8 Hz), 5,04 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 36

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2,3-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 42) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2,3-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 36").

Presente compuesto 36

35

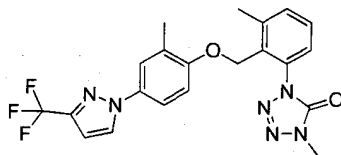


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (2H, m), 7,38 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,30-7,26 (1H, m), 7,09 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,75 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,17 (1H, d, J = 2,2 Hz), 5,05 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,35 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,98 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 37

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 45) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 37").

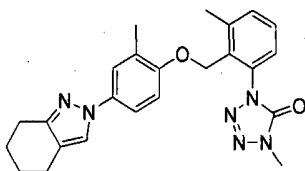
Presente compuesto 37



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,83 (1H, t, *J* = 1,1 Hz), 7,47-7,38 (4H, m), 7,32-7,28 (1H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,68 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,08 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,15 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 38

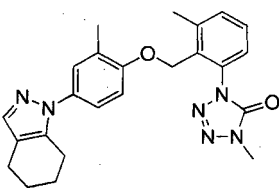
- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 50) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 38").
- 15 Presente compuesto 38



- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50 (1H, s), 7,45-7,38 (3H, m), 7,32-7,27 (2H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,05 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,76 (2H, t, *J* = 6,2 Hz), 2,60 (2H, t, *J* = 6,1 Hz), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,89-1,82 (2H, m), 1,81-1,74 (2H, m).

Ejemplo de la preparación 39

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 51) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 39").
- 30 Presente compuesto 39

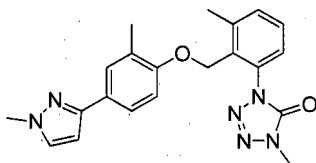


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (3H, m), 7,30-7,24 (2H, m), 7,19 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,6 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,06 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,66 (2H, t, *J* = 5,4 Hz), 2,58 (2H, t, *J* = 5,1 Hz), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,83-1,74 (4H, m).

Ejemplo de la preparación 40

- 40 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 14), 0,21 g de 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 60), 0,19 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,22 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 40").
- 45

Presente compuesto 40



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58-7,56 (1H, m), 7,53 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 7,44-7,39 (2H, m), 7,34 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,28 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 6,85 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,44 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,06 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s).

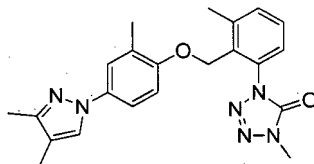
Ejemplo de la preparación 41

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 46) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 41").

15

Presente compuesto 41

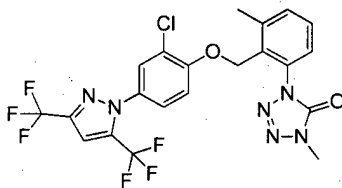


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, s), 7,43-7,38 (3H, m), 7,31-7,27 (2H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,04 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 42

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-ditri fluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 22) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-ditri fluorometil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 42").

- 30 Presente compuesto 42

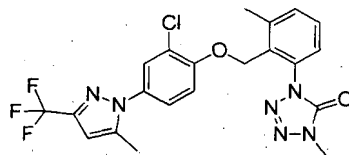


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,47-7,40 (2H, m), 7,35-7,31 (2H, m), 7,05 (1H, s), 7,00 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,23 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,54 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 43

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 23) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-cloro-4-(3-trifluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 43").

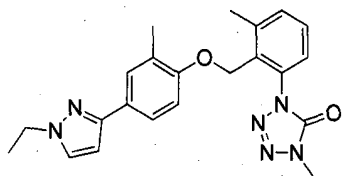
Presente compuesto 43



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,45-7,40 (2H, m), 7,33-7,29 (1H, m), 7,28-7,24 (1H, m), 6,98-6,95 (1H, m), 6,43 (1H, s), 5,21 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,55 (3H, s), 2,32 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 44

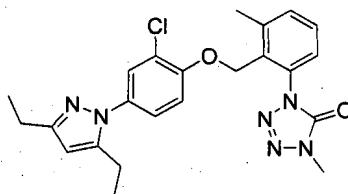
- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 61) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1-etil-1H-3-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 44").
- 15 Presente compuesto 44



- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58-7,57 (1H, m), 7,55-7,51 (1H, m), 7,43-7,39 (2H, m), 7,38 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,30-7,27 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,44 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,06 (2H, s), 4,20 (2H, c, *J* = 7,3 Hz), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,51 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

Ejemplo de la preparación 45

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-dietil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 24) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dietil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 45").
- 30 Presente compuesto 45



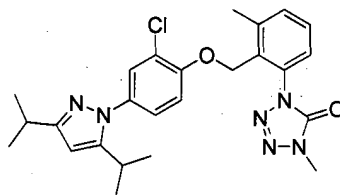
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,38 (3H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,3, 2,0 Hz), 7,22 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,6 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,02 (1H, s), 5,18 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,66 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,59 (2H, c, *J* = 7,5 Hz), 2,54 (3H, s), 1,29-1,24 (3H, m), 1,23-1,18 (3H, m).

Ejemplo de la preparación 46

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-diisopropil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 25) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-diisopropil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-phenyl}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 46").

45

Presente compuesto 46

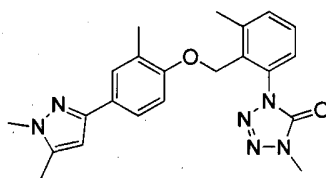


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,38 (3H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,7 Hz), 7,22 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,4 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,00 (1H, s), 5,18 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,99-2,91 (2H, m), 2,54 (3H, s), 1,28 (6H, d, *J* = 7,1 Hz), 1,16 (6H, d, *J* = 6,8 Hz).

Ejemplo de la preparación 47

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 63) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 47").

15 Presente compuesto 47

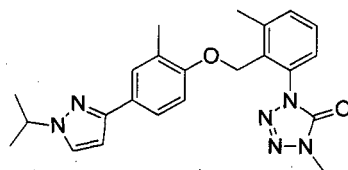


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,52 (1H, m), 7,48 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,44-7,38 (2H, m), 7,30-7,26 (1H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,23 (1H, s), 5,05 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 48

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(1-isopropil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 62) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(1-isopropil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 48").

30 Presente compuesto 48



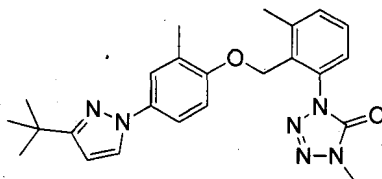
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58-7,57 (1H, m), 7,55-7,51 (1H, m), 7,45-7,38 (3H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,44 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,06 (2H, s), 4,57-4,50 (1H, m), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,53 (6H, d, *J* = 6,8 Hz).

Ejemplo de la preparación 49

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3-*tert*-butil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 48) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(3-*tert*-butil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 49").

45

Presente compuesto 49



5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,45-7,39 (3H, m), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,6, 2,8 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,26 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,05 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,36 (9H, s).

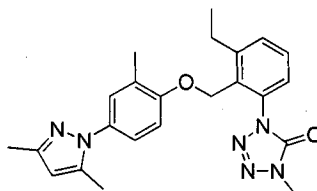
Ejemplo de la preparación 50

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 30) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 50").

15

Presente compuesto 50



20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51-7,43 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,9 Hz), 7,19-7,11 (2H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,95 (1H, s), 5,08 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,28 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,10 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 8,8 Hz).

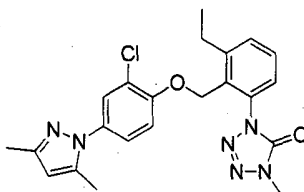
Ejemplo de la preparación 51

25

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 20) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 51").

30

Presente compuesto 51



35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,42 (3H, m), 7,31 (1H, dd, *J* = 7,4, 1,6 Hz), 7,23 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,7 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,96 (1H, s), 5,21 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,87 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,30 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

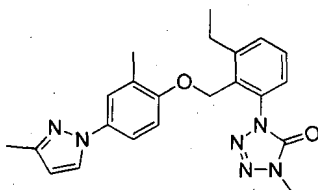
Ejemplo de la preparación 52

40

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 36) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 52").

45

Presente compuesto 52

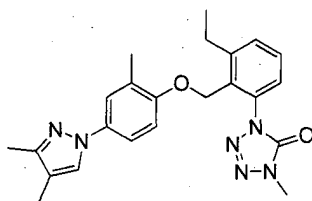


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,69 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,50-7,41 (3H, m), 7,34 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,9 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,1 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,20 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 5,07 (2H, s), 3,59 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,36 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de la preparación 53

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 46) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 53").

15 Presente compuesto 53

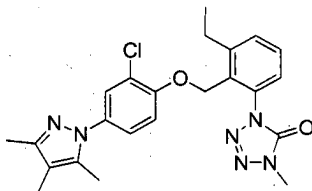


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, s), 7,50-7,43 (1H, m), 7,38 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,31-7,27 (3H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,06 (2H, s), 3,59 (3H, s), 2,85 (2H, d, *J* = 7,6 Hz), 2,27 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,30-1,24 (3H, m).

Ejemplo de la preparación 54

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 19) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 54").

30 Presente compuesto 54

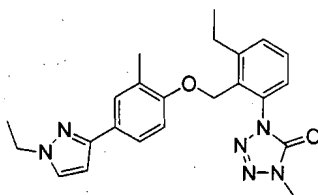


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,40 (3H, m), 7,33-7,30 (1H, m), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,20 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,87 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,22 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,96 (3H, s), 1,30 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de la preparación 55

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 61) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 55").

Presente compuesto 55

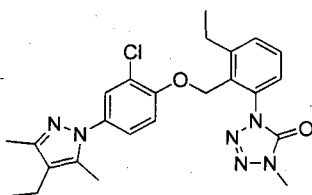


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57-7,42 (4H, m), 7,38 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,30-7,27 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,44 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,08 (2H, s), 4,20 (2H, c, *J* = 7,3 Hz), 3,57 (3H, s), 2,88-2,82 (2H, m), 2,11 (3H, s), 1,51 (3H, t, *J* = 7,2 Hz), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de la preparación 56

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 27) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenoxy]metil}-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 56").

15 Presente compuesto 56

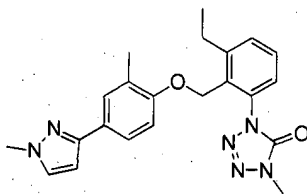


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,41 (3H, m), 7,31 (1H, dd, *J* = 7,5, 1,7 Hz), 7,23-7,20 (1H, m), 6,95 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,20 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,87 (2H, c, *J* = 7,5 Hz), 2,41 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,24 (3H, s), 2,20 (3H, s), 1,30 (3H, t, *J* = 7,6 Hz), 1,11 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de la preparación 57

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 60) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]metil}-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 57").

30 Presente compuesto 57



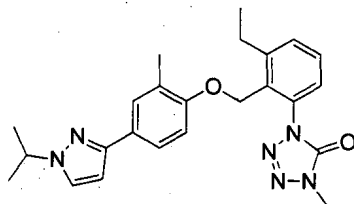
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,56 (1H, s), 7,53 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,49-7,43 (2H, m), 7,34 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,29-7,26 (1H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,45 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,08 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,7 Hz).

Ejemplo de la preparación 58

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 62) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]metil}-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 58").

45

Presente compuesto 58



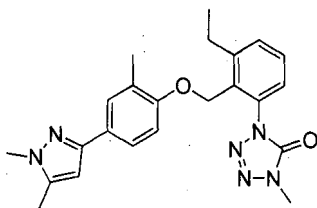
5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58-7,56 (1H, m), 7,55-7,52 (1H, m), 7,48-7,43 (2H, m), 7,41 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,44 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 5,08 (2H, s), 4,58-4,50 (1H, m), 3,58 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,4 Hz), 2,11 (3H, s), 1,53 (6H, d, *J* = 6,8 Hz), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de la preparación 59

10 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 17), 0,21 g de 2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 63), 0,18 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después,
15 el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,33 g de 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1 *H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 59").

Presente compuesto 59

20



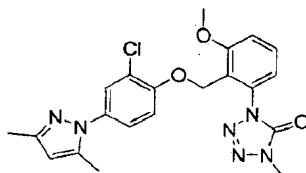
25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,52 (1H, m), 7,51-7,43 (3H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,23 (1H, s), 5,07 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,89-2,81 (2H, m), 2,29 (3H, s), 2,10 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de la preparación 60

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 20) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 60").

Presente compuesto 60

35

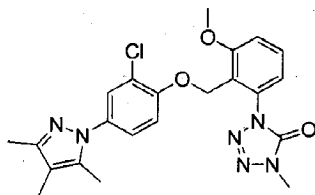


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,3 Hz), 7,38 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,19 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,7 Hz), 7,13-7,10 (1H, m), 7,07 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 6,98 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,95 (1H, s), 5,45 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 61

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 19) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 61").

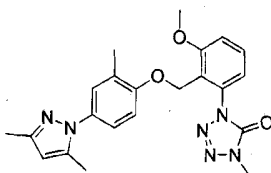
Presente compuesto 61



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,37 (3H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,6, 1,5 Hz), 7,20 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,6 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,18 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 62

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 30) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 62").
- 15 Presente compuesto 62



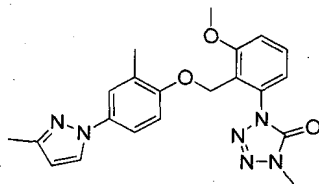
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,14-7,06 (4H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,94 (1H, s), 5,29 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 63

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 36) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 63").

Presente compuesto 63

30

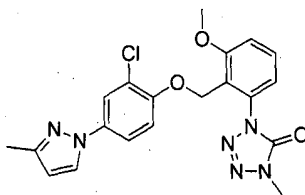


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,37 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,30 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 7,08 (2H, dd, *J* = 8,2, 5,0 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,18 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,28 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 64

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 39) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 64").

Presente compuesto 64

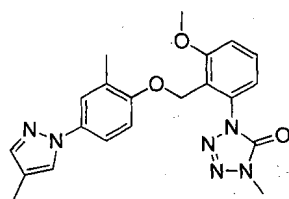


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,61 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,45 (1H, t, J = 8,3 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 9,0, 2,7 Hz), 7,10 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,06 (1H, d, J = 8,0 Hz), 6,96 (1H, d, J = 9,0 Hz), 6,20 (1H, d, J = 2,2 Hz), 5,44 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,34 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 65

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 34) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 65").

15 Presente compuesto 65

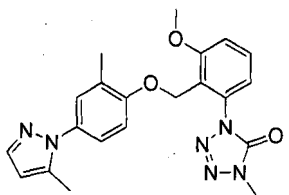


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58 (1H, s), 7,47 (2H, t, J = 8,3 Hz), 7,37 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,31 (1H, dd, J = 8,5, 2,7 Hz), 7,08 (2H, dd, J = 7,6, 6,6 Hz), 6,90 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 66

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 35) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 66").

30 Presente compuesto 66

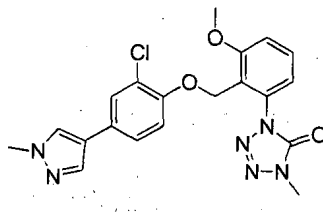


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51 (1H, s), 7,48 (1H, t, J = 8,3 Hz), 7,15 (1H, s), 7,12-7,07 (3H, m), 6,93 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,14 (1H, s), 5,30 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 67

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 52) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 67").

Presente compuesto 67

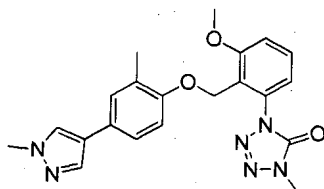


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,64 (1H, s), 7,49 (1H, s), 7,45 (1H, t, *J* = 8,3 Hz), 7,37 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,2 Hz), 7,10 (1H, dd, *J* = 8,0, 0,7 Hz), 7,06 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,43 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,92 (3H, s), 3,64 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 68

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 53) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 68").

15 Presente compuesto 68

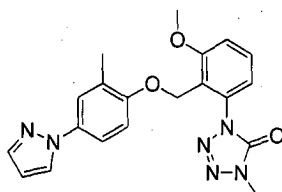


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, s), 7,50 (1H, s), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,21-7,16 (2H, m), 7,07 (2H, t, *J* = 8,3 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,26 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 69

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 37) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-pirazol-1-il-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 69").

30 Presente compuesto 69



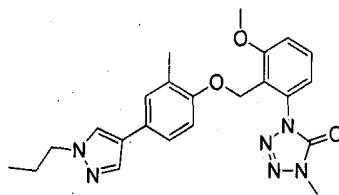
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,79 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,67 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,41 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,36 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 7,09 (1H, d, *J* = 6,0 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 5,6 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,41 (1H, t, *J* = 1,9 Hz), 5,29 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,60 (3H, d, *J* = 0,5 Hz), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 70

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-propil-1*H*-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 55) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-propil-1*H*-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 70").

45

Presente compuesto 70

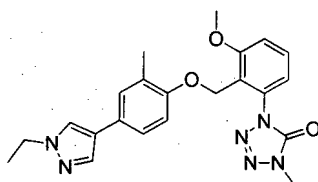


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, d, *J* = 0,7 Hz), 7,52 (1H, d, *J* = 0,7 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,22-7,17 (2H, m), 7,10-7,05 (2H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 5,26 (2H, s), 4,10-4,06 (2H, m), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,91 (2H, td, *J* = 14,5, 7,4 Hz), 0,94 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).

Ejemplo de la preparación 71

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-etil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 54) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-etil-1*H*-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 71").

15 Presente compuesto 71

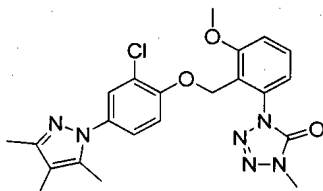


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, s), 7,53 (1H, s), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,22-7,17 (2H, m), 7,08 (2H, t, *J* = 8,4 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 5,26 (2H, s), 4,18 (2H, c, *J* = 7,3 Hz), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, d, *J* = 1,2 Hz), 2,02 (3H, s), 1,53-1,49 (3H, m).

Ejemplo de la preparación 72

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 19) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 72").

30 Presente compuesto 72



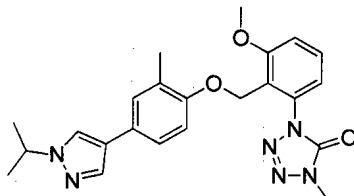
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,36 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,16 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,4 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 7,9, 0,9 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,97 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,45 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,95 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 73

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 56) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 73").

45

Presente compuesto 73

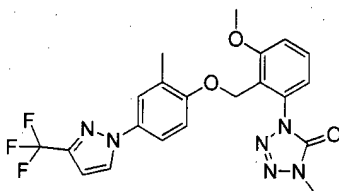


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, s), 7,56 (1H, s), 7,45 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,22-7,16 (2H, m), 7,07 (2H, dd, *J* = 7,6, 6,9 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,26 (2H, s), 4,55-4,45 (1H, m), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,53 (6H, d, *J* = 6,5 Hz).

Ejemplo de la preparación 74

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 45) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 74").

15 Presente compuesto 74

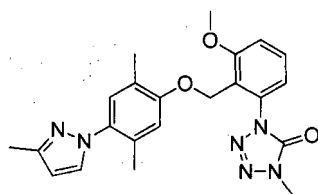


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81-7,79 (1H, m), 7,48 (1H, t, *J* = 8,3 Hz), 7,40 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,36 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,8 Hz), 7,09 (2H, t, *J* = 7,6 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,66 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 5,31 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de la preparación 75

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en Ejemplo de Preparación de Referencia 40) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-on (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 75").

30 Presente compuesto 75



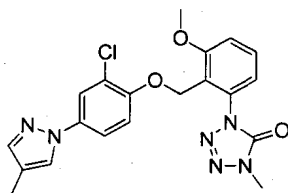
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,38 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,10-7,06 (2H, m), 7,01 (1H, s), 6,75 (1H, s), 6,15 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,27 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,34 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,95 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 76

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 44) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 76").

45

Presente compuesto 76

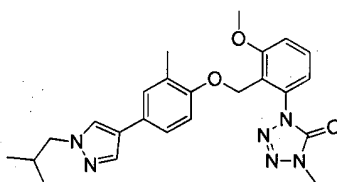


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,56 (1H, t, *J* = 0,7 Hz), 7,48-7,43 (2H, m), 7,39 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,7 Hz), 7,10 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,0 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,97 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,44 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 77

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-isobutil-1H-pirazol-4-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 58) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-isobutil-1H-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 77").

15 Presente compuesto 77

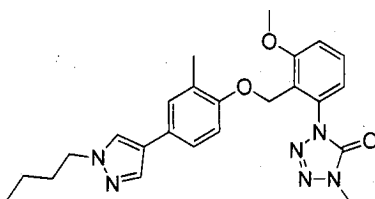


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, s), 7,50 (1H, s), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,22-7,18 (2H, m), 7,07 (2H, dd, *J* = 8,0, 7,3 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,0 Hz), 5,27 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,91 (2H, d, *J* = 7,3 Hz), 3,58 (3H, s), 2,27-2,17 (1H, m), 2,02 (3H, s), 0,93 (6H, d, *J* = 6,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 78

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-butil-1H-pirazol-4-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 57) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-butil-1H-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 78").

30 Presente compuesto 78



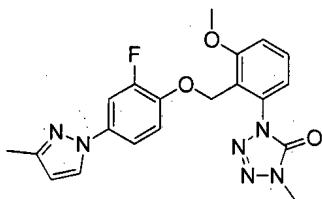
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, s), 7,51 (1H, s), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,21-7,17 (2H, m), 7,07 (2H, t, *J* = 7,9 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 5,26 (2H, s), 4,12 (2H, t, *J* = 7,2 Hz), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,90-1,83 (2H, m), 1,39-1,32 (2H, m), 0,95 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).

Ejemplo de Preparación 79

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-fluoro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 43) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-fluoro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 79").

45

Presente compuesto 79



5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, *d*, *J* = 2,4 Hz), 7,46 (1H, *t*, *J* = 8,2 Hz), 7,36 (1H, *dd*, *J* = 12,0, 2,5 Hz), 7,24-7,21 (1H, *m*), 7,09-7,05 (2H, *m*), 6,97 (1H, *t*, *J* = 8,8 Hz), 6,20 (1H, *d*, *J* = 2,4 Hz), 5,36 (2H, *s*), 3,92 (3H, *s*), 3,66 (3H, *s*), 2,34 (3H, *s*).

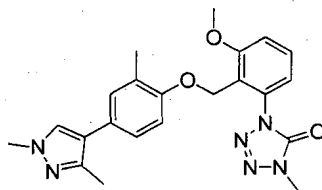
Ejemplo de Preparación 80

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 59) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 80").

15

Presente compuesto 80

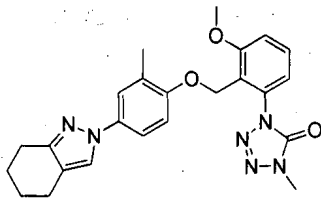


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, *t*, *J* = 8,2 Hz), 7,32 (1H, *s*), 7,12-7,05 (4H, *m*), 6,88 (1H, *d*, *J* = 8,3 Hz), 5,27 (2H, *s*), 3,93 (3H, *s*), 3,85 (3H, *s*), 3,60 (3H, *s*), 2,35 (3H, *s*), 2,02 (3H, *s*).

Ejemplo de Preparación 81

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahydro-indazol-2-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 50) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahydro-indazol-2-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 81").

30 Presente compuesto 81



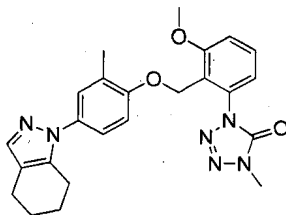
35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49 (1H, *s*), 7,48-7,44 (1H, *m*), 7,36 (1H, *d*, *J* = 2,7 Hz), 7,29 (1H, *d*, *J* = 2,9 Hz), 7,08 (2H, *dd*, *J* = 8,2, 5,0 Hz), 6,88 (1H, *d*, *J* = 8,8 Hz), 5,26 (2H, *s*), 3,92 (3H, *s*), 3,59 (3H, *s*), 2,75 (2H, *t*, *J* = 6,2 Hz), 2,60 (2H, *t*, *J* = 6,1 Hz), 2,03 (3H, *s*), 1,88-1,81 (2H, *m*), 1,80-1,74 (2H, *m*).

Ejemplo de Preparación 82

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahydro-indazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 51) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahydro-indazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 82").

45

Presente compuesto 82

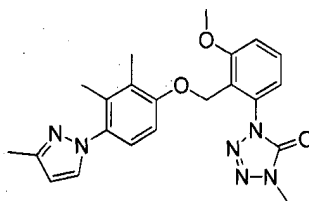


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, *t*, *J* = 8,2 Hz), 7,40 (1H, *s*), 7,21 (1H, *d*, *J* = 2,4 Hz), 7,16 (1H, *dd*, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 7,09 (2H, *dd*, *J* = 8,0, 4,4 Hz), 6,90 (1H, *d*, *J* = 8,8 Hz), 5,28 (2H, *s*), 3,93 (3H, *s*), 3,61 (3H, *s*), 2,64 (2H, *t*, *J* = 5,4 Hz), 2,57 (2H, *t*, *J* = 5,4 Hz), 2,03 (3H, *s*), 1,82-1,73 (4H, *m*).

Ejemplo de Preparación 83

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2,3-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 42) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2,3-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 83").

15 Presente compuesto 83

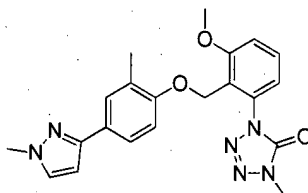


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, *t*, *J* = 8,3 Hz), 7,36 (1H, *d*, *J* = 2,2 Hz), 7,10-7,03 (3H, *m*), 6,78 (1H, *d*, *J* = 8,8 Hz), 6,15 (1H, *d*, *J* = 2,2 Hz), 5,28 (2H, *s*), 3,93 (3H, *s*), 3,62 (3H, *s*), 2,34 (3H, *s*), 1,95 (6H, *s*).

Ejemplo de Preparación 84

- 25 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 9), 0,19 g de 2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 60), 0,18 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró y después, el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar
- 30 0,29 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 84").

Presente compuesto 84



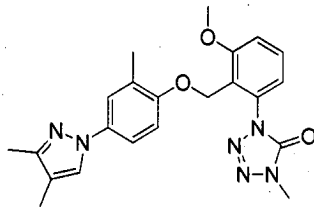
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52-7,44 (3H, *m*), 7,33 (1H, *d*, *J* = 2,2 Hz), 7,08 (2H, *dd*, *J* = 8,1, 5,7 Hz), 6,89 (1H, *d*, *J* = 8,5 Hz), 6,43 (1H, *d*, *J* = 2,2 Hz), 5,28 (2H, *s*), 3,92 (6H, *s*), 3,57 (3H, *s*), 2,03 (3H, *s*).

40 Ejemplo de Preparación 85

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 46) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente

documento, denominado como "Presente compuesto 85").

Presente compuesto 85



5

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,50 (1H, s), 7,46 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,34 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,26 (1H, dd, $J = 8,3, 3,0$ Hz), 7,08 (2H, dd, $J = 8,2, 4,3$ Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,26 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,03 (3H, s).

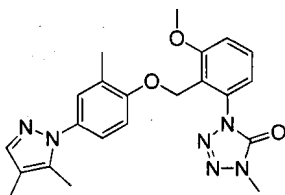
10

Ejemplo de Preparación 86

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(4,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 47) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-({3-metoxi-2-[2-metil-4-(4,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 86").

15

Presente compuesto 86



20

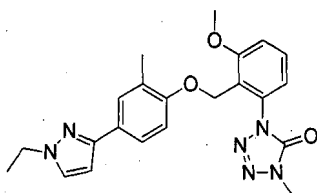
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,48 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,39 (1H, s), 7,13-7,07 (4H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,29 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,04 (3H, s), 2,03 (3H, s).

25 Ejemplo de Preparación 87

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 61) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-({3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 87").

30

Presente compuesto 87



35

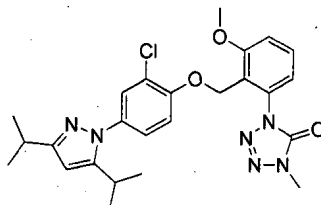
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,53-7,43 (3H, m), 7,37 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,08 (1H, d, $J = 4,1$ Hz), 7,06 (1H, d, $J = 3,7$ Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,43 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 5,28 (2H, s), 4,19 (2H, c, $J = 7,3$ Hz), 3,92 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,51 (3H, t, $J = 7,3$ Hz).

40 Ejemplo de Preparación 88

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,5-diisopropil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 25) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-({3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,5-diisopropil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 88").

45

Presente compuesto 88



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,36 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,19 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,4 Hz), 7,12 (1H, d, *J* = 7,7 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,99 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,99 (1H, s), 5,45 (2H, s), 3,95 (3H, s), 3,66 (3H, s), 3,00-2,87 (2H, m), 1,27 (6H, d, *J* = 7,0 Hz), 1,15 (6H, d, *J* = 6,8 Hz).

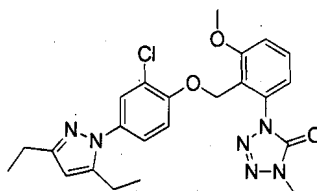
Ejemplo de Preparación 89

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,5-dietil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 24) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,5-dietil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 89").

15

Presente compuesto 89



- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,37 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,18 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,1, 0,8 Hz), 7,07 (1H, t, *J* = 4,2 Hz), 6,98 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,01 (1H, s), 5,45 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,65 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,57 (2H, c, *J* = 7,5 Hz), 1,26 (3H, t, *J* = 7,6 Hz), 1,19 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

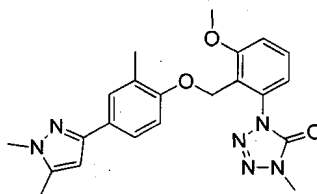
Ejemplo de Preparación 90

25

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 63) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona(en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 90").

30

Presente compuesto 90



- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,43 (3H, m), 7,07 (2H, dd, *J* = 8,2, 4,3 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,21 (1H, s), 5,27 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,79 (3H, s), 3,56 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,02 (3H, s).

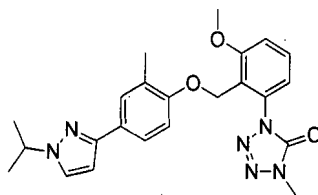
Ejemplo de Preparación 91

40

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 62) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 91").

45

Presente compuesto 91

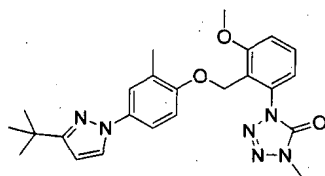


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,48 (2H, m), 7,48-7,43 (1H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,10-7,05 (2H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,42 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,28 (2H, s), 4,57-4,50 (1H, m), 3,92 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,53 (6H, d, *J* = 6,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 92

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(3-*tert*-butil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 48) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3-*tert*-butil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 92").

- 15 Presente compuesto 92

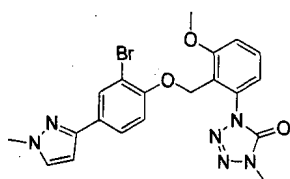


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,65 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,3 Hz), 7,37 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,32 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,8 Hz), 7,08 (2H, t, *J* = 7,6 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,25 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 5,28 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,35 (9H, s).

Ejemplo de Preparación 93

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-bromo-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 64) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-bromo-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 93").

- 30 Presente compuesto 93



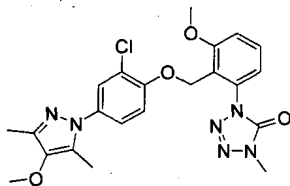
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,89 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,60 (1H, dd, *J* = 8,6, 1,8 Hz), 7,47-7,42 (1H, m), 7,34 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,11 (1H, d, *J* = 8,0 Hz), 7,06 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,41 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 5,45 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,92 (3H, s), 3,63 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 94

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 26) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 94").

- 45

Presente compuesto 94

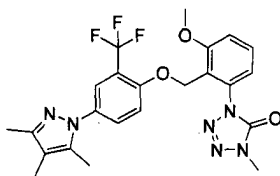


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,37 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,19-7,16 (1H, m), 7,11 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,07 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,97 (1H, t, J = 6,3 Hz), 5,45 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,76 (3H, d, J = 0,5 Hz), 3,65 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,21 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 95

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-trifluorometil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 49) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-trifluorometil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 95").

15 Presente compuesto 95

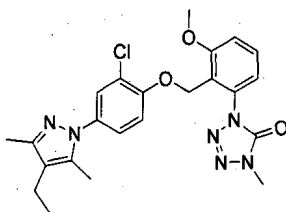


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,50-7,42 (2H, m), 7,15-7,06 (3H, m), 5,49 (2H, s), 3,95 (3H, s), 3,67 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 96

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 27) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 96").

30 Presente compuesto 96

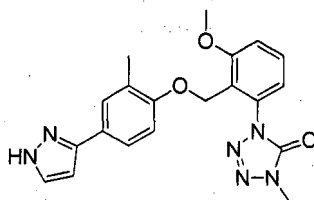


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,37 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,18 (1H, dd, J = 8,7, 2,2 Hz), 7,11 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,07 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,98 (1H, d, J = 8,7 Hz), 5,45 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,65 (3H, d, J = 0,5 Hz), 2,40 (2H, c, J = 7,5 Hz), 2,23 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,10 (3H, t, J = 7,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 97

- 40 A una mezcla de 13,4 g de 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-pheny}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 104) y 100 ml de etanol se añadieron 9 ml del hidrato de hidrazina uno (1) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante veinticuatro (24) horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para producir etanol en la mezcla de reacción aproximadamente 10 ml. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 11,7 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 97").
- 45

Presente compuesto 97



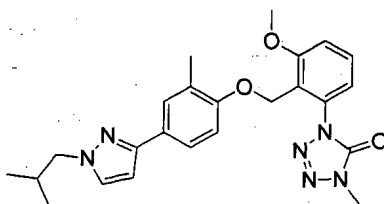
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,49-7,44 (3H, m), 7,08 (2H, dd, *J* = 8,2, 4,6 Hz), 6,93-6,89 (1H, m), 6,49 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,30 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplos de Preparación 98 y 99

- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,5 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 97) y 20 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadió 0,067 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante una media hora y se añadió a la misma 0,23 g de bromuro de isobutilo. La mezcla resultante se agitó durante siete horas y se añadió a la misma agua y después la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,27 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-isobutil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 98") y 0,06 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-isobutil-1*H*-pirazol-5-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 99").

20

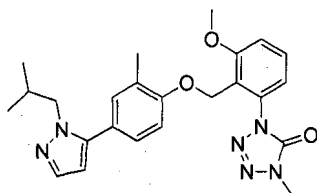
Presente compuesto 98



- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53 (1H, s), 7,50 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,33 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,07 (2H, dd, *J* = 8,1, 5,0 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,41 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 5,28 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,91 (2H, d, *J* = 7,5 Hz), 3,58 (3H, s), 2,31-2,21 (1H, m), 2,03 (3H, s), 0,92 (6H, d, *J* = 6,8 Hz).

Presente compuesto 99

30



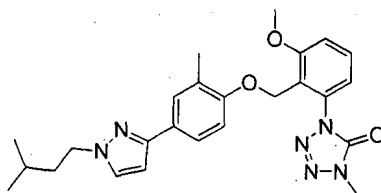
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,46 (2H, m), 7,12-7,06 (4H, m), 6,93 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,17 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 5,31 (2H, s), 3,95 (3H, s), 3,89 (2H, d, *J* = 7,2 Hz), 3,62 (3H, s), 2,20 (1H, s), 2,03 (3H, s), 0,77 (6H, d, *J* = 6,5 Hz).

35

Ejemplos de Preparación 100 y 101

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando 3-metil-butil yoduro en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-[1-(3-metil-butil)-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 100") y 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-[1-(3-metil-butil)-1*H*-pirazol-5-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 101")

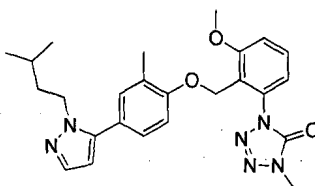
Presente compuesto 100



5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, s), 7,52-7,43 (2H, m), 7,35 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,08 (2H, dd, *J* = 8,2, 5,3 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,42 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 5,28 (2H, s), 4,17-4,13 (2H, m), 3,92 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,79 (2H, dd, *J* = 14,9, 7,1 Hz), 1,66-1,56 (1H, m), 0,96 (3H, s), 0,95 (3H, s).

Presente compuesto 101

10



EM+; 463

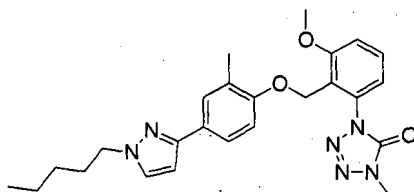
15 Ejemplos de Preparación 102 y 103

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando yodopentano en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-{3-metoxi-2-{2-metil-4-[1-(1-pentil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 102") y 1-{3-metoxi-2-{2-metil-4-[1-(1-pentil-1*H*-pirazol-5-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 103")

20

Presente compuesto 102

25



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53 (1H, s), 7,50 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,34 (1H, t, *J* = 3,3 Hz), 7,07 (2H, dd, *J* = 8,2, 5,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,42 (1H, t, *J* = 1,1 Hz), 5,28 (2H, s), 4,11 (2H, t, *J* = 7,2 Hz), 3,92 (3H, s), 3,57 (3H, d, *J* = 0,5 Hz), 2,03 (3H, s), 1,92-1,85 (2H, m), 1,40-1,26 (4H, m), 0,90 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

30

Presente compuesto 103

35

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51-7,46 (2H, m), 7,10 (4H, t, *J* = 7,8 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,17 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 5,31 (2H, s), 4,06 (2H, t, *J* = 7,4 Hz), 3,95 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,83-1,78 (2H, m), 1,29-1,18 (4H, m), 0,84 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

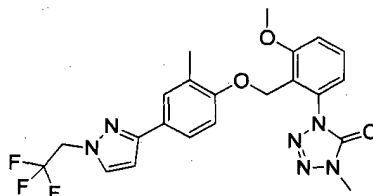
40

Ejemplo de Preparación 104

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico

en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(2-{4-{1-(2,2,2-trifluoroetil)-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil}-3-metoxi-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 104").

5 Presente compuesto 104



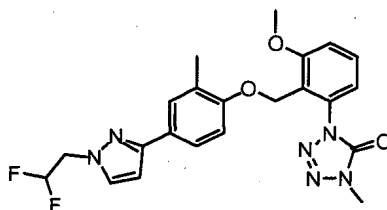
10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57-7,55 (1H, m), 7,54-7,48 (3H, m), 7,13-7,10 (2H, m), 6,94 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,59 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 5,33 (2H, s), 4,75 (2H, c, *J* = 8,5 Hz), 3,97 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 105

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando 2,2-difluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(2-{4-{1-(2,2-difluoroetil)-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil}-3-metoxi-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 105").

Presente compuesto 105

20



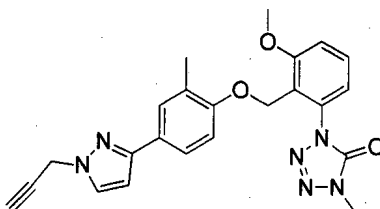
25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52-7,50 (1H, m), 7,46 (3H, dd, *J* = 13,1, 5,3 Hz), 7,10-7,06 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,50 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 6,13 (1H, tt, *J* = 55,6, 4,4 Hz), 5,30 (2H, s), 4,46 (2H, td, *J* = 13,4, 4,4 Hz), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, d, *J* = 0,7 Hz), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 106

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando 3-bromopropina en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(3-metoxi-2-{2-metil-4-{1-(2-propinil)-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil}-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 106").

Presente compuesto 106

35

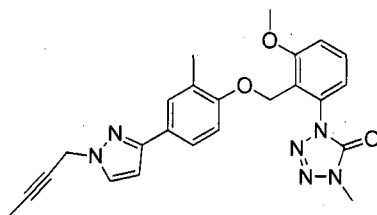


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,65-7,64 (1H, m), 7,57-7,47 (3H, m), 7,13-7,09 (2H, m), 6,93 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,53 (1H, dd, *J* = 2,3, 1,1 Hz), 5,33 (2H, s), 5,00 (2H, dd, *J* = 2,7, 0,9 Hz), 3,96 (3H, d, *J* = 0,9 Hz), 3,61 (3H, s), 2,55-2,54 (1H, m), 2,07 (3H, d, *J* = 3,7 Hz).

Ejemplo de Preparación 107

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando 1-bromo-2-butina en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(3-metoxi-2-{2-metil-4-{1-(2-butinil)-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil}-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 107").

Presente compuesto 107

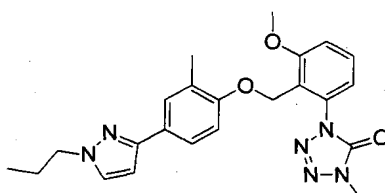


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,64 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,57 (1H, d, *J* = 1,4 Hz), 7,54 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 7,50 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,13-7,09 (2H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,51 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 5,32 (2H, s), 4,95 (2H, c, *J* = 2,4 Hz), 3,96 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,92 (3H, t, *J* = 2,4 Hz).

Ejemplo de Preparación 108

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando propil yoduro en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-propil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 108").

15 Presente compuesto 108



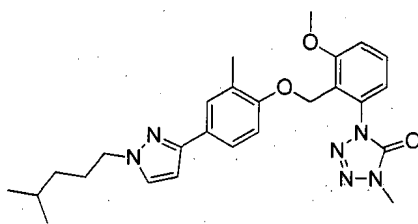
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57-7,56 (1H, m), 7,55-7,47 (2H, m), 7,39 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,14-7,09 (2H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,46 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,32 (2H, s), 4,13 (2H, t, *J* = 7,1 Hz), 3,96 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,95 (2H, td, *J* = 14,6, 7,4 Hz), 0,97 (3H, t, *J* = 7,4 Hz).

Ejemplo de Preparación 109

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando 4-metil-bromopentano en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(3-metoxi-2-[2-metil-4-[1-(4-metil-pentil)-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 109").

Presente compuesto 109

30

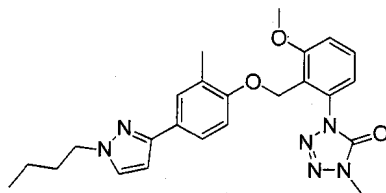


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57-7,56 (1H, m), 7,55-7,52 (1H, m), 7,49 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,39 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,14-7,09 (2H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,46 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,32 (2H, s), 4,14 (2H, t, *J* = 7,3 Hz), 3,96 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,96-1,88 (2H, m), 1,63-1,58 (1H, m), 1,27-1,21 (2H, m), 0,92 (6H, d, *J* = 6,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 110

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando butilo bromuro en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-(3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-butil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 110").

Presente compuesto 110

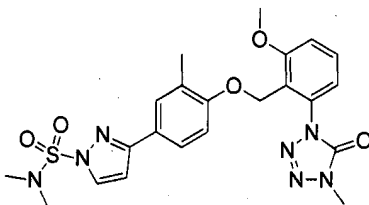


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,52 (1H, m), 7,51-7,48 (1H, m), 7,46 (1H, t, *J* = 8,1 Hz), 7,35 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,09-7,06 (2H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,42 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,28 (2H, s), 4,14-4,11 (2H, m), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,91-1,83 (2H, m), 1,38-1,30 (2H, m), 0,94 (3H, t, *J* = 7,4 Hz).

Ejemplo de Preparación 111

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando cloruro de N,N-dimetilsulfamilo en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-N,N-dimetilsulfamoi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 111").

15 Presente compuesto 111

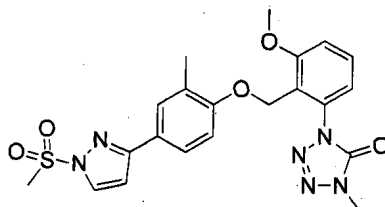


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,96 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,60-7,56 (2H, m), 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,09 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,9 Hz), 6,60 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 5,32 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,97 (6H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 112

- 25 A temperatura ambiente, a una mezcla 0,5 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 97), 0,19 g de cloruro de metanosulfonilo y 20 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 0,30 g de piridina y la mezcla resultante se agitó durante veinticuatro horas. Se añadió agua a la misma y después la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,41 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-metanosulfonil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 112").

Presente compuesto 112

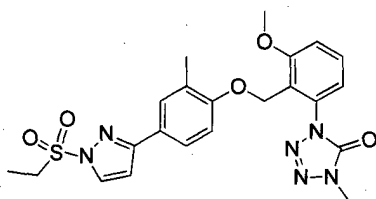


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,02 (1H, d, *J* = 2,9 Hz), 7,62 (1H, s), 7,59 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,09 (2H, t, *J* = 7,6 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,67 (1H, d, *J* = 2,9 Hz), 5,32 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,59 (3H, s), 3,35 (3H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 113

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 112 usando etanosulfonilo cloruro en lugar de cloruro de metanosulfonilo dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-etanosulfonil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 113").

Presente compuesto 113



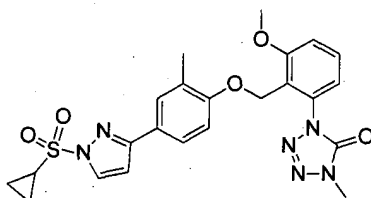
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,06 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,66-7,65 (1H, m), 7,64-7,61 (1H, m), 7,51 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,14-7,10 (2H, m), 6,95 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,70 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 5,35 (2H, s), 3,98 (3H, s), 3,63 (3H, s), 3,57 (2H, c, *J* = 7,4 Hz), 2,08 (3H, s), 1,30 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

Ejemplo de Preparación 114

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 112 usando, ciclopropanosulfonylo cloruro en lugar de cloruro de metanosulfonylo dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-ciclopropanosulfonyl-1H-pirazol-3-yl)-fenoxy]methyl}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado "Presente compuesto 114").

15 Presente compuesto 114

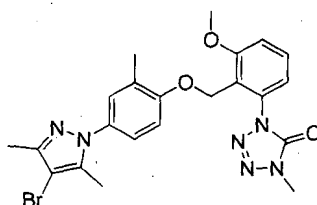


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,00 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,66-7,62 (2H, m), 7,51 (1H, t, *J* = 8,1 Hz), 7,12 (2H, t, *J* = 8,1 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,70 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 5,35 (2H, s), 3,97 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,86-2,81 (1H, m), 2,08 (3H, s), 1,54-1,49 (2H, m), 1,22-1,16 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 115

- 25 Una mezcla de 3,0 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetilpirazol-1-yl)-fenoxy]methyl}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 62), 1,33 g de N-bromosuccinimida y 100 ml de cloroformo se agitó a temperatura ambiente durante veinticuatro horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,49 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-bromo-3,5-dimetil-pirazol-1-yl)-fenoxy]methyl}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado "Presente compuesto 115").
- 30

Presente compuesto 115



35

- RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,48 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,11-7,05 (4H, m), 6,91 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,29 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,02 (3H, s).

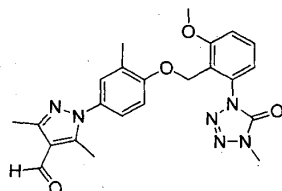
40 Ejemplo de Preparación 116

- A 0 °C, se añadieron 2,92 g de oxiclorigenato de fósforo a 100 ml de N,N-dimetilformamida y la mezcla resultante se agitó durante una hora y se añadieron a la misma 1,6 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-yl)-fenoxy]methyl}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 62). La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante dos horas y media, y después se calentó a 100 °C y se agitó durante dos horas. A temperatura ambiente, a la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de
- 45

etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,5 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 116").

5

Presente compuesto 116

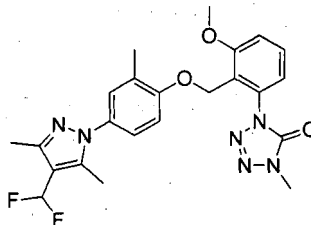


10 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 9,99 (1H, d, $J = 0,5$ Hz), 7,49 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,12-7,08 (4H, m), 6,95 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,31 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,49 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 117

15 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,5 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 116) y 10 ml de cloroformo se le añadieron 2,4 g de trifluoruro de (dietilamino)sulfuro y la mezcla resultante se agitó a 50 °C durante dos horas y media. A temperatura ambiente, a las mezclas de reacción se las añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-difluorometil-3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 117") 0,38 g.

25 Presente compuesto 117



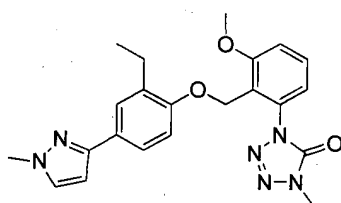
30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,48 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,11-7,05 (4H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,66 (1H, t, $J = 55,2$ Hz), 5,30 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,35 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 118

35 En atmósfera de nitrógeno, una mezcla de 0,30 g de 1-{3-metoxi-2-[2-bromo-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 93), 0,14 g de ácido etilborónico, 0,10 g de complejo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II) dicloruro de diclorometano, 0,38 g de fosfato de potasio, 5 ml de dioxano, 0,2 ml de agua se agitó con calentamiento a reflujo durante tres horas. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,22 g de 1-{3-metoxi-2-[2-etil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 118").

40

Presente compuesto 118



45

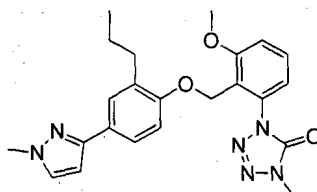
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,55 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,51 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,47 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,34 (1H, d, $J =$

2,2 Hz), 7,08 (2H, dd, $J = 8,1, 5,2$ Hz), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,44 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,25 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,91 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,44 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 1,08 (3H, t, $J = 7,5$ Hz).

Ejemplo de Preparación 119

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 118 usando ácido propilborónico en lugar de ácido etilborónico dio 1-{3-metoxi-2-[2-propil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 119").

- 10 Presente compuesto 119

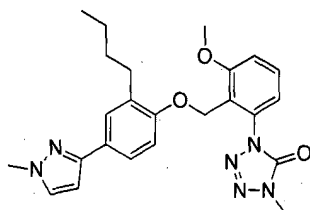


- 15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,49 (2H, m), 7,46 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,33 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,08 (1H, d, $J = 3,1$ Hz), 7,06 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 6,92 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,43 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,26 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,91 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,38 (2H, t, $J = 7,7$ Hz), 1,51-1,43 (2H, m), 0,86 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación 120

- 20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 118 usando ácido butilborónico en lugar de ácido etilborónico dio 1-{3-metoxi-2-[2-butil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 120").

- 25 Presente compuesto 120

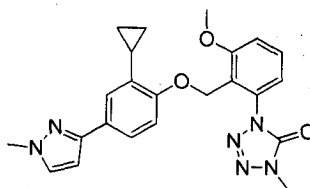


- 30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,51 (2H, m), 7,49-7,44 (1H, m), 7,33 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,07 (2H, dd, $J = 8,2, 5,1$ Hz), 6,91 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,44 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 5,25 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,91 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,40 (2H, t, $J = 7,7$ Hz), 1,48-1,40 (2H, m), 1,32-1,23 (2H, m), 0,85 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación 121

- 35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 118 usando ácido ciclopropilborónico en lugar de ácido etilborónico dio 1-{3-metoxi-2-[2-ciclopropil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 121").

- Presente compuesto 121



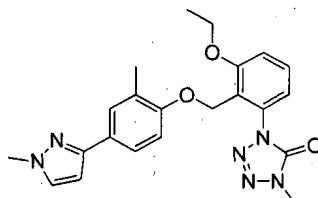
- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,48-7,44 (2H, m), 7,32 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,16 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,09 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,07 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 6,91 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,41 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 5,32 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,91 (3H, s), 3,57 (3H, s), 1,95-1,89 (1H, m), 0,84-0,81 (2H, m), 0,65-0,60 (2H, m).

- 45

Ejemplo de Preparación 122

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 60) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 122").

Presente compuesto 122

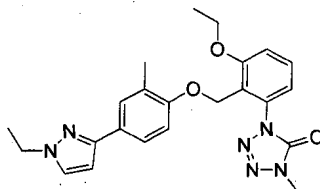


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,52 (1H, m), 7,49 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,43 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,33 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,05 (2H, dd, *J* = 8,1, 2,8 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,43 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 5,30 (2H, s), 4,14 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,45 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

Ejemplo de Preparación 123

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 61) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 123").

Presente compuesto 123

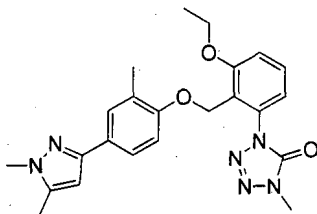


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,52 (1H, m), 7,52-7,48 (1H, m), 7,43 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,37 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,09-7,05 (1H, m), 7,04 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,43 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 5,30 (2H, s), 4,22-4,11 (4H, m), 3,58 (3H, d, *J* = 0,5 Hz), 2,03 (3H, s), 1,51 (3H, t, *J* = 7,2 Hz), 1,48-1,42 (3H, m).

Ejemplo de Preparación 124

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 63) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 124").

Presente compuesto 124

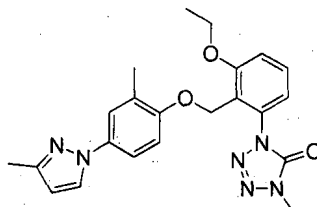


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,48 (1H, m), 7,47-7,40 (2H, m), 7,06 (1H, d, *J* = 2,9 Hz), 7,04 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,22 (1H, s), 5,29 (2H, s), 4,17-4,09 (2H, m), 3,79 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,44 (3H, t, *J* = 6,9 Hz).

Ejemplo de Preparación 125

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 36) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-,etoxi-2-[2-metil-4-(3-metil-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 125").

Presente compuesto 125

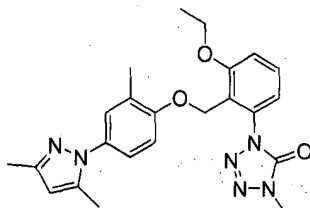


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,67 (1H, *d*, $J = 2,4$ Hz), 7,43 (1H, *t*, $J = 8,2$ Hz), 7,37 (1H, *d*, $J = 2,7$ Hz), 7,30 (1H, *dd*, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 7,06 (2H, *dd*, $J = 8,1, 3,7$ Hz), 6,92 (1H, *d*, $J = 8,7$ Hz), 6,18 (1H, *d*, $J = 2,2$ Hz), 5,30 (2H, *s*), 4,18-4,11 (2H, *m*), 3,60 (3H, *d*, $J = 0,7$ Hz), 2,36 (3H, *s*), 2,04 (3H, *s*), 1,47-1,43 (3H, *m*).

Ejemplo de Preparación 126

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 30) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 126").

Presente compuesto 126

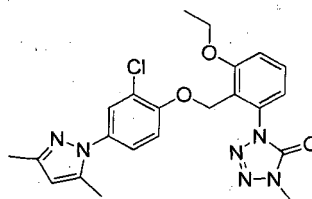


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, *t*, $J = 8,2$ Hz), 7,13-7,05 (4H, *m*), 6,93 (1H, *d*, $J = 8,5$ Hz), 5,94 (1H, *s*), 5,30 (2H, *s*), 4,15 (2H, *c*, $J = 6,9$ Hz), 3,62 (3H, *s*), 2,27 (3H, *s*), 2,23 (3H, *d*, $J = 0,5$ Hz), 2,02 (3H, *s*), 1,45 (3H, *t*, $J = 7,0$ Hz).

Ejemplo de Preparación 127

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 20) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 127").

Presente compuesto 127

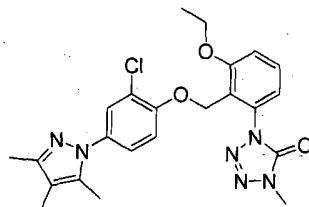


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, *t*, $J = 8,2$ Hz), 7,38 (1H, *d*, $J = 2,4$ Hz), 7,19 (1H, *dd*, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 7,11-7,08 (1H, *m*), 7,05 (1H, *d*, $J = 8,5$ Hz), 7,01 (1H, *d*, $J = 8,7$ Hz), 5,95 (1H, *s*), 5,46 (2H, *s*), 4,16 (2H, *c*, $J = 7,2$ Hz), 3,66 (3H, *s*), 2,26 (3H, *s*), 2,24 (3H, *s*), 1,47 (3H, *t*, $J = 7,0$ Hz).

Ejemplo de Preparación 128

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 19) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 128").

Presente compuesto 128

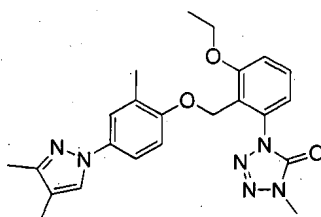


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,43 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,35 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,17 (1H, dd, $J = 8,7, 2,4$ Hz), 7,09 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,04 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 7,00 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,45 (2H, s), 4,16 (2H, c, $J = 6,8$ Hz), 3,65 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,95 (3H, s), 1,46 (3H, t, $J = 7,0$ Hz).

Ejemplo de Preparación 129

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 46) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 129").

Presente compuesto 129

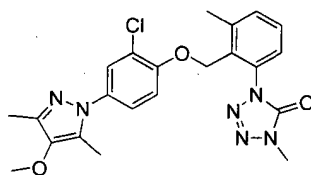


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,50 (1H, s), 7,43 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,33 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,28-7,24 (1H, m), 7,06 (2H, dd, $J = 8,3, 3,3$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,28 (2H, s), 4,14 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,59 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,05 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,45 (3H, t, $J = 6,9$ Hz).

Ejemplo de Preparación 130

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 26) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 130").

Presente compuesto 130

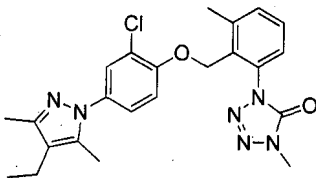


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,38 (3H, m), 7,30 (1H, dd, $J = 7,4, 1,3$ Hz), 7,21 (1H, dd, $J = 8,8, 2,6$ Hz), 6,93 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,18 (2H, s), 3,77 (3H, s), 3,68 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,23 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 131

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 27) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 131").

Presente compuesto 131

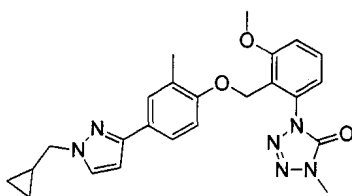


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,38 (3H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,4, 1,7 Hz), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,5 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,9 Hz), 5,18 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,40 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,24 (3H, s), 2,19 (3H, s), 1,10 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplos de Preparación 132 y 133

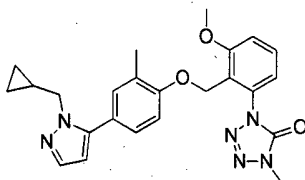
A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,60 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 97) y 10 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadió 0,080 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante una media hora y se añadió a la misma 0,27 g de bromuro de ciclopropilmetilo. La mezcla resultante se agitó a 80 °C durante diez horas y se añadió a la misma agua y después la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,52 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-ciclopropilmetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 132") y 0,06 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-ciclopropilmetil-1*H*-pirazol-5-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 133").

Presente compuesto 132



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,52 (1H, m), 7,50 (2H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,1 Hz), 7,09 (1H, d, *J* = 5,3 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 4,6 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,45 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,29 (2H, s), 4,01 (2H, d, *J* = 7,1 Hz), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,36-1,31 (1H, m), 0,68-0,63 (2H, m), 0,41-0,37 (2H, m).

Presente compuesto 133

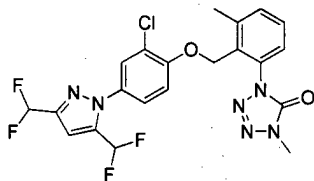


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, d, *J* = 1,8 Hz), 7,49 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,14-7,08 (4H, m), 6,93 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,19 (1H, d, *J* = 1,8 Hz), 5,31 (2H, s), 3,96 (2H, d, *J* = 6,9 Hz), 3,95 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,23-1,15 (1H, m), 0,49 (2H, dt, *J* = 6,3, 1,5 Hz), 0,21 (2H, dd, *J* = 4,9, 1,0 Hz).

Ejemplo de Preparación 134

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(3,5-bis-difluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 21) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-bis-difluorometil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 134").

Presente compuesto 134

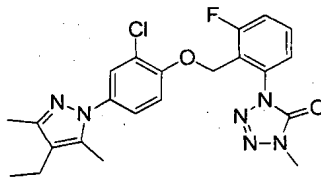


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,47-7,41 (2H, m), 7,33-7,29 (2H, m), 6,98 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,94 (1H, s), 6,73 (1H, t, *J* = 54,4 Hz), 6,61 (1H, t, *J* = 53,2 Hz), 5,23 (2H, s), 3,69 (3H, d, *J* = 10,7 Hz), 2,55 (3H, s).

15 Ejemplo de Preparación 135

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 27) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 135").

Presente compuesto 135

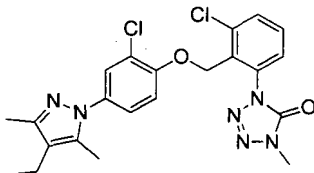


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,48 (1H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 7,38-7,36 (1H, m), 7,30-7,25 (1H, m), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,5 Hz), 6,97 (1H, d, *J* = 8,9 Hz), 5,45 (2H, d, *J* = 0,9 Hz), 3,65 (3H, s), 2,40 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,23 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,10 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

30 Ejemplo de Preparación 136

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 27) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 136").

Presente compuesto 136



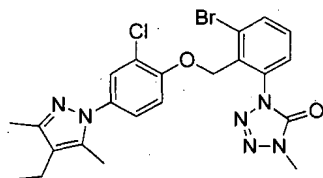
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, dd, *J* = 7,2, 2,2 Hz), 7,49-7,44 (2H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,22-7,19 (1H, m), 6,95 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,52 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,40 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,24 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,10 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

45 Ejemplo de Preparación 137

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 27) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 137").

presente documento, denominado como "Presente compuesto 137").

Presente compuesto 137



5

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,78 (1H, dd, *J* = 8,2, 1,0 Hz), 7,49-7,47 (1H, m), 7,41-7,37 (2H, m), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,51 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,40 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,24 (3H, s), 2,19 (3H, s), 1,10 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

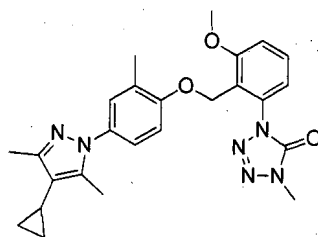
10

Ejemplo de Preparación 138

En atmósfera de nitrógeno, una a mezcla de 0,50 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-bromo-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 115), 0,13 g de ácido ciclopropilborónico, 0,07 g de bis(trifenilfosfina)paladio-dicloruro, 0,10 g de tri(*tert*-butilfosfina), 0,85 g de fosfato de potasio, 5 ml de dioxano y 0,5 ml de agua se agitó a temperatura ambiente, y después se calentó a 90 °C y se agitó tres horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,33 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-ciclopropil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 138").

20

Presente compuesto 138



25

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,13-7,05 (4H, m), 6,90-6,88 (1H, m), 5,28 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,53-1,46 (1H, m), 0,84-0,79 (2H, m), 0,51-0,47 (2H, m).

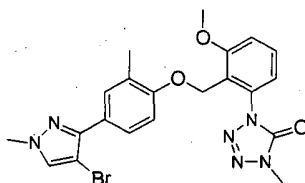
Ejemplo de Preparación 139

Una mezcla de 1,0 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 84), 0,53 g de *N*-bromosuccinimida y 15 ml de cloroformo, se agitó a temperatura ambiente durante siete horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 5 ml de agua y la mezcla resultante se separó con un embudo de decantación. La capa orgánica se deshidrato sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se filtró y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,0 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-bromo-1-metil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 139").

35

Presente compuesto 139

40



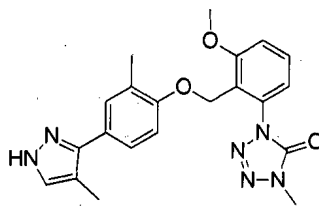
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,56 (1H, d, *J* = 1,4 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,41 (1H, s), 7,10-7,06 (2H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,29 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,90 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,04 (3H, s).

45

Ejemplo de Preparación 140

A temperatura ambiente, una mezcla de 3,9 g de 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxipheny}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 115) y 1,0 g de hidrato de hidrazina uno (1) se agitó durante ocho horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y los residuos resultantes se lavaron con hexano para dar 3,9 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 140").

10 Presente compuesto 140

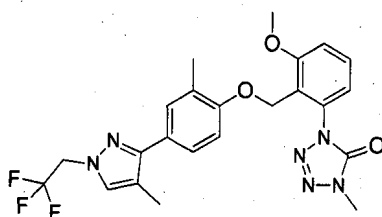


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,41 (1H, s), 7,30-7,23 (2H, m), 7,09 (2H, t, *J* = 8,1 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,0 Hz), 5,30 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 141

20 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,3 g de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 140) y 4 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 0,07 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante una hora, y se añadieron a la misma 0,23 g de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico. La mezcla resultante se calentó a 60 °C y se agitó durante cinco horas. Se añadió agua a la misma y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,3 g de 1-(2-{4-[4-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil}-3-metoxi-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 141").

30 Presente compuesto 141

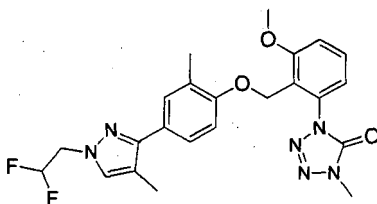


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50 (1H, t, *J* = 8,1 Hz), 7,42-7,39 (2H, m), 7,33 (1H, s), 7,12 (1H, d, *J* = 5,3 Hz), 7,10 (1H, d, *J* = 4,8 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,3 (2H, s), 4,69 (2H, c, *J* = 8,5 Hz), 3,96 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 142

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 141 usando 2,2-difluoroetil éster ácido trifluorometanosulfónico en lugar de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico dio 1-(2-{4-[4-metil-1-(2,2-difluoroetil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil}-3-metoxi-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 142").

Presente compuesto 142



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,48-7,43 (1H, m), 7,36 (2H, dd, *J* = 11,0, 2,8 Hz), 7,12-7,06 (3H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,09 (1H, tt, *J* = 55,8, 4,4 Hz), 5,29 (2H, s), 4,40 (2H, td, *J* = 13,5, 4,5 Hz), 3,93 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,04 (3H, s).

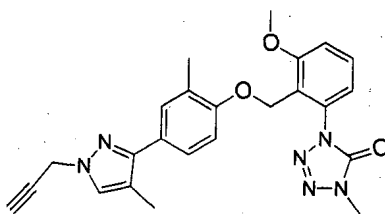
Ejemplo de Preparación 143

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 141 usando 3-bromopropina en lugar de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico dio 1-(2-{4-[4-metil-1-(2-propinil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil}-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "(Presente compuesto 143)").

15

Presente compuesto 143

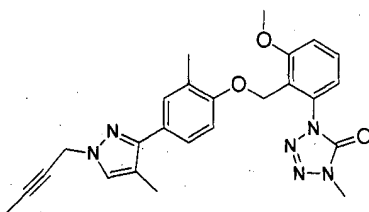


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,48-7,35 (4H, m), 7,09 (1H, d, *J* = 4,6 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 3,9 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,29 (2H, s), 4,91 (2H, d, *J* = 2,7 Hz), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, d, *J* = 0,7 Hz), 2,49-2,47 (1H, m), 2,20 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 144

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 141 usando 1-bromo-2-butina en lugar de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico dio 1-(2-{4-[4-metil-1-(2-butinil)-1*H*-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil}-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "(Presente compuesto 144)").

30 Presente compuesto 144

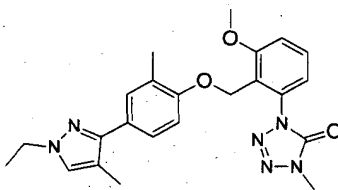


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,41-7,40 (2H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,09-7,06 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,28 (2H, s), 4,85 (2H, c, *J* = 2,4 Hz), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,88 (3H, t, *J* = 2,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 145

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 141 usando yoduro de etilo en lugar de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-etil-4-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "(Presente compuesto 145)").

Presente compuesto 145

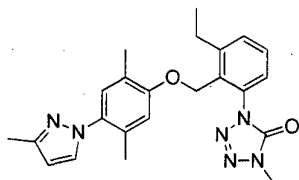


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,48-7,44 (1H, m), 7,41-7,37 (2H, m), 7,20 (1H, s), 7,09-7,06 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 4,16-4,10 (2H, m), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,48 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 146

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 40) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 146").

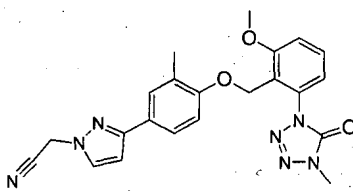
- 15 Presente compuesto 146



- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,44 (2H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,1 Hz), 7,06 (1H, s), 6,71 (1H, s), 6,17 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,06 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,35 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 147

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 98 usando bromoacetnitrilo en lugar de bromuro de isobutilo dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-cianometil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 147").



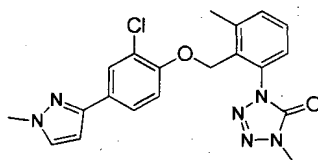
- 30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52-7,44 (4H, m), 7,10-7,06 (2H, m), 6,92-6,89 (1H, m), 6,55 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 5,30 (2H, s), 5,08 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 148

- 35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 119) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 148").

40

Presente compuesto 148

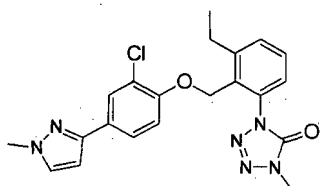


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,77 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 7,58 (1H, dd, $J = 8,5, 2,1$ Hz), 7,43-7,37 (2H, m), 7,35 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 7,29 (1H, dd, $J = 7,2, 1,9$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 6,43 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 5,18 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,54 (3H, s).

5 Ejemplo de Preparación 149

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-cloro-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 119) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-cloro-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 149").

Presente compuesto 149

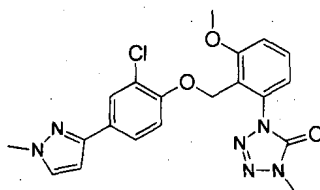


15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,77 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,58 (1H, dd, $J = 8,6, 2,1$ Hz), 7,48-7,41 (2H, m), 7,35 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,30 (1H, dd, $J = 7,5, 1,7$ Hz), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,43 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 5,20 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,87 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 1,30 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

20 Ejemplo de Preparación 150

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-cloro-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 119) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 150").

Presente compuesto 150

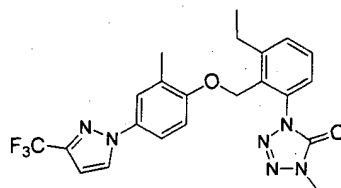


30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,73 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 7,56 (1H, dd, $J = 8,6, 2,2$ Hz), 7,46 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,35 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 7,12 (1H, dd, $J = 8,0, 0,9$ Hz), 7,07 (1H, dd, $J = 8,5, 0,7$ Hz), 6,96 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,43 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 5,46 (2H, s), 3,95 (3H, s), 3,93 (3H, s), 3,64 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación 151

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 45) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 151").

Presente compuesto 151

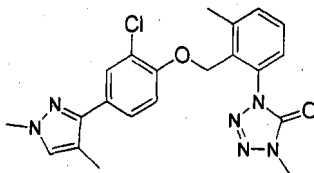


45 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,83-7,82 (1H, m), 7,51-7,45 (3H, m), 7,42-7,39 (1H, m), 7,30 (1H, dd, $J = 7,3, 1,8$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 6,68 (1H, dd, $J = 2,5, 0,5$ Hz), 5,10 (2H, s), 3,60 (3H, s), 2,85 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,14 (3H, s), 1,29 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

Ejemplo de Preparación 152

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-cloro-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 125) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 152").

Presente compuesto 152

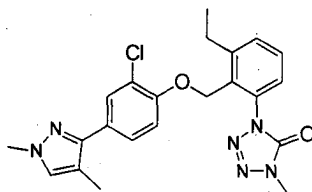


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,47 (1H, dd, *J* = 8,3, 1,8 Hz), 7,43-7,37 (2H, m), 7,30-7,28 (1H, m), 7,16 (1H, s), 6,93 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,18 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 153

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 125) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-cloro-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 153").

Presente compuesto 153

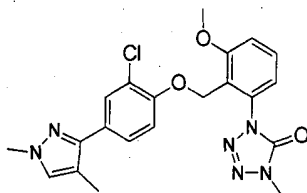


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,49-7,42 (3H, m), 7,31 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,7 Hz), 7,17 (1H, s), 6,94 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,20 (2H, s), 3,87 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,88 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,19 (3H, s), 1,30 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 154

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-cloro-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 125) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-cloro-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 154").

Presente compuesto 154

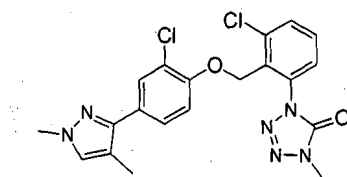


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,47-7,42 (2H, m), 7,16 (1H, s), 7,11 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 7,06 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,96 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,44 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,86 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,17 (3H, d, *J* = 0,7 Hz).

Ejemplo de Preparación 155

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-1-il)-2-cloro-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 125) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-cloro-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 155").

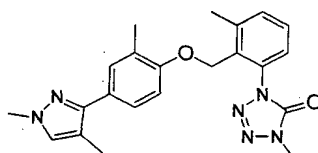
Presente compuesto 155



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,65-7,64 (1H, m), 7,60-7,58 (1H, m), 7,48-7,44 (3H, m), 7,17 (1H, s), 6,94 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,52 (2H, s), 3,86 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 156

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 124) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 156").
- 15 Presente compuesto 156



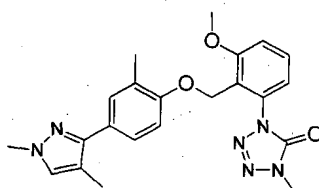
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44 (1H, d, *J* = 1,8 Hz), 7,42-7,38 (3H, m), 7,28-7,26 (1H, m), 7,16 (1H, s), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 3,86 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 157

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 124) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 157").

Presente compuesto 157

30

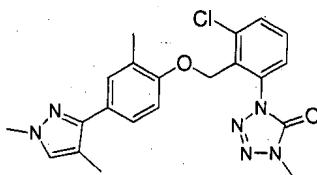


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,40 (1H, dd, *J* = 2,1, 0,7 Hz), 7,36 (1H, ddd, *J* = 8,5, 2,3, 0,5 Hz), 7,15 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 7,09-7,05 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,86 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,18 (3H, d, *J* = 0,7 Hz), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 158

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 124) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-(3-cloro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 158").

Presente compuesto 158

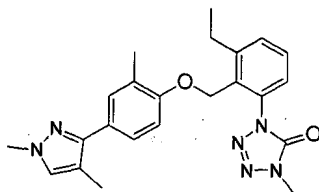


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,1 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,43-7,38 (3H, m), 7,17 (1H, s), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,35 (2H, s), 3,87 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 159

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 124) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 159").

15 Presente compuesto 159

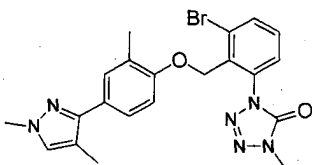


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,44 (3H, m), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 7,17 (1H, s), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,88 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,86 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,20 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,29 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 160

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 124) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 160").

30 Presente compuesto 160

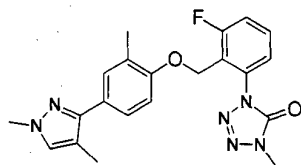


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,82-7,79 (1H, m), 7,45-7,37 (4H, m), 7,17 (1H, s), 6,88 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,34 (2H, s), 3,87 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,08 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 161

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 124) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 161").

Presente compuesto 161

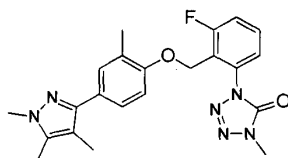


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,47 (1H, m), 7,42 (1H, s), 7,39 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,32 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 7,29-7,27 (1H, m), 7,16 (1H, s), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,30 (2H, s), 3,87 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 162

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 131) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 162").

- 15 Presente compuesto 162

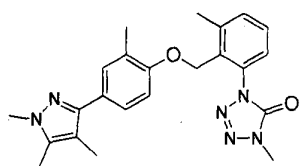


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50 (1H, td, *J* = 8,2, 5,8 Hz), 7,38 (1H, s), 7,37-7,31 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,30 (2H, s), 3,79 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 163

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 131) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 163").

- 30 Presente compuesto 163

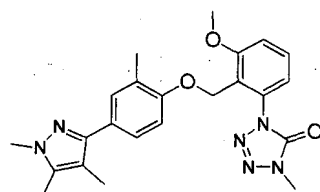


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,48-8,44 (3H, m), 8,41 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 8,31 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,9 Hz), 7,91 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,10 (2H, s), 4,83 (3H, s), 4,66 (3H, s), 3,55 (3H, s), 3,24 (3H, s), 3,16 (3H, s), 3,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 164

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 131) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoxy]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 164").

Presente compuesto 164



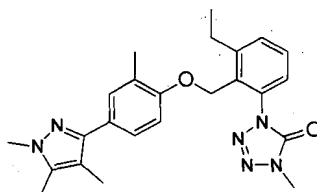
- 45

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,37 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,33 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 7,09 (1H, d, *J* = 3,2 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,28 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,79 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,09 (3H, s), 2,03 (3H, s).

5 Ejemplo de Preparación 165

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 131) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 165").

Presente compuesto 165

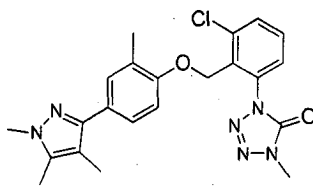


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,43 (2H, m), 7,41-7,40 (1H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,21 (3H, s), 2,11 (6H, s), 1,27 (3H, c, *J* = 7,7 Hz).

20 Ejemplo de Preparación 166

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 131) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 166").

Presente compuesto 166

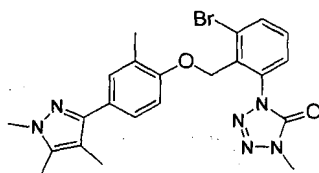


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41-7,39 (2H, m), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,34 (2H, s), 3,79 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,05 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación 167

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 131) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 167").

Presente compuesto 167

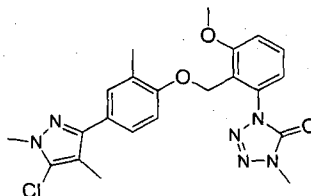


45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,44 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,40-7,38 (2H, m), 7,36 (1H, dd, *J* = 8,1, 2,4 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,33 (2H, s), 3,79 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 168

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 168").

Presente compuesto 168



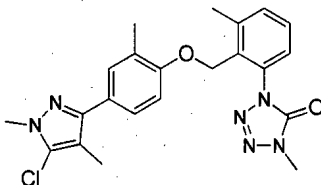
10

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,40-7,39 (1H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,3 Hz), 7,13-7,09 (2H, m), 6,94 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,32 (2H, s), 3,96 (3H, s), 3,87 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,06 (3H, s).

15 Ejemplo de Preparación 169

Una mezcla de 3,1 g de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 14), 2,7 g de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140), 1,95 g de carbonato de potasio y 70 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró, y después, el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 169").

25 Presente compuesto 169



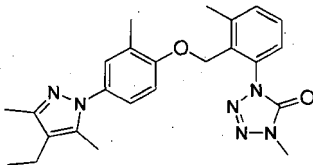
30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (3H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,1 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,4 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 170

35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 128) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 170").

Presente compuesto 170

40

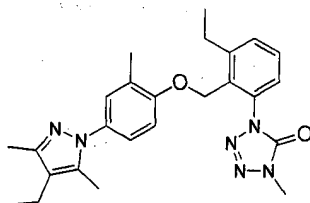


45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,4 Hz), 7,17 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,12 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,05 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,41 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,25 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,11 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 171

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 128) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 171").

Presente compuesto 171

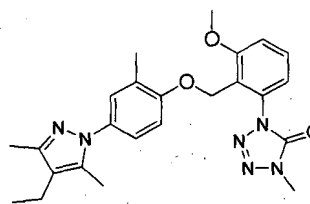


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,44 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,9 Hz), 7,17-7,16 (1H, m), 7,12 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,07 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,41 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,25 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz), 1,11 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 172

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 128) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 172").

Presente compuesto 172

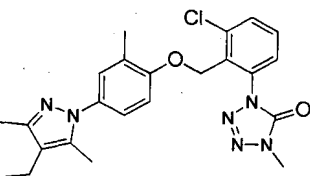


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,12-7,07 (4H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,40 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,24 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,01 (3H, s), 1,11 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 173

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 128) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 173").

Presente compuesto 173



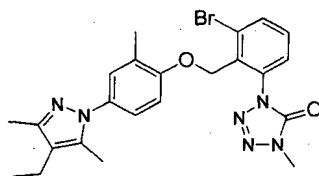
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,1, 1,3 Hz), 7,48 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,15 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,33 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,41 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,25 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,11 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 174

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el

Ejemplo de Preparación de Referencia 128) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 174").

5 Presente compuesto 174

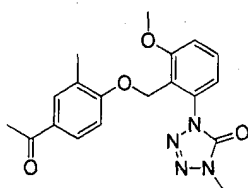


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,4 Hz), 7,46-7,38 (2H, m), 7,16 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,5 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,32 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,41 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,25 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,11 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 175

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 1-(4-hidroxi-3-metil)-etanona en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 175").

20 Presente compuesto 175

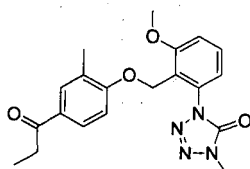


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,76 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,2 Hz), 7,70 (1H, d, *J* = 1,2 Hz), 7,48 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,09 (2H, dd, *J* = 11,7, 4,5 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,35 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 176

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 114) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-propionil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 176").

Presente compuesto 176



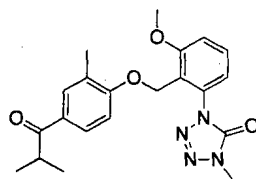
35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,77 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,3 Hz), 7,71 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,48 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,09 (2H, t, *J* = 8,1 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,34 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,92 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 2,02 (3H, s), 1,19 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

40

Ejemplo de Preparación 177

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-2-metil-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 152) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-isobutil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 177").

Presente compuesto 177

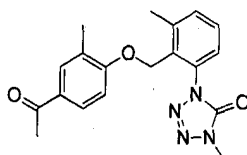


5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,77 (1H, dd, J = 8,69, 2,29 Hz), 7,73-7,70 (1H, m), 7,48 (1H, t, J = 8,21 Hz), 7,12-7,06 (2H, m), 6,91 (1H, d, J = 8,69 Hz), 5,34 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,59 (3H, s), 3,54-3,46 (1H, m), 2,02 (3H, s), 1,18 (6H, d, J = 6,76 Hz).

Ejemplo de Preparación 178

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-etanol en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 178").

15 Presente compuesto 178



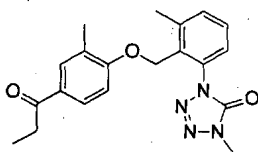
20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,79 (1H, dd, J = 8,54, 2,24 Hz), 7,75 (1H, d, J = 1,46 Hz), 7,46-7,40 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,32, 1,95 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,54 Hz), 5,11 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 179

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 114) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 179").

Presente compuesto 179

30

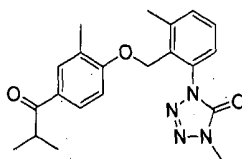


35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,80 (1H, d, J = 8,47 Hz), 7,77-7,74 (1H, m), 7,47-7,39 (2H, m), 7,29 (1H, d, J = 7,33 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,47 Hz), 5,11 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,94 (2H, c, J = 7,33 Hz), 2,50 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,20 (3H, t, J = 7,33 Hz).

Ejemplo de Preparación 180

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-2-metil-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 152) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-isobutiril-2-metil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 180").

Presente compuesto 180

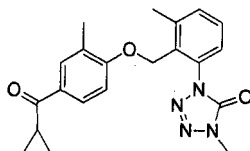


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, d, J = 8,70 Hz), 7,78-7,75 (1H, m), 7,47-7,39 (2H, m), 7,30-7,29 (1H, m), 6,88 (1H, d, J = 8,70 Hz), 5,12 (2H, s), 3,63 (3H, s), 3,55-3,48 (1H, m), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,20 (6H, d, J = 6,87 Hz).

Ejemplo de Preparación 181

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 150) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-ciclopropanocarbonil-2-metil-fenoximetil]-3-metilfenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 181").

- 15 Presente compuesto 181

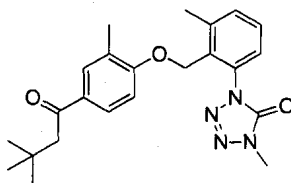


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,88 (1H, dd, J = 8,47, 2,06 Hz), 7,83-7,80 (1H, m), 7,47-7,41 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,21, 1,72 Hz), 6,89 (1H, d, J = 8,47 Hz), 5,12 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,65-2,61 (1H, m), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,22-1,18 (2H, m), 1,02-0,96 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 182

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-3,3-dimetil-butano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 151) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-[4-(3,3-dimetil-butiril)-2-metil-fenoximetil]-3-metilfenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 182").

- 30 Presente compuesto 182

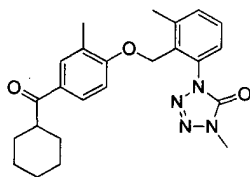


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,77 (1H, dd, J = 8,47, 2,06 Hz), 7,75-7,73 (1H, m), 7,47-7,39 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,21, 1,72 Hz), 6,85 (1H, d, J = 8,47 Hz), 5,10 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,79 (2H, s), 2,50 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,05 (9H, s).

Ejemplo de Preparación 183

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando ciclohexil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-ciclohexanocarbonil-2-metil-fenoximetil]-3-metilfenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 183").

Presente compuesto 183

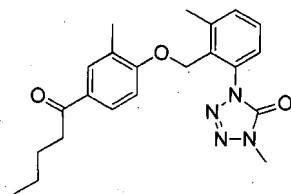


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,79 (1H, dd, J = 8,45, 2,29 Hz), 7,75-7,72 (1H, m), 7,46-7,36 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,24, 1,93 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,45 Hz), 5,11 (2H, s), 3,62 (3H, s), 3,24-3,18 (1H, m), 2,50 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,89-1,79 (4H, m), 1,77-1,66 (2H, m), 1,54-1,29 (4H, m).

Ejemplo de Preparación 184

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-pentano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 154) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(2-metil-4-pentanoil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 184").

- 15 Presente compuesto 184

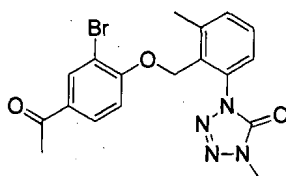


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, dd, J = 8,47, 2,06 Hz), 7,76-7,74 (1H, m), 7,47-7,39 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,21, 1,72 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,47 Hz), 5,10 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,89 (2H, t, J = 7,44 Hz), 2,50 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,73-1,66 (2H, m), 1,45-1,34 (2H, m), 0,94 (3H, t, J = 7,33 Hz)

Ejemplo de Preparación 185

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(3-bromo-4-hidroxi-fenil)-etanon (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 149) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(2-bromo-4-acetil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 185").

- 30 Presente compuesto 185

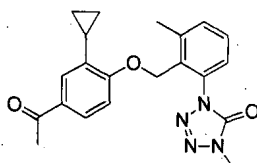


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,13 (1H, d, J = 2,17 Hz), 7,86 (1H, dd, J = 8,69, 2,17 Hz), 7,47-7,38 (2H, m), 7,33-7,30 (1H, m), 6,90 (1H, d, J = 8,69 Hz), 5,24 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,55-2,53 (6H, m).

Ejemplo de Preparación 186

- 40 Una mezcla de 0,4 g de 1-[2-(4-acetil-2-bromo-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 185), 0,1 g de ácido ciclopropilborónico, 0,08 g de complejo [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) dicloruro de diclorometano, 0,3 g de fluoruro de cesio y 5 ml de 1,4-dioxano se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-[2-(2-ciclopropil-4-acetil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 186").
- 45

Presente compuesto 186

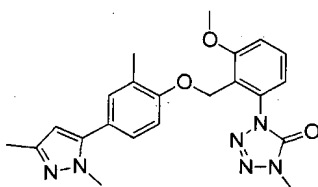


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,76 (1H, dd, J = 8,69, 2,17 Hz), 7,46-7,40 (3H, m), 7,30 (1H, dd, J = 7,24, 1,93 Hz), 6,89 (1H, d, J = 8,69 Hz), 5,16 (2H, s), 3,63 (3H, s), 3,53-3,45 (1H, m), 2,52 (3H, s), 1,19 (3H, s), 0,90-0,84 (2H, m), 0,65-0,60 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 187

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2-metil-4-(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 134) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[2-metil-4-(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)-fenoxi]metil}-3-metoxi-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 187").

- 15 Presente compuesto 187

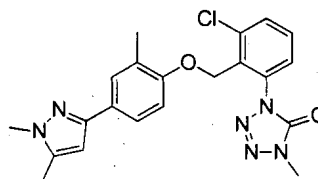


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,48 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,13-7,07 (4H, m), 6,92 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,99 (1H, s), 5,30 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,78 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 188

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 63) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxi]metil}-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 188").

- 30 Presente compuesto 188



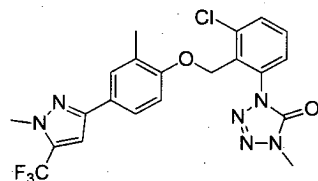
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, dd, J = 8,0, 1,1 Hz), 7,52-7,51 (1H, m), 7,49-7,44 (2H, m), 7,40 (1H, dd, J = 8,0, 1,4 Hz), 6,85 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,23 (1H, d, J = 0,7 Hz), 5,33 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,28 (3H, d, J = 2,5 Hz), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 189

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 158) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenoxi]metil}-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 189").

- 45

Presente compuesto 189

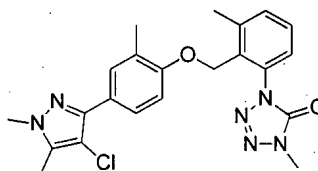


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,52-7,49 (2H, m), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,40 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,80 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 5,34 (2H, s), 4,00 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 190

- 10 Una mezcla de 0,47 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 47), 0,17 g de *N*-clorosuccinimida y 10 ml de cloroformo se agitó a temperatura ambiente durante doce horas. La mezcla de reacción se extrajo con cloroformo y se lavó con una solución salina saturada, y la capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,34 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-cloro-1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 190").

Presente compuesto 190

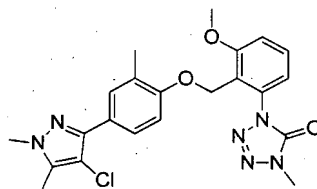


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,61-7,60 (1H, m), 7,44-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 3,82 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,13 (3H, s).

25 Ejemplo de Preparación 191

- Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 90) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 47) dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(4-cloro-1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 191").

Presente compuesto 191

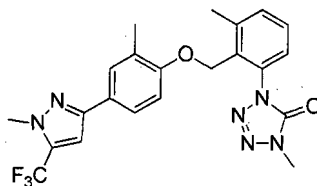


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,63 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,57-7,56 (1H, m), 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,09-7,06 (2H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,29 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,81 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,03 (3H, s).

40 Ejemplo de Preparación 192

- Una mezcla de 0,3 g de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 14), 0,28 g de 2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol, 0,2 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 192") 0,32 g.

Presente compuesto 192



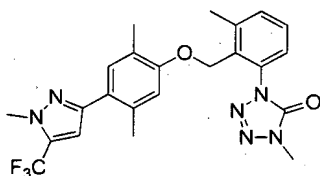
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,54 (1H, m), 7,51 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,45-7,40 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,4 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,80 (1H, s), 5,07 (2H, s), 4,01 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 193

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 192 usando 2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 163) en lugar de 2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 158) dio 1-{3-metil-2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 193") 0,32 g.

15

Presente compuesto 193



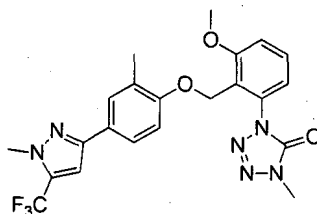
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,29-7,26 (2H, m), 6,71 (1H, s), 6,68 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 5,06 (2H, s), 4,02 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,08 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 194

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 192 usando 1-(2-bromometil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 90) en lugar de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 14) dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 194").

30

Presente compuesto 194



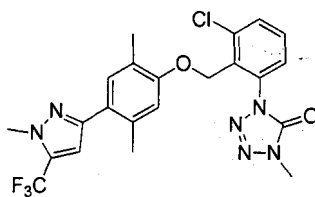
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49 (2H, s), 7,47 (1H, s), 7,10-7,06 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,0 Hz), 6,78 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 5,29 (2H, s), 4,00 (3H, s), 3,93 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 195

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 163) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)fenol dio 1-{3-cloro-2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 195").

45

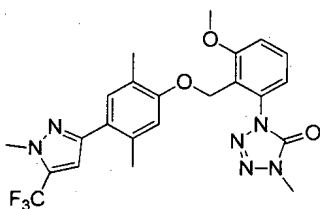
Presente compuesto 195



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,40 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,4 Hz), 7,26 (1H, s), 6,73 (1H, s), 6,67 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 5,33 (2H, s), 4,02 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,41 (3H, s), 2,01 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 196

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 163) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 196").
- 15 Presente compuesto 196



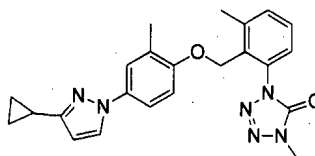
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,23 (1H, s), 7,10-7,06 (2H, m), 6,76 (1H, s), 6,66 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 5,28 (2H, s), 4,01 (3H, d, *J* = 0,7 Hz), 3,94 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,39 (3H, s), 1,97 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 197

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3-ciclopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 133) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-fenoximetil]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 197").

Presente compuesto 197

30



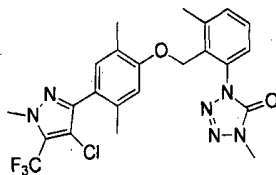
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,45-7,39 (3H, m), 7,33 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,6 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,3 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 6,05 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,05 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s), 2,06-1,99 (1H, m), 0,98-0,93 (2H, m), 0,80-0,76 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 198

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando 1-{3-metil-2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 193) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 47) dio 1-{3-metil-2-[2,5-dimetil-4-(4-cloro-1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 198").

45

Presente compuesto 198

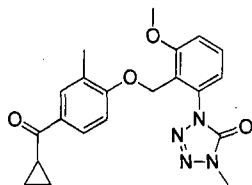


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,41 (2H, d, *J* = 5,3 Hz), 7,20 (1H, t, *J* = 4,6 Hz), 7,11 (1H, s), 6,66 (1H, s), 5,12 (2H, s), 4,03 (3H, s), 3,67 (3H, s), 2,64 (3H, s), 2,38 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 199

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 150) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-ciclopropanocarbonil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 199").

15 Presente compuesto 199

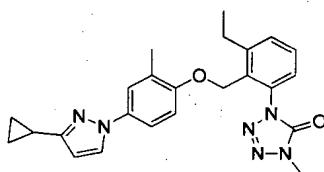


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,84 (1H, dd, *J* = 8,70, 2,18 Hz), 7,78-7,76 (1H, m), 7,48 (1H, t, *J* = 8,13 Hz), 7,12-7,06 (2H, m), 6,93 (1H, d, *J* = 8,70 Hz), 5,35 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,65-2,58 (1H, m), 2,03 (3H, s), 1,20-1,16 (2H, m), 1,00-0,94 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 200

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-metil-4-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 133) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 200").

30 Presente compuesto 200



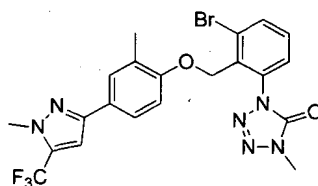
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 7,50-7,45 (2H, m), 7,44-7,41 (1H, m), 7,34 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,6 Hz), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,9 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 6,06 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,07 (2H, s), 3,60 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,11 (3H, s), 2,05-2,01 (1H, m), 1,28 (3H, t, *J* = 7,8 Hz), 0,98-0,94 (2H, m), 0,80-0,76 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 201

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 192 usando 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 5) en lugar de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 14) dio 1-(3-bromo-2-[2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 201") 0,32 g.

45

Presente compuesto 201

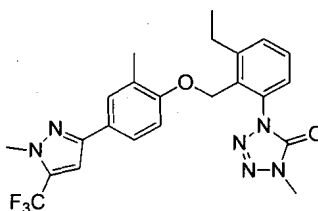


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,4 Hz), 7,52-7,49 (2H, m), 7,46-7,38 (2H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,80 (1H, s), 5,33 (2H, s), 4,01 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,08 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 202

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 192 usando 1-(2-bromometil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 17) en lugar de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 14) dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 202").

- 15 Presente compuesto 202

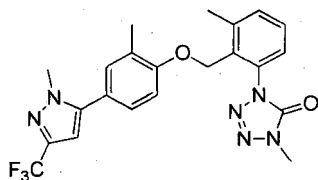


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,50 (2H, m), 7,48-7,43 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,1 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,80 (1H, s), 5,09 (2H, s), 4,01 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 203

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(1-metil-3-trifluorometil-1*H*-pirazol-5-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 164) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1-metil-3-trifluorometil-1*H*-pirazol-5-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 203").

- 30 Presente compuesto 203

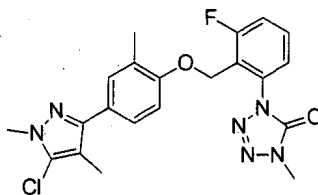


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47-7,42 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,3 Hz), 7,18 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,15-7,15 (1H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,47 (1H, s), 5,09 (2H, s), 3,90 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 204

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 204").

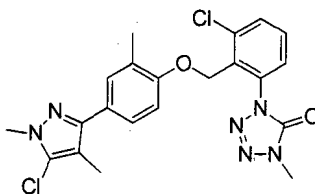
Presente compuesto 204



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,48 (1H, m), 7,38-7,27 (4H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,30 (2H, d, *J* = 0,7 Hz), 3,85 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 205

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 205").
- 15 Presente compuesto 205



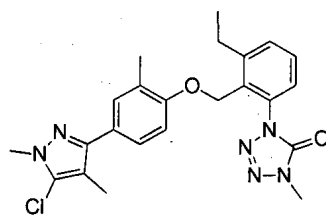
- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41-7,39 (2H, m), 7,36 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,35 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 206

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "(Presente compuesto 206)").

Presente compuesto 206

30

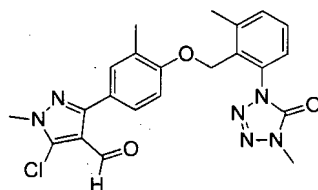


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,44 (2H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,39-7,36 (1H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,1 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,08 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,15 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,7 Hz).

Ejemplo de Preparación 207

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(5-cloro-4-formil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 172) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-cloro-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 207").

Presente compuesto 207

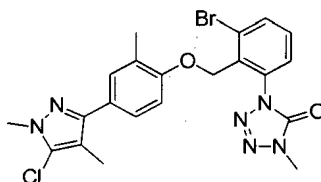


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,92 (1H, d, *J* = 0,5 Hz), 7,53 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,49 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,45-7,40 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,9, 2,3 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 208

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 208").

15 Presente compuesto 208

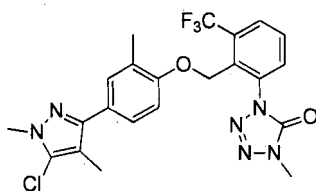


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, dd, *J* = 7,9, 1,5 Hz), 7,45-7,35 (4H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,33 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 209

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 6 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-3-trifluorometil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 209").

30 Presente compuesto 209

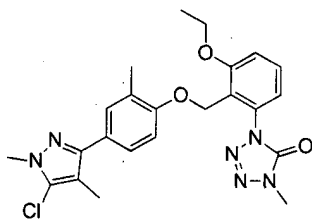


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,92 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 7,71-7,66 (2H, m), 7,40-7,35 (2H, m), 6,88-6,86 (1H, m), 5,33 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,53 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 210

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 8 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etoxi-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 210").

Presente compuesto 210

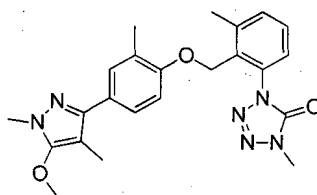


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,37-7,37 (1H, m), 7,36-7,33 (1H, m), 7,08 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,06 (1H, d, *J* = 2,1 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,32 (2H, s), 4,15 (2H, c, *J* = 7,0 Hz), 3,86 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,04 (3H, s), 1,46 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

Ejemplo de Preparación 211

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 211").

15 Presente compuesto 211

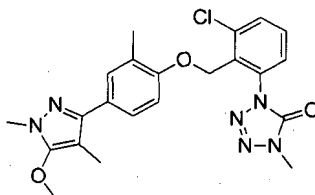


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,39 (3H, m), 7,36 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,29-7,26 (1H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 212

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 212").

30 Presente compuesto 212

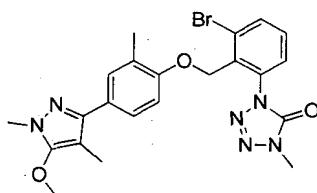


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,2 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41-7,39 (2H, m), 7,34 (1H, dd, *J* = 8,5, 1,9 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,34 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 213

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 213").

Presente compuesto 213

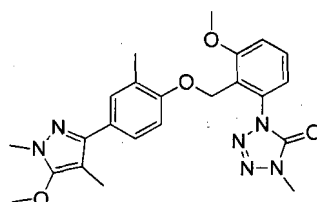


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,0 Hz), 7,45-7,33 (4H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,33 (2H, s), 3,93 (3H, d, *J* = 0,5 Hz), 3,70 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,13 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 214

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 214").

15 Presente compuesto 214

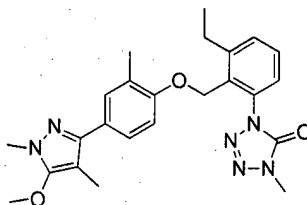


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, s), 7,34 (1H, s), 7,31 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,07 (1H, d, *J* = 4,4 Hz), 7,05 (1H, d, *J* = 3,9 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,26 (2H, s), 3,91 (3H, s), 3,90 (3H, s), 3,68 (3H, s), 3,56 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,01 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 215

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 215").

30 Presente compuesto 215

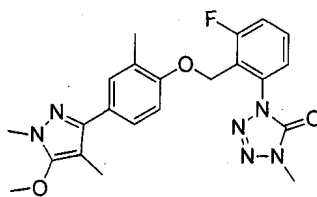


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,43 (2H, m), 7,41-7,40 (1H, m), 7,36 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,13 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,27 (3H, c, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 216

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 216").

Presente compuesto 216



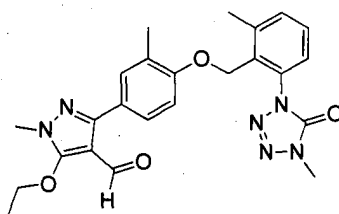
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, td, *J* = 8,2, 5,9 Hz), 7,39 (1H, d, *J* = 1,4 Hz), 7,37-7,28 (3H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,31 (2H, d, *J* = 0,9 Hz), 3,94 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 217

- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,9 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-cloro-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 207) y 10 ml de tetrahidrofurano se le añadió una solución al 20 % de etóxido de sodio de sodio en 0,81 g de etanol y la mezcla resultante se agitó durante tres horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 10 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-etoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 217") 0,7 g.

Presente compuesto 217

20



- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,73 (1H, s), 7,45-7,36 (4H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,9, 2,5 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,9 Hz), 5,08 (2H, s), 4,63 (2H, c, *J* = 6,9 Hz), 3,72 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,44 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

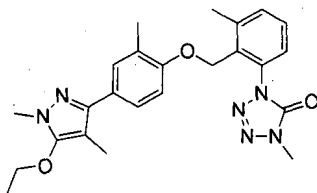
25

Ejemplo de Preparación 218

- 30 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,7 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-etoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 217) y 20 ml de ácido trifluoroacético se le añadieron 0,5 g de trietilsilano y la mezcla resultante se agitó durante quince horas. El disolvente se retiró por destilación a presión reducida. Al residuo se le añadieron 10 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 218") 0,6 g.

35

Presente compuesto 218



40

- RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,39 (3H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 7,29-7,27 (1H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 4,17-4,12 (2H, m), 3,71 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,41 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

Ejemplo de Preparación 219

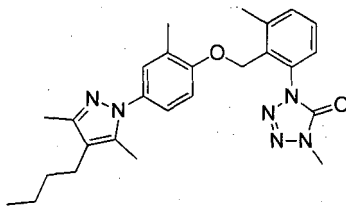
45

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(4-butil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 204) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-

[2-metil-4-(4-butiril-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 219").

Presente compuesto 219

5



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,9, 2,1 Hz), 7,17 (1H, dd, *J* = 2,6, 0,8 Hz), 7,13-7,10 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,05 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,37 (2H, t, *J* = 7,6 Hz), 2,24 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,48-1,42 (2H, m), 1,38-1,33 (2H, m), 0,94 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

10

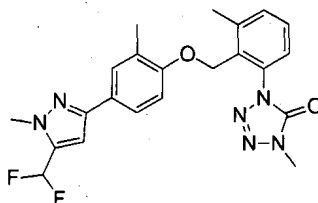
Ejemplo de Preparación 220

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(5-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 201) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 220").

15

Presente compuesto 220

20



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54-7,54 (1H, m), 7,51 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,1 Hz), 7,45-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,74 (1H, t, *J* = 53,8 Hz), 6,67-6,66 (1H, m), 5,06 (2H, s), 4,00 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

25

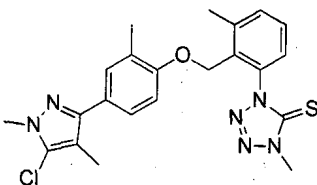
Ejemplo de Preparación 221

A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,36 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 169) y 10 ml de tolueno se le añadieron 0,5 g de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiofosfetano-2,4-disulfuro y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante siete horas. Se añadieron a la misma 5 ml de agua a temperatura ambiente y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 221").

30

35

Presente compuesto 221



40

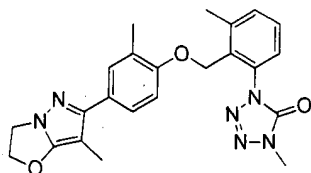
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,47 (2H, m), 7,40-7,40 (1H, m), 7,3 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,29-7,27 (1H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,97 (2H, s), 3,91 (3H, d, *J* = 0,5 Hz), 3,85 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,13 (3H, s).

45

Ejemplo de Preparación 222

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol-6-il)-2-metil-fenol en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-4-{3-metil-2-[2-metil-4-(7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol-6-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 222").

Presente compuesto 222

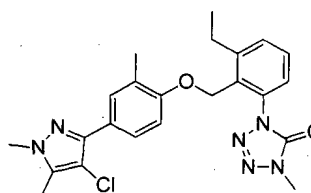


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,38 (4H, m), 7,29-7,24 (1H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 5,01 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 4,30 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,06 (3H, s).

15 Ejemplo de Preparación 223

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 59) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 47) dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(4-cloro-1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 223").

Presente compuesto 223

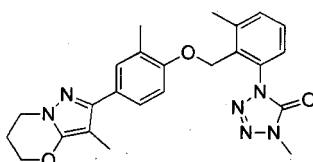


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 7,61 (1H, s), 7,49-7,43 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,1 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,82 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,28 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 224

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-metil-4-(3-metil-6,7-dihidro-5*H*-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazina-2-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación 197) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-metil-4-{3-metil-2-[2-metil-4-(3-metil-6,7-dihidro-5*H*-pirazolo [5,1-b][1,3]oxazina-2-il)-fenoximetil]-fenil}-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 224").

Presente compuesto 224



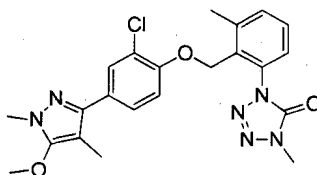
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,38 (4H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 4,30 (2H, t, *J* = 5,1 Hz), 4,19 (2H, t, *J* = 6,3 Hz), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,29-2,24 (2H, m), 2,12 (3H, s), 2,03 (3H, s).

45 Ejemplo de Preparación 225

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2-cloro-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 188) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo

sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 2251").

Presente compuesto 225



5

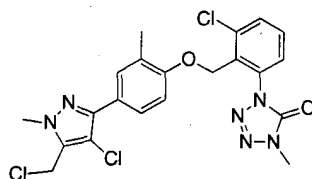
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,44-7,38 (3H, m), 7,31-7,28 (1H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,18 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,66 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,12 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación 226

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 188) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-clorometil-4-cloro-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 226").

15

Presente compuesto 226



20

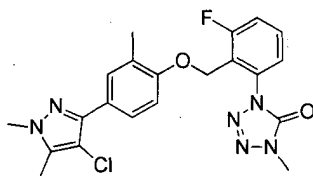
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66-7,61 (2H, m), 7,59 (1H, dd, *J* = 2,2, 0,8 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,36 (2H, s), 4,65 (2H, s), 3,95 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,07 (3H, s).

25 Ejemplo de Preparación 227

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 237) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(4-cloro-1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 227").

30

Presente compuesto 227



35

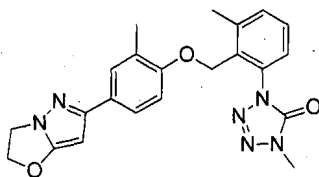
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,65 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,3 Hz), 7,58 (1H, dd, *J* = 1,6, 0,7 Hz), 7,53-7,48 (1H, m), 7,30 (2H, dd, *J* = 17,1, 7,9 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,31 (2H, s), 3,81 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,03 (3H, s).

40 Ejemplo de Preparación 228

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(2,3-dihidro-pirazolo[5,1-*b*]oxazol-6-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 191) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-metil-4-{3-metil-2-[2-metil-4-(2,3-dihidro-pirazolo[5,1-*b*]oxazol-6-il)-fenoximetil]-fenil}-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 228").

45

Presente compuesto 228

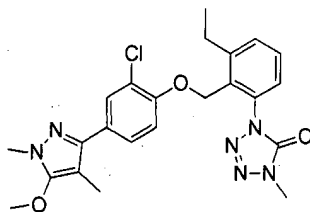


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, d, *J* = 1,4 Hz), 7,48 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,44-7,39 (2H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,62 (1H, s), 5,06-5,02 (4H, m), 4,32 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 229

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 2-cloro-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 188) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-cloro-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 229").

15 Presente compuesto 229

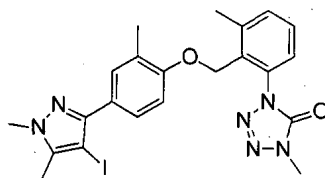


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, d, *J* = 2,1 Hz), 7,49-7,42 (3H, m), 7,31 (1H, dd, *J* = 7,3, 1,8 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 5,20 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,88 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,13 (3H, s), 1,30 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 230

- 25 A temperatura ambiente, a una mezcla de 1,5 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (presente compuesto 47) y 20 ml de cloroformo se le añadieron 0,9 g de N-yodosuccinimida y la mezcla resultante se agitó durante veinte horas. Se añadieron a la misma 5 ml de agua a temperatura ambiente y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-4-yodo-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 230") 1,5 g.

35 Presente compuesto 230



- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,59 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,3 Hz), 7,53 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,45-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,07 (2H, s), 3,89 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,13 (3H, s).

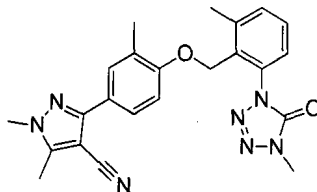
Ejemplo de Preparación 231

- 45 Una mezcla de 0,4 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-4-yodo-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 230), 0,18 g de dicianuro de cinc, 0,08 g de tetraquis(trifenilfosfina) y 0 ml de N-metilpirrolidona se agitó a 100 °C durante cinco horas. Se añadieron a la misma 5 ml de agua a temperatura ambiente y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-4-ciano-1*H*-pirazol-3-il)-

fenoximetil]-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 231") 0,2 g.

Presente compuesto 231

5



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,73 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,1 Hz), 7,68 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,46-7,40 (2H, m), 7,30-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,84 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,46 (3H, s), 2,14 (3H, s).

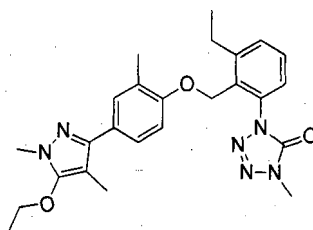
10

Ejemplo de Preparación 232

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 178) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 232").

15

Presente compuesto 232



20

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,43 (2H, m), 7,41-7,41 (1H, m), 7,38-7,35 (1H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,07 (2H, s), 4,14 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,70 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,11 (3H, s), 2,10 (3H, s), 1,41 (3H, t, *J* = 7,1 Hz), 1,28 (3H, t, *J* = 7,7 Hz).

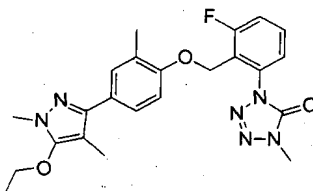
25

Ejemplo de Preparación 233

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 178) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 233").

30

Presente compuesto 233



35

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,47 (1H, m), 7,39 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,36-7,26 (3H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,29 (2H, s), 4,14 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,70 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,40 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

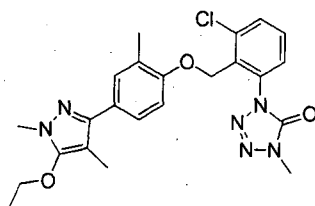
40

Ejemplo de Preparación 234

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 178) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 234").

45

Presente compuesto 234

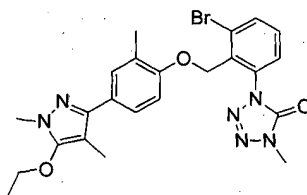


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,46 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41-7,39 (2H, m), 7,36-7,34 (1H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,34 (2H, s), 4,14 (2H, c, *J* = 7,0 Hz), 3,70 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,41 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación 235

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 3 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 178) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 235").

15 Presente compuesto 235

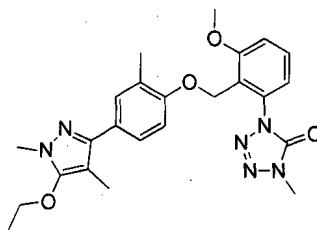


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,4 Hz), 7,45-7,34 (4H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,33 (2H, s), 4,14 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,70 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,41 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación 236

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 178) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 236").

30 Presente compuesto 236

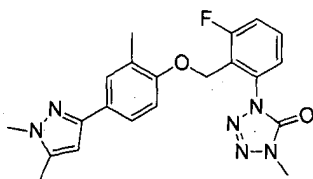


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,37 (1H, s), 7,33 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 7,08 (2H, dd, *J* = 8,1, 3,8 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 4,16-4,09 (2H, m), 3,92 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,40 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación 237

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 63) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 237").

Presente compuesto 237

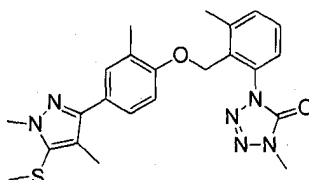


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62-7,60 (1H, m), 7,52 (1H, s), 7,48-7,44 (2H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 8,0 Hz), 6,85 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,23 (1H, s), 5,33 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 238

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 181) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 238").

15 Presente compuesto 238

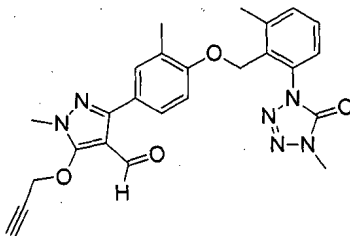


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,38 (4H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 3,98 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,26 (6H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 239

- 25 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,7 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-etoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 217), 7 ml de N,N-dimetilformamida y 0,1 g de 2-propin-1-ol se le añadieron 0,08 g de hidruro de sodio al 55 %. La mezcla resultante se agitó durante doce horas y se añadieron a la misma 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-(3-metil-2-[2-metil-4-[4-formil-1-metil-5-(2-propiniloxi)-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 239") 0,15 g.

Presente compuesto 239

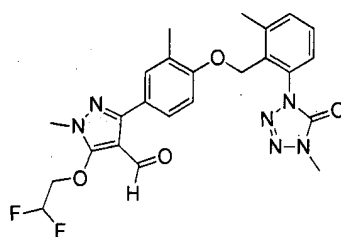


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,74 (1H, s), 7,44-7,42 (2H, m), 7,38-7,36 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1, 2,2 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,27 (2H, d, *J* = 2,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,79 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,56 (1H, t, *J* = 2,4 Hz), 2,52 (3H, s), 2,14 (3H, s).

40 Ejemplo de Preparación 240

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 239 usando 2,2-difluoroetanol en lugar de 2-propine-1-ol dio 1-(3-metil-2-[2-metil-4-[5-(2,2-difluoroetoxi)-4-formil-1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 240").

Presente compuesto 240

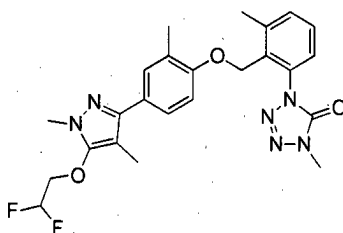


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,72 (1H, s), 7,46-7,41 (2H, m), 7,34 (2H, t, *J* = 5,5 Hz), 7,30 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,12 (1H, tt, *J* = 54,6, 3,5 Hz), 5,08 (2H, s), 4,78 (2H, td, *J* = 14,0, 3,6 Hz), 3,76 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 241

10 A una mezcla de 0,76 g de 1-(3-metil-2-{2-metil-4-[5-(2,2-difluoroetoxi)-4-formil-1-metil-1H-pirazol-3-il]-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (presente compuesto 240) y 7 ml de ácido trifluoroacético se le añadieron 0,45 g de trietilsilano. La mezcla resultante se agitó durante quince horas y el disolvente se retiró por destilación a presión reducida. Se añadieron a la misma 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida.
15 El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-(3-metil-2-{2-metil-4-[5-(2,2-difluorometoxi)-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il]-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 241") 0,15 g.

Presente compuesto 241

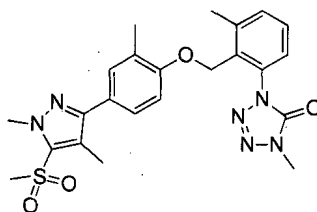


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43-7,39 (3H, m), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,3 Hz), 7,29-7,27 (1H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 6,07 (1H, tt, *J* = 54,7, 4,0 Hz), 5,06 (2H, s), 4,27 (2H, td, *J* = 13,4, 4,0 Hz), 3,73 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (6H, s).

25 Ejemplos de Preparación 242 y 243

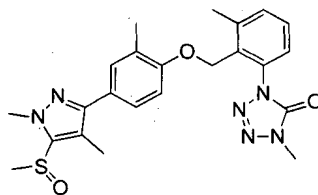
A temperatura ambiente, una mezcla de 1 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (presente compuesto 238), 15 ml de cloroformo y 0,65 g de ácido m-cloroperoxibenzoico se agitó durante quince horas. Se añadieron a la misma 5 ml y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa de tiosulfato de sodio, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metil-sulfonyl-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 242") 0,48 g and 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metil-sulfonyl-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 243") 0,28 g.

40 Presente compuesto 242



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,33-7,27 (3H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,07 (2H, s), 4,17 (3H, s), 3,63 (3H, s), 3,14 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,39 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Presente compuesto 243



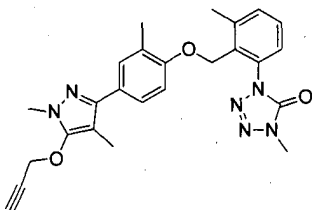
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (2H, m), 7,37-7,36 (1H, m), 7,35-7,32 (1H, m), 7,29-7,26 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,06 (2H, s), 4,15 (3H, s), 3,63 (3H, s), 3,00 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 244

- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,44 g de 1-(3-metil-2-{2-metil-4-[4-formil-1-metil-5-(2-propiniloxy)-1H-pirazol-3-il]-fenoximetil}-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (presente compuesto 239) y 7 ml de ácido trifluoroacético se le añadieron 0,27 g de trietilsilano. La mezcla resultante se agitó durante quince horas y el disolvente se retiró por destilación a presión reducida. Se añadieron a la misma 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-(2-metil-4-[1,4-dimetil-5-(2-propiniloxy)-1H-pirazol-3-il]-fenoximetil)-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 244") 0,4 g.

Presente compuesto 244

20



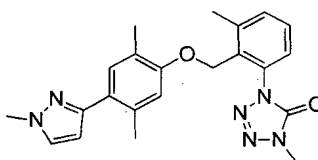
- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (3H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,0 Hz), 7,29-7,27 (1H, m), 6,87 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,06 (2H, s), 4,72 (2H, d, *J* = 2,5 Hz), 3,77 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,59 (1H, t, *J* = 2,5 Hz), 2,51 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 245

- 30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 2,5-dimetil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 221) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 245")

Presente compuesto 245

35



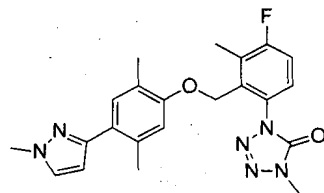
- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,39 (2H, m), 7,37 (1H, d, *J* = 2,1 Hz), 7,32 (1H, s), 7,28-7,26 (1H, m), 6,70 (1H, s), 6,32 (1H, d, *J* = 1,8 Hz), 5,05 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 246

- 45 Una mezcla de 0,3 g de 1-(2-bromometil-3-metil-4-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 217), 0,25 g de 2,5-dimetil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 221), 0,18 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante tres horas. La mezcla de reacción se filtró y después, el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-4-fluoro-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo

sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 246")

Presente compuesto 246



5

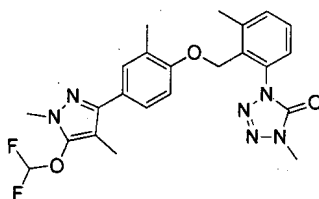
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,37 (1H, d, $J = 2,1$ Hz), 7,32 (1H, s), 7,28-7,25 (1H, m), 7,20 (1H, t, $J = 8,7$ Hz), 6,68 (1H, s), 6,32 (1H, d, $J = 2,1$ Hz), 5,02 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,40 (3H, d, $J = 2,1$ Hz), 2,08 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación 247

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(5-difluorometoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 224) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[2-metil-4-(5-difluorometoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 247")

15

Presente compuesto 247



20

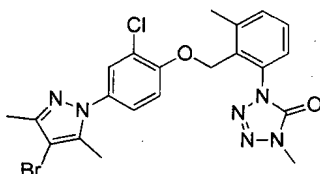
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,47-7,41 (2H, m), 7,29 (1H, dd, $J = 6,9, 2,3$ Hz), 7,07 (1H, dd, $J = 8,2, 2,1$ Hz), 7,04 (1H, s), 6,92 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,89 (1H, t, $J = 74,3$ Hz), 5,08 (2H, s), 3,66 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,89 (3H, s).

25 Ejemplo de Preparación 248

A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,5 g de 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 17) y 10 ml de cloroformo se le añadieron 0,23 g de N-bromosuccinimida. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante quince horas y se añadieron a la misma 5 ml de agua. La mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, una solución acuosa de tiosulfato de sodio y una solución acuosa de carbonato de sodio y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 0,5 g de 1-{2-[4-(4-bromo-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-cloro-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 248").

35

Presente compuesto 248



40 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,46-7,39 (3H, m), 7,31-7,29 (1H, m), 7,20 (1H, dd, $J = 8,8, 2,6$ Hz), 6,94 (1H, d, $J = 8,9$ Hz), 5,19 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,27 (3H, s).

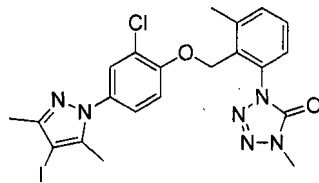
Ejemplo de Preparación 249

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 248 usando N-yodosuccinimida en lugar de N-bromosuccinimida dio

1-{2-[4-(4-yodo-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-cloro-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 249").

Presente compuesto 249

5



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,40 (3H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,4, 1,7 Hz), 7,20 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,5 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,19 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,30 (3H, s), 2,28 (3H, s).

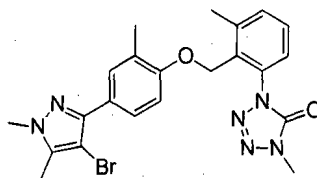
10

Ejemplo de Preparación 250

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando N-bromosuccinimida en lugar de N-clorosuccinimida dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-bromo-1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 250").

15

Presente compuesto 250



20

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,65 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,3 Hz), 7,58 (1H, d, *J* = 2,0 Hz), 7,44-7,39 (2H, m), 7,28-7,26 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,06 (2H, s), 3,84 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,30 (3H, s), 2,12 (3H, s).

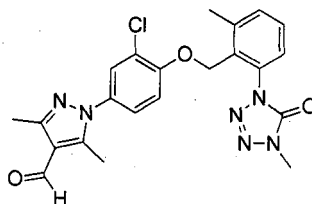
Ejemplo de Preparación 251

25

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 116 usando 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 17) en lugar de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 62) dio 1-{3-metil-2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 251").

30

Presente compuesto 251



35

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 10,00 (1H, s), 7,45-7,40 (3H, m), 7,31 (1H, dd, *J* = 7,4, 1,5 Hz), 7,23 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,6 Hz), 6,98 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,21 (2H, s), 3,69 (3H, s), 2,55 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,51 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 252

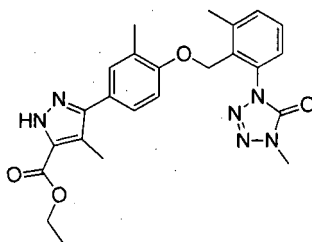
40

A temperatura ambiente, a una mezcla de 3,8 g de éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazolil)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 225) y 70 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 0,39 g de hidrato de hidrazina uno y la mezcla resultante se agitó durante nueve horas. El disolvente se retiró por destilación y se añadieron a la misma 100 ml de agua y la mezcla resultante se agitó durante una media hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 50 ml de agua y 50 ml de hexano y después se secaron a presión reducida para dar 3,7 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento,

45

denominado como "Presente compuesto 252").

Presente compuesto 252



5

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,46-7,40 (2H, m), 7,33-7,31 (2H, m), 7,28 (1H, dd, $J = 6,9, 2,4$ Hz), 6,93-6,90 (1H, m), 5,08 (2H, s), 4,41 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,41 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,42 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

10 Ejemplos de Preparación 253 y 254

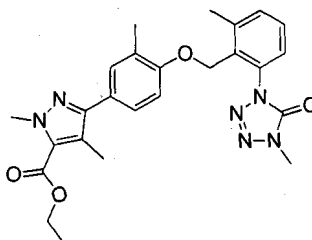
A 0 °C, a una mezcla de 0,5 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (presente compuesto 252) y 10 ml de *N,N*-dimetilformamida se le añadieron 0,056 g de hidruro de sodio al 55 %. La mezcla resultante se agitó durante una hora y se añadieron a 0,13 ml de yoduro de metilo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante doce horas. Se añadieron a la misma 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 253") 0,19 g and 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 254") 0,21 g.

15

20

Presente compuesto 253

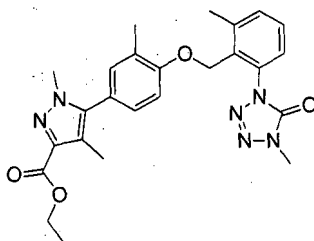
25



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,40 (2H, m), 7,36-7,35 (1H, m), 7,32 (1H, dd, $J = 8,3, 1,9$ Hz), 7,28 (1H, dd, $J = 6,9, 2,4$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 5,07 (2H, s), 4,40 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 4,17 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,42 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

30

Presente compuesto 254



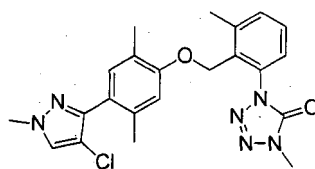
35

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,47-7,42 (2H, m), 7,29 (1H, dd, $J = 7,0, 2,3$ Hz), 7,06 (1H, dd, $J = 8,2, 2,3$ Hz), 7,03-7,02 (1H, m), 6,93 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 5,09 (2H, s), 4,43 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,80 (3H, s), 3,66 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,42 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

Ejemplo de Preparación 255

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 190 usando 1-{2-[2,5-dimetil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 245) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 47) dio 1-{2-[2,5-dimetil-4-(4-cloro-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 255").

Presente compuesto 255

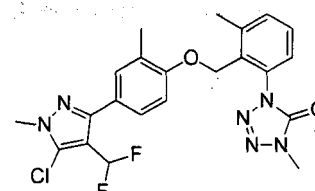


EM+: 439

Ejemplo de Preparación 256

A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,4 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-cloro-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 207) y 10 ml de cloroformo se le añadieron 0,42 g de trifluoruro de (dietilamino)sulfuro. La mezcla resultante se agitó durante doce horas y después, se añadieron a la misma 5 ml de agua. La mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,17 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-cloro-4-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 256").

Presente compuesto 256

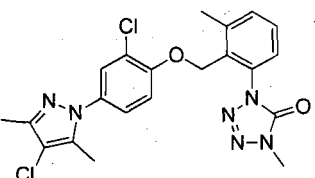


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43-7,40 (4H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,9 Hz), 6,65 (1H, t, *J* = 53,8 Hz), 5,07 (2H, s), 3,90 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 257

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 248 usando *N*-clorosuccinimida en lugar de *N*-bromosuccinimida dio 1-{2-[4-(4-cloro-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-cloro-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 257").

Presente compuesto 257



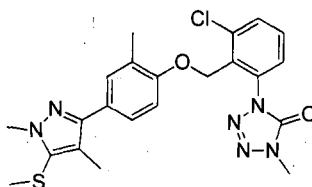
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,40 (3H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,5, 1,6 Hz), 7,21 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,6 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 5,19 (2H, s), 3,68 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 258

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-5-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

(descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 181) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-cloro-2-{2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 258").

5 Presente compuesto 258

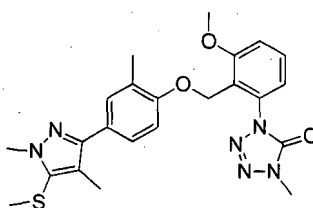


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, t, *J* = 4,0 Hz), 7,50-7,37 (4H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,35 (2H, s), 3,98 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,26 (6H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 259

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 7 usando 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 181) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-metoxi-2-{2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 259").

20 Presente compuesto 259

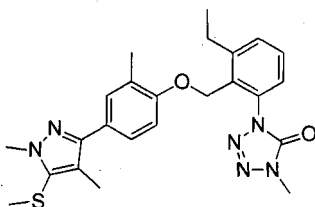


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, t, *J* = 8,2 Hz), 7,39-7,38 (1H, m), 7,36 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,2 Hz), 7,09-7,06 (2H, m), 6,91 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,28 (2H, s), 3,97 (3H, s), 3,92 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 260

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 181) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-etil-2-{2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 260").

Presente compuesto 260



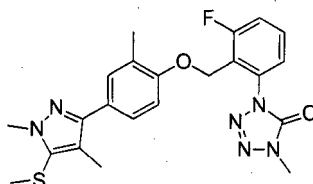
35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,42 (3H, m), 7,40 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,0 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,08 (2H, s), 3,98 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,26 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

40

Ejemplo de Preparación 261

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 181) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-fluoro-2-[2-metil-4-(1,4-dimetil-5-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 261").

Presente compuesto 261

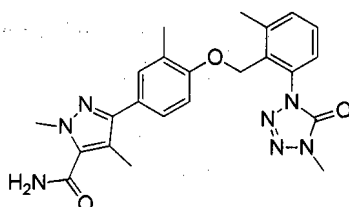


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,47 (1H, m), 7,41-7,40 (1H, m), 7,38 (1H, dd, *J* = 8,5, 1,9 Hz), 7,33-7,26 (2H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,30 (2H, s), 3,98 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,02 (3H, s).

15 Ejemplo de Preparación 262

2,1 g de cloruro de 2,4-dimetil-5-[3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil]-2*H*-pirazol-3-carbonilo (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 227) se disolvieron en 30 ml de tetrahidrofurano. A 70 ml de una solución acuosa al 28-30 % de amoníaco con agitación a temperatura ambiente, se le añadió gota a gota 30 ml de la solución de tetrahidrofurano anteriormente preparada y la mezcla resultante se agitó durante otras dos horas. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 30 ml de agua y 30 ml de hexano, y después se secaron a presión reducida para dar 2 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 262").

Presente compuesto 262

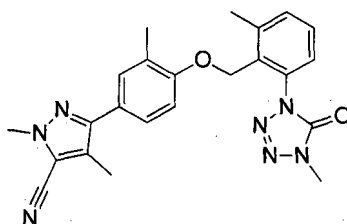


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,34-7,31 (2H, m), 7,30-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,75 (2H, s a), 5,07 (2H, s), 4,13 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 263

A 0 °C, a una mezcla de 0,5 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 262) y 10 ml de piridina se le añadieron 0,26 g de oxiclóruo de fósforo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante tres horas y se añadieron a la misma 30 ml de agua. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 10 ml de agua y 10 ml de hexano, y después se secaron a presión reducida para dar 0,38 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-ciano-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 263").

Presente compuesto 263



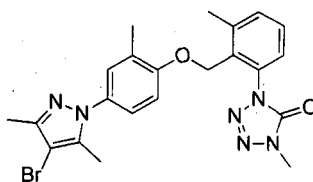
45

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,40 (3H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,4, 1,8 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,9, 2,2 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,07 (2H, s), 4,03 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,33 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 264

5 A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,3 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 20) (Presente compuesto 20) y 5 ml de cloroformo se le añadieron 0,14 g de N-bromosuccinimida. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante doce horas y se añadieron a la misma 5 ml de agua. La mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, una solución acuosa de tiosulfato de sodio y una solución acuosa de carbonato de sodio, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 0,3 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-bromo-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 264").

15 Presente compuesto 264

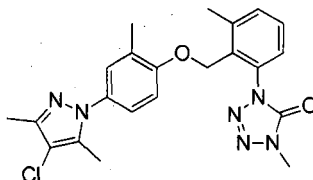


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,41 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1,2,3 Hz), 7,15-7,15 (1H, m), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,06 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 265

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 264 usando N-clorosuccinimida en lugar de N-bromosuccinimida dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-cloro-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 265").

Presente compuesto 265

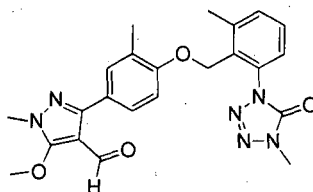


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,40 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,9 Hz), 7,15 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,11 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,6 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,12 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación 266

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 239 usando metanol en lugar de 2-propino-1-ol dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 266").

Presente compuesto 266



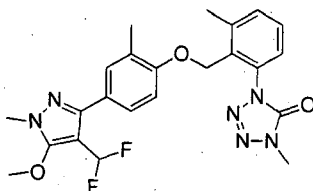
45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,73 (1H, s), 7,45-7,40 (2H, m), 7,37-7,35 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,8, 2,4 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 9,2 Hz), 5,08 (2H, s), 4,29 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 267

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 256 usando 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 266) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-cloro-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 207) dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-difluorometil-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 267").

Presente compuesto 267

10



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,33-7,27 (3H, m), 6,89. (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,59 (1H, t, *J* = 54,7 Hz), 5,07 (2H, s), 4,13 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s).

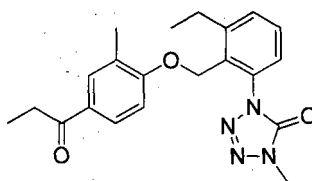
15

Ejemplo de Preparación 268

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 114) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-3-etil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 268").

20

Presente compuesto 268



25

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,76-7,75 (1H, m), 7,52-7,45 (2H, m), 7,30 (1H, dd, *J* = 7,5, 1,8 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,12 (2H, s), 3,59 (3H, s), 2,95 (2H, c, *J* = 7,4 Hz), 2,84 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz), 1,21 (3H, t, *J* = 7,4 Hz).

30

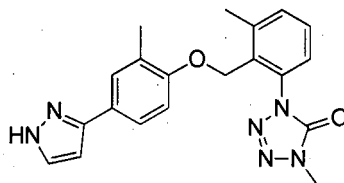
Ejemplo de Preparación 269

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 97 usando 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 228) en lugar de 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 269").

35

Presente compuesto 269

40



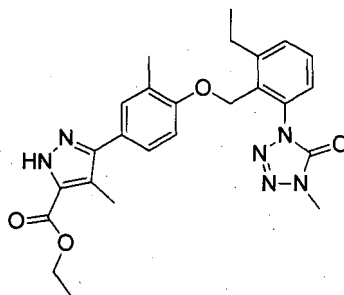
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,59 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,51-7,48 (2H, m), 7,45-7,39 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 6,9, 2,4 Hz), 6,89-6,87 (1H, m), 6,52 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,07 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

45

Ejemplo de Preparación 270

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 252 usando éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 229) en lugar de éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 270").

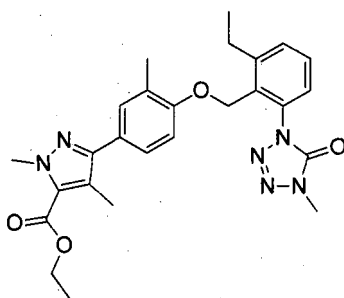
10 Presente compuesto 270



15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51-7,45 (2H, m), 7,34-7,32 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,1,2,1 Hz), 6,93 (1H, d, J = 8,0 Hz), 5,10 (2H, s), 4,42 (2H, c, J = 7,2 Hz), 3,60 (3H, s), 2,86 (2H, c, J = 7,6 Hz), 2,41 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,42 (3H, t, J = 7,2 Hz), 1,29 (3H, t, J = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 271

20 Una mezcla de 3,3 g de 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 270), 2,6 g de sulfato de dimetilo y 50 ml de tolueno, se agitó a 100 °C durante seis horas. A la mezcla resultante se le añadieron 10 ml de agua a temperatura ambiente, y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentraron a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,8 g de 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 271").

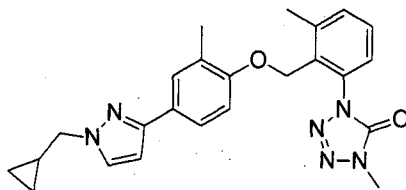


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,44 (2H, m), 7,34-7,31 (2H, m), 7,29 (1H, dd, J = 7,0, 2,2 Hz), 6,91 (1H, d, J = 8,2 Hz), 5,08 (2H, s), 4,40 (2H, c, J = 7,2 Hz), 4,17 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,85 (2H, c, J = 7,6 Hz), 2,36 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,42 (3H, t, J = 7,1 Hz), 1,29 (3H, t, J = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 272

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 132 usando 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 269) en lugar de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 97) dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1-ciclopropilmetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 272").

Presente compuesto 272



5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58-7,57 (1H, m), 7,53 (1H, dd, *J* = 7,8, 1,9 Hz), 7,50 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,43-7,39 (2H, m), 7,28-7,26 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 6,46 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,05 (2H, s), 4,02 (2H, d, *J* = 7,0 Hz), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,35-1,31 (1H, m), 0,68-0,63 (2H, m), 0,41-0,37 (2H, m).

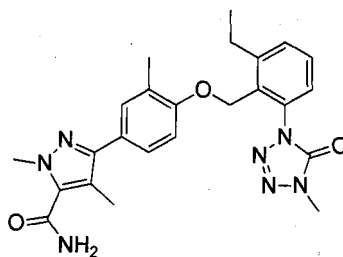
Ejemplo de Preparación 273

10

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 262 usando cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carbonilo (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 230) en lugar de cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carbonilo dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 273").

15

Presente compuesto 273



20

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,50-7,44 (2H, m), 7,33-7,28 (3H, m), 6,91 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,83 (2H, s a), 5,09 (2H, s), 4,12 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,35 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

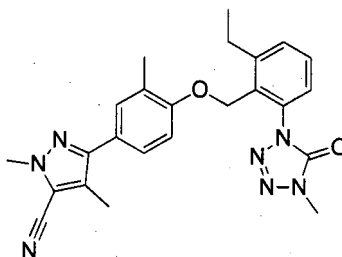
25 Ejemplo de Preparación 274

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 263 usando 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 273) (Presente compuesto 273) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 262) dio 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-ciano-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 274").

30

Presente compuesto 274

35

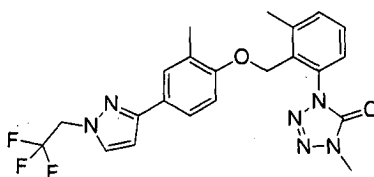


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51-7,44 (2H, m), 7,40-7,36 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1,2,1 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,09 (2H, s), 4,03 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,34 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,29 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 275

A temperatura ambiente, a una mezcla de 0,4 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4- metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 269) (Presente compuesto 269) y 4 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 0,056 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante una hora, y después se añadieron a la misma 0,7 g de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico. La mezcla resultante se agitó a 55 °C durante veinticuatro horas. Se añadió agua a la misma y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-(2-{4-[1-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 275") 0,22 g.

Presente compuesto 275

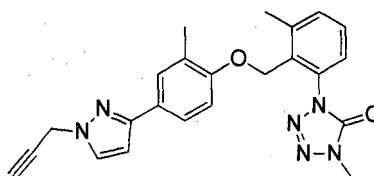


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57 (1H, s), 7,55-7,53 (1H, m), 7,50 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,45-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,57 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 5,07 (2H, s), 4,73 (2H, c, *J* = 8,4 Hz), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 276

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 275 usando 3-bromopropina en lugar de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico dio 1-(2-{4-[1-(2-propinil)-1H-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4- metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 276").

Presente compuesto 276

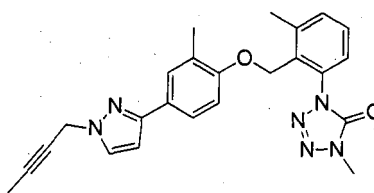


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58 (2H, d, *J* = 21,1 Hz), 7,53-7,51 (1H, m), 7,43-7,37 (2H, m), 7,28-7,24 (1H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,49 (1H, s), 5,04 (2H, s), 4,96 (2H, s), 3,60 (3H, s), 2,49 (4H, s), 2,10 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 277

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 275 usando 1-bromo-2-butina en lugar de 2,2,2-trifluoroetil éster del ácido trifluorometanosulfónico dio 1-(2-{4-[1-(2-butinil)-1H-pirazol-3-il]-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 277").

Presente compuesto 277

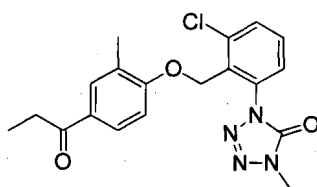


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,57-7,57 (1H, m), 7,55-7,52 (1H, m), 7,44-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,49 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,06 (2H, s), 4,92 (2H, c, *J* = 2,5 Hz), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,89 (3H, t, *J* = 2,5 Hz).

Ejemplo de Preparación 278

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 114) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil]-3-cloro-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 278").

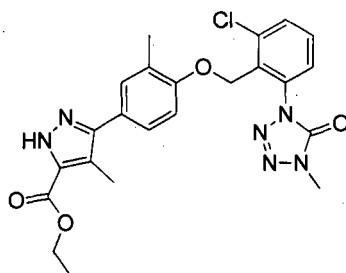
Presente compuesto 278



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,79 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,74-7,73 (1H, m), 7,62 (1H, dd, $J = 8,2, 1,1$ Hz), 7,48 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,41 (1H, dd, $J = 7,9, 1,1$ Hz), 6,87 (1H, d, $J = 8,6$ Hz), 5,37 (2H, s), 3,59 (3H, s), 2,93 (2H, c, $J = 7,3$ Hz), 2,05 (3H, s), 1,19 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación 279 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 252 usando éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 231) en lugar de éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 279").

Presente compuesto 279

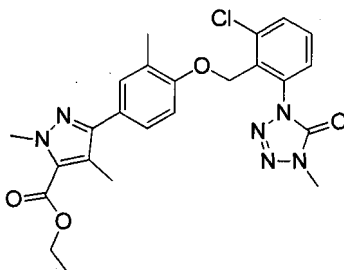


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,62 (1H, dd, $J = 8,0, 1,4$ Hz), 7,47 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,40 (1H, dd, $J = 8,0, 1,4$ Hz), 7,32-7,30 (2H, m), 6,91 (1H, d, $J = 8,9$ Hz), 5,35 (2H, s), 4,40 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 3,61 (3H, s), 2,40 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,40 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación 280

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 271 usando 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 279) en lugar de 1-{3- etil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 280").

Presente compuesto 280



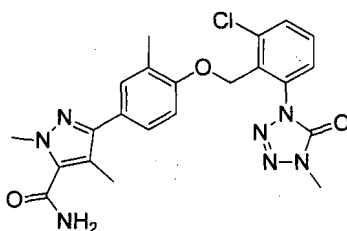
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,48 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,34-7,30 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,35 (2H, s), 4,40 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 4,16 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,42 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

5 Ejemplo de Preparación 281

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 262 usando cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil]-2H-pirazol-3-carbonilo (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 234) en lugar de cloro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil]-2H-pirazol-3-carbonilo dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 281").

Presente compuesto 281

15



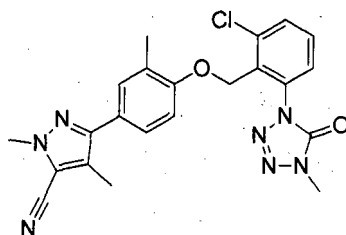
RMN ¹H (DMSO-*D*₆) δ: 7,78 (1H, dd, *J* = 8,0, 0,9 Hz), 7,63 (1H, t, *J* = 8,1 Hz), 7,55 (1H, dd, *J* = 8,0, 0,9 Hz), 7,40 (2H, s a), 7,29-7,27 (2H, m), 6,97 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,16 (2H, s), 3,99 (3H, s), 3,51 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,97 (3H, s).

20

Ejemplo de Preparación 282

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 263 usando 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 281) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 262) dio 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-ciano-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 282").

30 Presente compuesto 282



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 8,0 Hz), 7,40 (1H, dd, *J* = 8,0, 1,4 Hz), 7,38-7,34 (2H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,34 (2H, s), 4,01 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,32 (3H, s), 2,06 (3H, s).

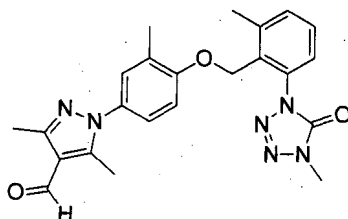
35

Ejemplo de Preparación 283

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 116 usando 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 20) en lugar de 1-{3-metoxi-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 62) dio 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 283").

45

Presente compuesto 283



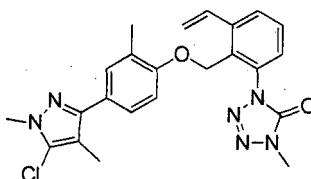
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 10,00 (1H, s), 7,47-7,42 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1, 1,7 Hz), 7,16-7,12 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,08 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,52-2,51 (9H, m), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 284

- 10 Una mezcla de 0,9 g de 1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 208), 0,6 g de tributil-vinilestannano, 0,4 g de tetraquis-(trifenilfosfina)-paladio y 10 ml de tolueno, se agitó con calentamiento a reflujo durante siete horas. Se añadieron a la misma 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una
- 15 cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,6 g de 1-{3-vinil-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 284").

Presente compuesto 284

20

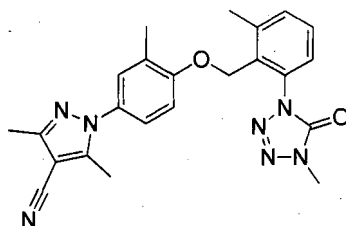


- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,71-7,69 (1H, m), 7,51 (1H, t, *J* = 7,9 Hz), 7,41-7,40 (1H, m), 7,38-7,35 (2H, m), 7,06 (1H, dd, *J* = 17,4, 10,9 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,74 (1H, dd, *J* = 17,4, 1,1 Hz), 5,44 (1H, dd, *J* = 10,9, 1,1 Hz), 5,10 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 285

- 30 A una mezcla de 3,5-dimetil-1-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 235) y 10 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 0,2 g de 2,4,6-tricloro-1,3,5-triazina, después la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 7 horas y se añadieron a la misma 30 ml de agua. El precipitado se filtró y se lavó con 10 ml de agua y después se secó a presión reducida para dar 0,4 g de 3,5-dimetil-1-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbonitrilo (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como
- 35 "Presente compuesto 285").

Presente compuesto 285



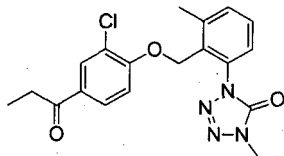
40

- RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47-7,41 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,9 Hz), 7,14-7,11 (2H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,08 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,39 (3H, s), 2,39 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 286

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 1-(4-hidroxi-3-cloro-fenil)-propano-1-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 237) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(2-cloro-4-propionil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 286").

Presente compuesto 286

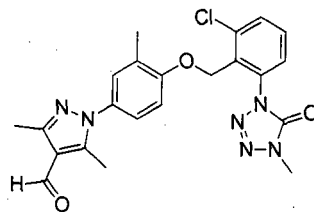


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,97 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 7,83 (1H, dd, $J = 8,6, 2,0$ Hz), 7,46-7,39 (2H, m), 7,31 (1H, dd, $J = 7,4, 1,5$ Hz), 6,93 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 5,24 (2H, s), 3,67 (3H, s), 2,93 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 2,53 (3H, s), 1,20 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación 287

Se obtuvo 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 287") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 283.

Presente compuesto 287

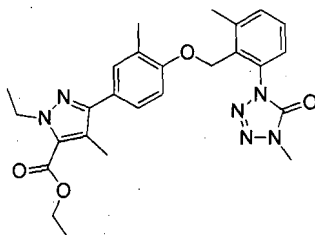


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 9,98 (1H, s), 7,63-7,61 (1H, m), 7,51-7,46 (1H, m), 7,42-7,40 (1H, m), 7,13-7,11 (2H, m), 6,91 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 5,34 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,49 (6H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplos de Preparación 288 y 289

Una mezcla de 3,8 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 252"), 5,0 g de sulfato de dietilo y 50 ml de tolueno, se agitó a 90 °C durante seis horas. A la mezcla resultante se le añadieron 10 ml de agua a temperatura ambiente, y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas se lavaron con agua y se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentraron a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1-etil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 288") y 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3-etoxicarbonil-1-etil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 289").

Presente compuesto 288

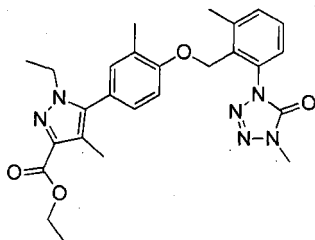


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,40 (2H, m), 7,36-7,35 (1H, m), 7,33 (1H, dd, $J = 8,2, 2,3$ Hz), 7,28 (1H, dd, $J = 6,8, 2,7$

Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 5,07 (2H, s), 4,59 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 4,40 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,43 (6H, c, $J = 7,1$ Hz).

Presente compuesto 289

5



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,46-7,41 (2H, m), 7,33-7,27 (3H, m), 6,92 (1H, d, $J = 7,9$ Hz), 5,08 (2H, s), 4,44-4,39 (2H, m), 4,12 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,41 (3H, s), 2,05 (3H, s), 1,42 (3H, t, $J = 7,1$ Hz), 1,26 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

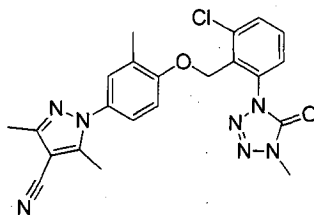
10

Ejemplo de Preparación 290

Se obtuvo 1-(3-cloro-2-[2-metil-4-(4-ciano-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 290") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 285.

15

Presente compuesto 290



20

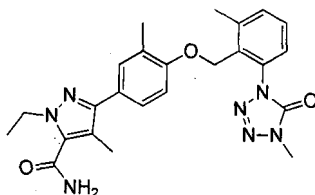
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,62 (1H, dd, $J = 8,1, 1,3$ Hz), 7,49 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,41 (1H, dd, $J = 7,9, 1,3$ Hz), 7,12-7,09 (2H, m), 6,90 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 5,34 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,38 (3H, s), 2,38 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 291

Se obtuvo 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1-etil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 291") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 262.

30

Presente compuesto 291



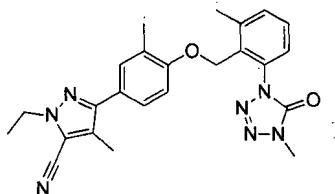
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,43-7,40 (2H, m), 7,35-7,35 (1H, m), 7,31 (1H, dd, $J = 8,3, 2,2$ Hz), 7,29-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 5,74 (2H, s), 5,07 (2H, s), 4,53 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,35 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,45 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

Ejemplo de Preparación 292

40

Se obtuvo 1-(3-metil-2-[2-metil-4-(5-ciano-1-etil-4-metil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 292") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 263.

Presente compuesto 292

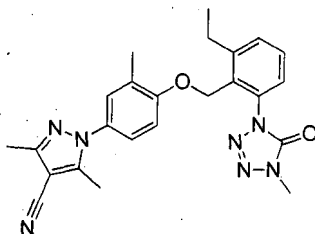


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (3H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,4 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,07 (2H, s), 4,33 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,33 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,54 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

Ejemplo de Preparación 293

10 Se obtuvo 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(4-ciano-3,5-dimetilpirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 293") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 285.

15 Presente compuesto 293

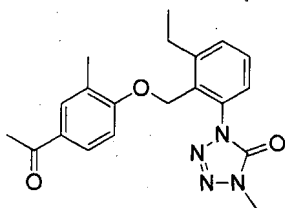


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51-7,45 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,5 Hz), 7,13-7,11 (2H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 5,09 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,84 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,39 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 294

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 5 usando 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-etanona en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-etil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 294").

Presente compuesto 294

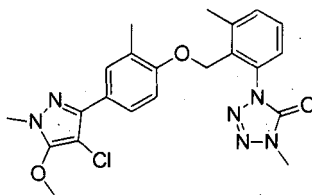


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,3 Hz), 7,76-7,75 (1H, m), 7,52-7,45 (2H, m), 7,31 (1H, dd, *J* = 7,2, 1,8 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,14 (2H, s), 3,60 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,56 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,29 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

35 Ejemplo de Preparación 295

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 4 usando 4-(4-Cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 244) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[4-(4-Cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 295").

Presente compuesto 295



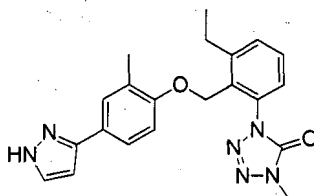
5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,3 Hz), 7,57 (1H, dd, *J* = 2,0, 0,7 Hz), 7,45-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,07 (2H, s), 4,11 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 296

10 Se obtuvo 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 296") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 97.

Presente compuesto 296

15

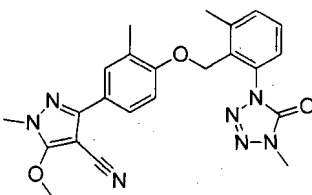


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,58 (1H, d, *J* = 2,1 Hz), 7,51-7,44 (4H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1,2,1 Hz), 6,89 (1 H, d, *J* = 9,2 Hz), 6,52 (1H, d, *J* = 2,1 Hz), 5,09 (2H, s), 3,58 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,12 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 297

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 285 usando 5-metoxi-1-metil-3-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 245) en lugar de 3,5-dimetil-1-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima dio 1-{2-[4-(4-ciano-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 297").

30 Presente compuesto 297

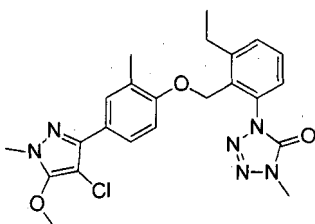


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,62-7,62 (1H, m), 7,45-7,40 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,07 (2H, s), 4,33 (3H, s), 3,65 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 298

40 Se obtuvo 1-{2-[4-(4-cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-etil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 298") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 295.

Presente compuesto 298

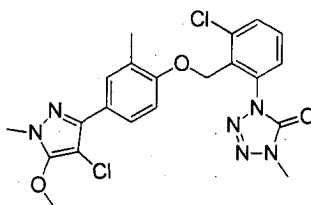


5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,62 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 7,57 (1H, s), 7,49-7,43 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,89 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,08 (2H, s), 4,11 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,84 (2H, c, $J = 7,5$ Hz), 2,11 (3H, s), 1,27 (3H, t, $J = 7,5$ Hz).

Ejemplo de Preparación 299

10 Se obtuvo 1-{2-[4-(4-cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-cloro-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 299") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 295.

15 Presente compuesto 299

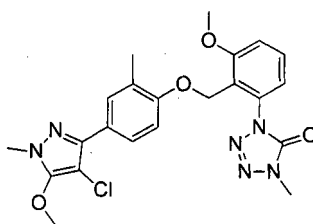


20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,63-7,59 (2H, m), 7,56 (1H, dd, $J = 2,2, 0,6$ Hz), 7,47 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,40 (1H, dd, $J = 8,0, 1,4$ Hz), 6,89 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,35 (2H, s), 4,11 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 300

25 Se obtuvo 1-{2-[4-(4-cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 300") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 295.

Presente compuesto 300

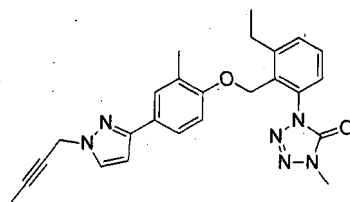


30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,58 (1H, dd, $J = 8,5, 2,3$ Hz), 7,53 (1H, d, $J = 1,6$ Hz), 7,46 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 7,09-7,06 (2H, m), 6,91 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,29 (2H, s), 4,10 (3H, s), 3,92 (3H, s), 3,69 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,03 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación 301

40 Se obtuvo 1-{2-[4-(1-But-2-inil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-etil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 301") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 277.

Presente compuesto 301

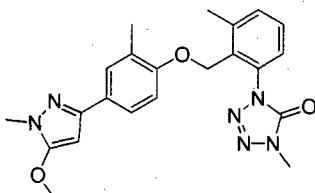


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,57-7,56 (1H, m), 7,53 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,2 Hz), 7,49-7,43 (2H, m), 7,28 (1H, dd, *J* = 7,0, 2,2 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,48 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 5,07 (2H, s), 4,92 (2H, c, *J* = 2,4 Hz), 3,57 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,10 (3H, s), 1,89 (3H, t, *J* = 2,5 Hz), 1,27 (3H, c, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación 302

10 A temperatura ambiente, una mezcla de éster etílico del ácido 3-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 247), 70 ml de tolueno y 4 g de metilhidrazina, se agitó durante 12 horas. A la mezcla resultante se le añadieron 100 ml de agua y se acidificó con HCl ac. al 10 %. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 10 ml de agua y 10 ml de hexano, y después se secaron a presión reducida para dar 3 g del producto en bruto de 1-{2-[4-(5-Hidroxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona. A temperatura ambiente, a una mezcla del producto en bruto y 40 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 0,48 g de hidruro de sodio al 55 % y se agitó durante una hora, y después, se añadieron a la misma 1,8 g de sulfato de dimetilo y se agitó a 100 °C durante 4 horas. Se añadieron a la misma 50 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-{2-[4-(5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 302")

25 Presente compuesto 302

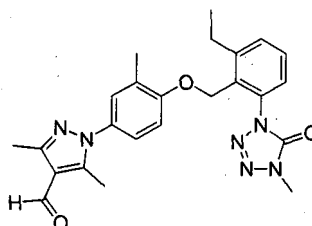


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53-7,53 (1H, m), 7,48 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,3 Hz), 7,44-7,39 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,75 (1H, s), 5,05 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,67 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 303

35 Se obtuvo 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 303") haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 283.

Presente compuesto 303



40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,99 (1H, s), 7,51-7,45 (2H, m), 7,29 (1H, d, *J* = 7,3 Hz), 7,15-7,12 (2H, m), 6,91 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,09 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,85 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,50 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,28 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

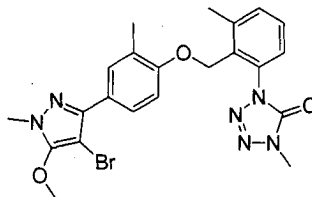
45

Ejemplo de Preparación 304

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 139 usando 1-{2-[4-(5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (Presente compuesto 302) en lugar de 1-{3-metoxi-2-

compuesto 84) dio 1-{2-[4-(4-bromo-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 304").

10 Presente compuesto 304

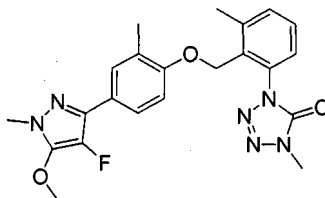


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,3 Hz), 7,56 (1H, dd, *J* = 2,1,0,7 Hz), 7,46-7,40 (2H, m), 7,30-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,07 (2H, s), 4,10 (3H, s), 3,74 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 305

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 304 usando 1-cloro metil-4-fluoro-1,4-diazonia biciclo[2,2,2]octanobis-tetrafluoroborato en lugar de N-bromosuccinimida dio 1-{2-[4-(4-fluoro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 305").

25 Presente compuesto 305

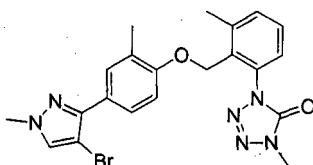


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57-7,55 (2H, m), 7,45-7,40 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,07 (2H, s), 4,11 (3H, d, *J* = 2,3 Hz), 3,64 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 306

35 1-{2-[4-(4-bromo-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 306") se obtuvo haciendo referencia al Ejemplo de Preparación 139

Presente compuesto 306



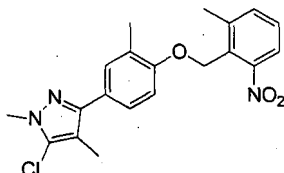
40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51 (1H, s), 7,47-7,41 (2H, m), 7,30-7,28 (1H, m), 7,19-7,16 (1H, m), 7,13 (1H, dd, *J* = 2,2, 0,8 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,09 (2H, s), 3,79 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,15 (3H, s).

45 A continuación, los Ejemplos de Síntesis para la preparación de un compuesto representado por una fórmula (4) y un compuesto representado por una fórmula (3) se muestra a continuación.

Ejemplo de Síntesis 1

Una mezcla de 2,1 g de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 140), 2 g de bromuro de 2-metil-6-nitrobencilo (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 219), 1,5 g de carbonato de potasio y 100 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante veinticuatro horas. A temperatura ambiente, la mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida y después se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,1 g de 5-cloro-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol.

10 5-cloro-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol

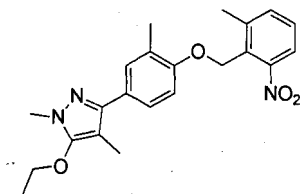


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, dd, *J* = 8,0, 0,8 Hz), 7,47 (1H, d, *J* = 7,0 Hz), 7,44-7,38 (3H, m), 6,96 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,26 (2H, s), 3,86 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,16 (3H, s).

Ejemplo de Síntesis 2

20 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 178) en lugar de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol dio 5-etoxi-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol.

5-etoxi-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol

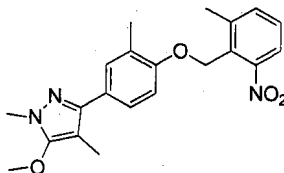


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, d, *J* = 7,7 Hz), 7,48-7,44 (2H, m), 7,42-7,38 (2H, m), 6,95 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,25 (2H, s), 4,15 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,71 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,42 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Síntesis 3

35 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 175) en lugar de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol dio 1,4-dimetil-5-metoxi-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol.

1,4-dimetil-5-metoxi-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol

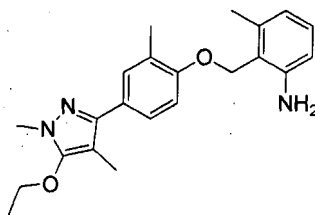


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,66 (1H, d, *J* = 7,7 Hz), 7,48-7,37 (4H, m), 6,95 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,25 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,71 (3H, s), 2,53 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Síntesis 4

45 A temperatura ambiente, una mezcla de 2,1 g de 5-etoxi-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Síntesis 2), 0,21 g de paladio al 10 %-carbono soportado (Pd/C) y 30 ml de etanol se agitó en atmósfera de hidrógeno durante ocho horas. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida para dar 1,6 g de 2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina.

2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metil-fenilamina

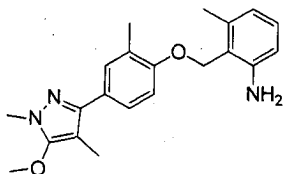


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47-7,47 (1H, m), 7,45-7,42 (1H, m), 7,09-7,04 (2H, m), 6,65 (1H, d, *J* = 7,5 Hz), 6,62 (1H, d, *J* = 7,9 Hz), 5,09 (2H, s), 4,15 (2H, c, *J* = 6,8 Hz), 4,04 (2H, s), 3,72 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,42 (3H, t, *J* = 6,8 Hz).

Ejemplo de Síntesis 5

10 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 4 usando 1,4-dimetil-5-metoxi-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Síntesis 3) en lugar de 5-etoxi-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1H-pirazol dio 2-[4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina.

15 2-[4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina

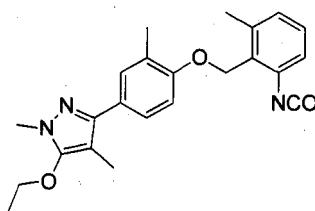


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,45 (1H, m), 7,43 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,0 Hz), 7,09-7,05 (2H, m), 6,67-6,61 (2H, m), 5,09 (2H, s), 4,04 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,72 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,15 (3H, s).

Ejemplo de Síntesis 6

25 1,6 g de 2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metil-fenilamina (descrito en el Ejemplo de Síntesis 4), 50 ml de tolueno y 1,9 g de trifosgeno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar 1,7 g de 5-etoxi-3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-1H-pirazol.

30 5-etoxi-3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-1H-pirazol

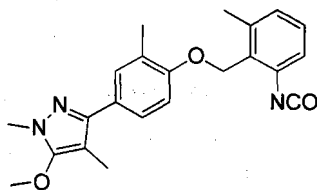


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,43 (1H, m), 7,28-7,23 (1H, m), 7,21-7,14 (2H, m), 7,09-7,03 (2H, m), 5,11 (2H, s), 4,16 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,72 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,42 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Síntesis 7

40 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 6 usando 2-[4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina (Ejemplo de Síntesis 5) en lugar de 2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina dio 3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol.

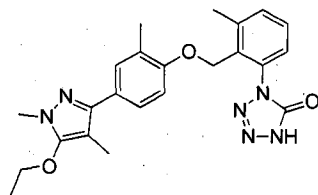
3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metilfenil]-1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47-7,44 (1H, m), 7,28-7,23 (1H, m), 7,19-7,16 (2H, m), 7,09-7,02 (2H, m), 5,12 (2H, s), 3,96 (3H, s), 3,74 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,16 (3H, s).

Ejemplo de Síntesis 8

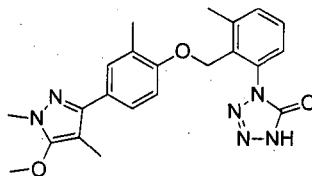
- 10 A 0 °C, a una mezcla de 15 ml de N,N-dimetilformamida y 0,76 g de tricloruro de aluminio se le añadieron 0,34 de azida de sodio. Después de la mezcla resultante se agitó durante una hora, se añadieron a la misma 1,7 g de 5-etoxi-3-[4-(2-isocianato-6-metilbenciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Síntesis 6). La mezcla de reacción se agitó a 75 °C durante ocho horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y se añadieron a la misma 10 ml de agua enfriada con hielo, seguido de la adición de 0,52 g de nitrito de sodio y además, 10 ml de una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,7 g de 1-{2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metil-fenil}-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.
- 15
- 20 1-{2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43-7,38 (2H, m), 7,33 (1H, dd, J = 8,4, 1,9 Hz), 7,31-7,30 (1H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,90 (1H, d, J = 8,2 Hz), 5,15 (2H, s), 4,26 (2H, c, J = 7,0 Hz), 3,82 (3H, s), 2,55 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,45 (3H, t, J = 7,1 Hz).

Ejemplo de Síntesis 9

- 30 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 8 usando 3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol (Ejemplo de Síntesis 7) en lugar de 5-etoxi-3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-1H-pirazol dio 1-{2-[4-(5-metoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.
- 35 1-{2-[4-(5-metoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil}-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

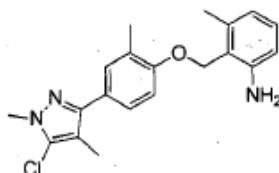


- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,40 (2H, m), 7,39-7,35 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J = 6,8, 2,2 Hz), 6,89 (1H, d, J = 8,2 Hz), 5,08 (2H, s), 3,94 (3H, s), 3,73 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,11 (3H, s), 2,10 (3H, s).

Ejemplo de Síntesis 10

- 45 A temperatura ambiente, una mezcla de 2,9 g de 5-cloro-1,4-dimetil-3-[3-metil-4-(2-metil-6-nitrobenciloxi)-fenil]-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Síntesis 1), 0,3 g de platino al 5 % sobre carbono (Pt/C), 70 ml de etanol y 30 ml de acetato de etilo, se agitó en atmósfera de hidrógeno durante nueve horas y media. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida para dar 2,6 g de 2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina.

2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina



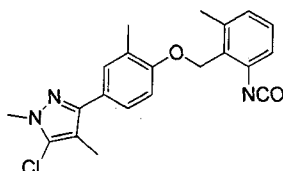
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,42 (2H, m), 7,09-7,05 (2H, m), 6,66 (1H, d, J = 7,3 Hz), 6,62 (1H, d, J = 8,0 Hz), 5,10 (2H, s), 4,03 (2H, s a), 3,86 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,16 (3H, s).

Ejemplo de Síntesis 11

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 6 usando 2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina (Ejemplo de Síntesis 10) en lugar de 2-[4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenilamina dio 3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-5-cloro-1H-pirazol.

3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-5-cloro-1H-pirazol

15



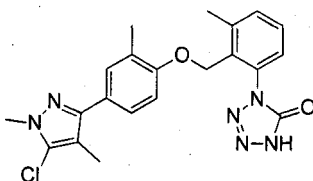
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47-7,43 (2H, m), 7,22 (1H, d, J = 7,8 Hz), 7,18-7,16 (1H, m), 7,06 (2H, dd, J = 15,5, 7,9 Hz), 5,12 (2H, s), 3,86 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,17 (3H, s).

20

Ejemplo de Síntesis 12

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Síntesis 8 usando 3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-5-cloro-1H-pirazol (Ejemplo de Síntesis 11) en lugar de 5-etoxi-3-[4-(2-isocianato-6-metil-benciloxi)-3-metil-fenil]-1,4-dimetil-1H-pirazol dio 1-[2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil]-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-[2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-metil-fenil]-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



30

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,40 (2H, m), 7,38-7,34 (2H, m), 7,28 (1H, dd, J = 6,3, 2,9 Hz), 6,87 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,07 (2H, s), 3,85 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,11 (3H, s)

- 35 A continuación, con respecto a un intermedio para la preparación de los Presentes compuestos anteriormente mencionados, se muestran a continuación los Ejemplos de Preparación de Referencia.

Ejemplo de Preparación de Referencia 1

- 40 1-(2-bromometil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona se preparó de acuerdo con las etapas mencionadas a continuación (1) a (3).

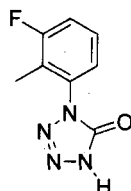
<etapa (1) >

- 45 Se añadieron 21,9 g de tricloruro de aluminio anhidro a 250 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 10,7 g y la mezcla se agitó durante quince minutos. Después, se añadieron 22,5 g de 1-fluoro-3-isocianato-2-metilbenceno y la mezcla

resultante se calentó a 80 °C durante tres horas y media. Después de un periodo de refrigeración, se añadió la solución de reacción a una mezcla de 34 g de nitrito de sodio, 2 l de agua y 500 g de hielo con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 27,5 g de 1-(2-metil-3-fluorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-fluorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,21 (3H, s), 7,07-7,36 (3H)

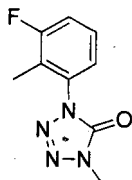


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,21 (3H, s), 7,07-7,36 (3H, m), 12,93 (1H, s).

15 <etapa (2)>

A una mezcla de 10,0 g de la 1-(2-metil-3-fluorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada y 100 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 2,47 g de hidruro de sodio al 55 % en enfriamiento con hielo. La mezcla de reacción se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadieron 3,5 ml de yoduro de metilo en enfriamiento con hielo. La mezcla se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante catorce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 10 %, agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,19 g de 1-(2-metil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

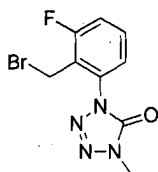


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,19 (3H, s), 3,70 (3H, s), 7,16-7,20 (2H, m), 7,29 (1H, dt, J = 5,9, 8,3 Hz).

<etapa (3) >

A una mezcla de 2,19 g de la 1-(2-metil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 0,52 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 2,16 g de N-bromosuccinimida y 40 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,36 g de 1-(2-bromometil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-bromometil-3-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,75 (3H, s), 4,64 (2H, s), 7,23-7,30 (2H, m), 7,47 (1H, dt, J = 5,9, 8,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 2

1-(2-bromometil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona se preparó de acuerdo con las etapas (1) a (3) mencionadas a continuación.

5

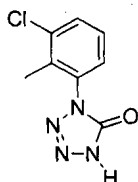
<etapa (1)>

Se añadieron 21,9 g de tricloruro de aluminio anhidro a 250 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 10,7 g y la mezcla se agitó durante quince minutos. Después, se añadieron a la misma 25,0 g de 1-cloro-3-isocianato-2-metilbenceno y la mezcla resultante se calentó a 80 °C durante cinco horas. Después de un periodo de refrigeración, se añadió la solución de reacción a una mezcla de 35 g de nitrito de sodio, 2 l de agua y 500 g de hielo con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 17,0 g de 1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

10

15

1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



20

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,32 (3H, s), 7,28-7,36 (2H, m), 7,57 (1H, dd, J = 6,8, 2,2 Hz), 13,08 (1H, s).

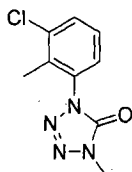
<etapa (2) >

A una mezcla de 10,0 g de la 1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada y 100 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 2,30 g de hidruro de sodio al 60 % en enfriamiento con hielo. La mezcla de reacción se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadieron 3,2 ml de yoduro de metilo en enfriamiento con hielo. La mezcla se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante catorce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 10 %, agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,56 g de 1-(2-metil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

30

35

1-(2-metil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,30 (3H, s), 3,73 (3H, s), 7,27 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,28 (1H, d, J = 7,1 Hz), 7,52 (1H, dd, J = 2,7, 6,8 Hz).

40

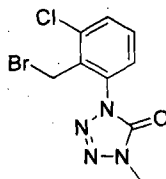
<etapa (3) >

A una mezcla de 1,56 g de la 1-(2-metil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 0,34 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 1,42 g de N-bromosuccinimida y 30 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,94 g de 1-(2-bromometil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

45

50

1-(2-bromometil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,76 (3H, s), 4,69 (2H, s), 7,35 (1H, dd, J = 1,2, 8,1 Hz), 7,43 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,58 (1H, dd, J = 1,2, 8,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 3

- 10 Una mezcla de 21,5 g de ácido 3-cloro-2-metilbenzoico, 17,6 g de dicloruro de oxalilo, aproximadamente 50 mg de N,N-dimetilformamida y 300 ml de tetrahidrofurano, se agitó a 25 °C durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar cloruro de 3-cloro-2-metilbenzoilo.

- 15 Una mezcla de 33,6 g de tricloruro de aluminio, 49,2 g de azida de sodio y 100 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. Después de que la mezcla de reacción se enfriará con hielo, y añadirse a la misma una mezcla de cloruro de 3-cloro-2-metilbenzoilo y tetrahidrofurano 100 ml y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a una mezcla de 75,6 g de nitrito de sodio y 500 ml de agua, se le añadió la mezcla de reacción con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

- 20 Una mezcla de la 1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 57,5 g de carbonato de potasio, 19,1 g de sulfato de dimetilo y 150 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio de sodio y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 21,6 g de 1-(2-metil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

Ejemplo de Preparación de Referencia 4

- 30 En enfriamiento, a una mezcla de 30 ml de cloroformiato de metilo y 50 ml de tetrahidrofurano se le añadieron gota a gota 5,00 g de 3-amino-1-cloro-2-metilbenceno y la mezcla se agitó a 25 °C durante media hora. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla se concentró a presión reducida para dar 5,80 g de 1-cloro-2-metil-3-metoxicarbonilaminobenceno.

- 40 Una mezcla de 5,80 g de 1-cloro-2-metil-3-metoxicarbonilaminobenceno, 7,53 g de pentacloruro de fósforo y 50 ml de clorobenceno, se agitó con calentamiento a reflujo durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar 1-cloro-3-isocianato-2-metilbenceno.

- 45 Una mezcla de 4,71 g de tricloruro de aluminio, 6,89 g de azida de sodio y 100 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante una hora. Después de que la mezcla de reacción se enfriara con hielo, se añadieron a la misma 1-cloro-3-isocianato-2-metilbenceno anteriormente mencionado y 10 ml de tetrahidrofurano y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a una mezcla de 10,59 g de nitrito de sodio y 300 ml de agua, se le añadió la mezcla de reacción con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

- 50 Una mezcla de la 1-(2-metil-3-clorofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 16,11 g de carbonato de potasio, 5,34 g de sulfato de dimetilo y 150 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio de sodio y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla se concentró a presión reducida para dar 4,80 g de 1-(2-metil-3-clorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

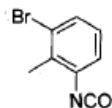
Ejemplo de Preparación de Referencia 5

- 60 Se preparó 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona de acuerdo con las etapas (1) a (4) mencionadas a continuación.

<etapa (1)>

Una mezcla de 25,0 g de 1-bromo-2-metil-3-aminobenceno, 60,0 g de trifosgeno y 400 ml de tolueno, se agitó con calentamiento a reflujo durante tres horas. La mezcla de reacción después de permanecer en enfriamiento, se concentró a presión reducida para dar 30,3 g de 1-bromo-3-isocianato-2-metilbenceno.

1-bromo-3-isocianato-2-metilbenceno

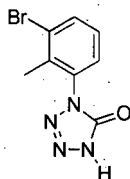


10 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,42 (3H, s), 7,00 (1H, dt, $J = 0,5, 8,0$ Hz), 7,05 (1H, dd, $J = 1,7, 8,0$ Hz), 7,39 (1H, dd, 1,5, 7,7 Hz).

<etapa (2) >

15 Se añadieron 19,7 g de tricloruro de aluminio anhidro a 220 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 9,6 g y la mezcla se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma 30,3 g del 1-bromo-3-isocianato-2-metilbenceno anteriormente mencionado (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 1) y la mezcla resultante se calentó a 80 °C durante cinco horas. Después de un periodo de refrigeración, se añadió la solución de reacción a una mezcla de 33 g de nitrito de sodio, 2 l de agua y 500 g de hielo con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 31,4 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

25 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

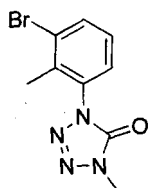


30 RMN ^1H (DMSO-d_6) δ : 2,22 (3H, s), 7,34 (1H, t, $J = 7,2$ Hz), 7,49 (1H, dd, $J = 8,2, 1,1$ Hz), 7,82 (1H, dd, $J = 8,0, 1,0$ Hz), 14,72 (1H, s).

<etapa (3) >

35 A una mezcla de 31,40 g de la 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada (descrito en el Ejemplo de Síntesis 9) y 250 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 5,90 g de hidruro de sodio al 60 % en enfriamiento con hielo. La mezcla de reacción se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadieron 8,4 ml de yoduro de metilo en enfriamiento con hielo. La mezcla se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante catorce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 10 %, agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 8,47 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

45 1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

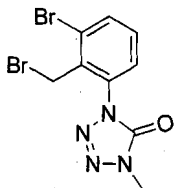


50 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,33 (3H, s), 3,73 (3H, s), 7,21 (1H, dt, $J = 0,5, 7,8$ Hz), 7,30 (1H, dd, $J = 1,0, 8,0$ Hz), 7,71 (1H, dd, $J = 1,2, 8,3$ Hz).

<etapa (4) >

A una mezcla de 8,447 g de la 1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 1,54 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 6,44 g de N-bromosuccinimida y 125 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 7,52 g de 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,76 (3H, s), 4,71 (2H, s), 7,34 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 8,0, 1,7 Hz), 7,77 (1H, dd, J = 7,8, 1,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 6

20 Una mezcla de 146,0 g de ácido 3-bromo-2-metilbenzoico, 94,8 g de dicloruro de oxalilo, aproximadamente 15 mg de N,N-dimetilformamida y 500 ml de tetrahidrofurano, se agitó a 25 °C durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar cloruro de 3-bromo-2-metilbenzoilo.

25 Una mezcla de 181,0 g de tricloruro de aluminio, 265,0 g de azida de sodio y 300 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. Después de que la mezcla de reacción se enfriara con hielo, y se añadieran a la misma una mezcla de cloruro de 3-bromo-2-metilbenzoilo y 200 ml de tetrahidrofurano y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a una mezcla de 407 g de nitrato de sodio y 1.500 ml de agua, se le añadió la mezcla de reacción con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

35 Una mezcla de la 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 310,0 g de carbonato de potasio, 103,0 g de sulfato de dimetilo y 500 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 142,0 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

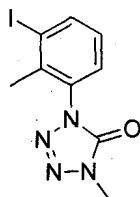
Ejemplo de Preparación de Referencia 7

45 Una mezcla de 10,00 g de ácido 3-yodo-2-metilbenzoico, 5,33 g de dicloruro de oxalilo, 5 gotas de N,N-dimetilformamida y 200 ml de tetrahidrofurano, se agitó a 25 °C durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar cloruro de 3-yodo-2-metilbenzoilo.

50 Una mezcla de 10,20 g de tricloruro de aluminio, 14,90 g de azida de sodio y 100 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. Después de que la mezcla de reacción se enfriara con hielo, y se añadieran a la misma una mezcla de cloruro de 3-yodo-2-metilbenzoilo y 100 ml de tetrahidrofurano y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a una mezcla de 22,90 g de nitrato de sodio y 200 ml de agua, se le añadió la mezcla de reacción con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metil-3-yodofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

55 Una mezcla de la 1-(2-metil-3-yodofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 17,40 g de carbonato de potasio, 5,78 g de sulfato de dimetilo y 150 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 8,10 g de 1-(2-metil-3-yodofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-yodofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

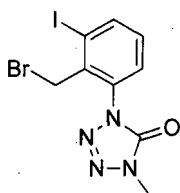


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,37 (3H, s), 3,72 (3H, s), 7,04 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,32 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,99 (1H, d, 8,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 8

10 A una mezcla de 8,10 g de 1-(2-metil-3-yodofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 7), 1,25 g de 1,11-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 5,24 g de N-bromosuccinimida y 100 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,11 g de 1-(2-bromometil-3-yodofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-bromometil-3-yodofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,75 (3H, s), 4,71 (2H, s), 7,17 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,39 (1H, d, J = 8,0 Hz), 8,04 (1H, d, J = 8,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 9

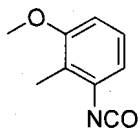
25 Se preparó 1-(2-bromometil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona de acuerdo con las etapas (1) a (4).

<etapa 1>

30 Una mezcla de 15,0 g de 3-amino-1-metoxi-2-metilbenceno, 48,7 g de trifosgeno y 350 ml de tolueno, se agitó con calentamiento a reflujo durante tres horas. La mezcla de reacción después de dejarse enfriar, se concentró a presión reducida para dar 17,0 g de 1-metoxi-3-isocianato-2-metilbenceno.

1-metoxi-3-isocianato-2-metilbenceno

35



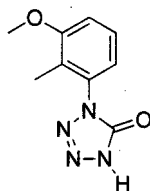
40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,19 (3H, s), 3,82 (3H, s), 6,69 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,72 (1H, dd, J = 0,5, 8,0 Hz), 7,09 (1H, t, J = 8,2 Hz).

<etapa 2>

45 Se añadieron 16,0 g de tricloruro de aluminio anhidro a 180 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 7,8 g y la mezcla se agitó durante quince minutos. Después, se añadieron 17,0 g de 1-metoxi-3-isocianato-2-metilbenceno y la mezcla resultante se calentó a 80 °C durante cuatro horas y media. Después de un periodo de refrigeración, se añadió la solución de reacción a una mezcla de 25 g de nitrito de sodio, 2 l de agua y 500 g de hielo con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión

reducida para dar 16,2 g de 1-(2-metil-3-metoxifenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-metoxifenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



5

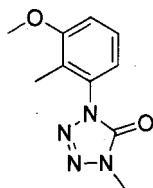
RMN ^1H (DMS- d_6) δ : 1,99 (3H, s), 3,87 (3H, s), 7,01 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,17 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,36 (1H, t, J = 8,3 Hz), 14,63 (1H, s).

10 <etapa 3>

A una mezcla de 10,0 g de la 1-(2-metil-3-metoxifenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada y 100 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 2,47 g de hidruro de sodio al 55 % en enfriamiento con hielo. La mezcla de reacción se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadieron 3,5 ml de yoduro de metilo en enfriamiento con hielo. La mezcla se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante catorce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 10 %, agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,19 g de 1-(2-metil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

20

1-(2-metil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



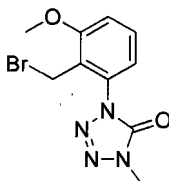
25 RMN ^1H (CDCl $_3$) δ : 2,11 (3H, s), 3,72 (3H, s), 3,88 (3H, s), 6,95 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,98 (1H, d, J = 8,5 Hz), 7,29 (1H, t, J = 8,2 Hz)

<etapa 4>

30 A una mezcla de 2,19 g de la 1-(2-metil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 0,52 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 2,16 g de N-bromosuccinimida y 40 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,36 g de 1-(2-bromometil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

35

1-(2-bromometil-3-metoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



40

RMN ^1H (CDCl $_3$) δ : 3,74 (3H, s), 3,96 (3H, s), 4,93 (2H, s), 7,02 (1H, dd, J = 1,0, 8,5 Hz), 7,04 (1H, d, J = 9,0 Hz), 7,43 (1H, t, J = 8,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 10

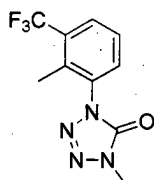
45

Una mezcla de 5,00 g de ácido 3-trifluorometil-2-metilbenzoico, 3,42 g de dicloruro de oxalilo, aproximadamente 50 mg de N,N-dimetilformamida y 200 ml de tetrahidrofurano, se agitó a 25 °C durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar cloruro de 3-trifluorometilo-2-metilbenzoilo.

Una mezcla de 6,53 g de tricloruro de aluminio, 9,55 g de azida de sodio y 100 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. Después de que la mezcla de reacción se enfriara con hielo, y se añadieran a la misma una mezcla de cloruro de 3-trifluorometilo-2-metilbenzoilo y 100 ml de tetrahidrofurano y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a una mezcla de 14,7 g de nitrito de sodio y 200 ml de agua, se le añadió la mezcla de reacción con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metil-3-trifluorometilfenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

- 10 Una mezcla de la 1-(2-metil-3-trifluorometilfenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 11,20 g de carbonato de potasio, 3,71 g de sulfato de dimetilo y 150 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio de sodio y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 5,13 g de 1-(2-metil-3-trifluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-trifluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

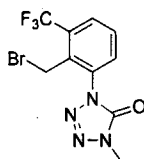


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,42 (3H, s), 3,75 (3H, s), 7,52 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,62 (1H, dd, J = 1,2, 7,7 Hz), 8,02 (1H, dd, J = 1,2, 8,2 Hz).

25 Ejemplo de Preparación de Referencia 11

A una mezcla de 1,00 g de 1-(2-metil-3-trifluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 10), 0,38 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 0,79 g de N-bromosuccinimida y 30 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,21 g de 1-(2-bromometil-3-trifluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

35 1-(2-bromometil-3-trifluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,77 (3H, s), 4,75 (2H, s), 7,62 (1H, d, J = 5,5 Hz), 7,63 (1H, d, J = 3,4 Hz), 7,85 (1H, dd, J = 3,6, 5,8 Hz).

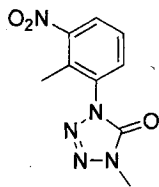
Ejemplo de Preparación de Referencia 12

- 45 Una mezcla de 5,0 g de ácido 3-nitro-2-metilbenzoico, 3,9 g de dicloruro de oxalilo, aproximadamente 50 mg de N,N-dimetilformamida y 200 ml de tetrahidrofurano, se agitó a 25 °C durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar cloruro de ácido 3-nitro-2-metilbenzoico.

- 50 Una mezcla de 7,4 g de tricloruro de aluminio, 11,0 g de azida de sodio y 100 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. Después de que la mezcla de reacción se enfriara con hielo, y se añadieran a la misma una mezcla de cloruro de 3-nitro-2-metilbenzoilo anteriormente mencionado y 100 ml de tetrahidrofurano y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a una mezcla de 16,6 g de nitrito de sodio y 200 ml de agua, se le añadió la mezcla de reacción con agitación. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico concentrado y después se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metil-3-nitrofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

Una mezcla de la 1-(2-metil-3-nitrofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente mencionada, 12,6 g de carbonato de potasio, 13,8 g de sulfato de dimetilo y 150 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 5,3 g de 1-(2-metil-3-nitrofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-nitrofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

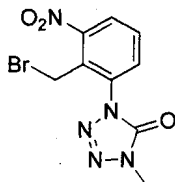


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,42 (3H, s), 3,75 (3H, s), 7,52 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,62 (1H, dd, J = 1,2, 7,7 Hz), 8,02 (1H, d, J = 1,2, 8,2 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 13

A una mezcla de 1,00 g de 1-(2-metil-3-nitrofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 12), 0,42 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 0,87 g de N-bromosuccinimida y 30 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,00 g de 1-(2-bromometil-3-nitrofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-bromometil-3-nitrofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

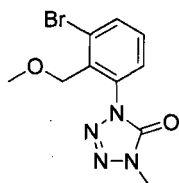


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,72 (3H, s), 5,63 (2H, s), 7,61 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,70 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,97 (1H, d, J = 8,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 14

Una mezcla de 45,0 g de 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 5), 37,4 g de metóxido de sodio y 600 ml de tetrahidrofurano 600 ml se agitó a 25 °C durante tres horas. A la mezcla de reacción se le añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla se concentró a presión reducida para dar 1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

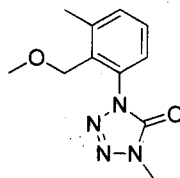


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 3,23 (3H, s), 3,72 (3H, s), 4,67 (2H, s), 7,33 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 1,2, 8,1 Hz), 7,76 (1H, dd, J = 1,5, 7,8 Hz).

Una mezcla de la 1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 23,2 g de

ácido metilborónico, 66,7 g de fluoruro de cesio, 10,6 g de aducto [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) dicloruro de diclorometano y 500 ml de dioxano, se agitó a 90 °C durante cinco horas y media. Después del enfriamiento de la mezcla de reacción, la mezcla se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1-(2-metoximetil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

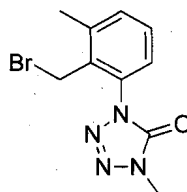
1-(2-metoximetil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,48 (3H, s), 3,23 (3H, s), 3,72 (3H, s), 4,42 (2H, s), 7,21 (1H, t, J = 5,1 Hz), 7,35 (2H, d, J = 4,8 Hz).

15 Una mezcla de la 1-(2-metoximetil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 50 ml de ácido acético y una solución de 50 ml de bromuro de hidrógeno al 25 %-ácido acético, se agitó a 65 °C durante una hora. A la mezcla de reacción se le añadió una solución salina saturada y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla se concentró a presión reducida para dar 27,9 g de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

20 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



25 RMN ¹H (CDCl₃) δ 2,51 (3H, s), 3,75 (3H, s), 4,51 (2H, s), 7,22-7,24 (1H, m), 7,36-7,39 (2H, m).

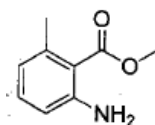
Ejemplo de Preparación de Referencia 15

30 También puede prepararse 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 14) de acuerdo con las etapas (1) a (5) mencionadas a continuación.

<etapa (1) >

35 A una mezcla de 15,1 g de éster etílico del ácido 2-amino-6-metilbenzoico, 150 ml de acetato de etilo y 150 ml de etanol, se le añadió una solución 2,0 M de trimetilsilil diazometano en éter dietílico en enfriamiento con hielo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante cuatro horas y se concentró a presión reducida para dar 16,5 g de éster metílico del ácido 2-amino-6-metilbenzoico.

40 éster metílico del ácido 2-amino-6-metilbenzoico

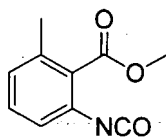


RMN ¹H (CDCl₃) δ 6,94 (1H, t, J = 8,0 Hz), 6,40-6,38 (2H, m), 4,96 (2H, s), 3,75 (3H, s), 2,29 (3H, s).

45 <etapa (2) >

50 A una mezcla de 16,5 g del éster metílico del ácido 2-amino-6-metilbenzoico anteriormente preparado y 300 ml de tolueno, se le añadieron 44,5 g de trifosgeno a temperatura ambiente y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas y media. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar éster metílico del ácido 2-isocianato-6-metilbenzoico.

éster metílico del ácido 2-isocianato-6-metilbenzoico



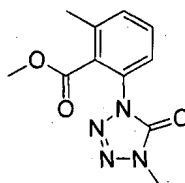
5 RMN ¹H (CDCl₃ δ: 7,28-7,24 (1H, m), 7,07-7,04 (1H, m), 6,98-6,95 (1H, m), 3,97 (3H, s), 2,36 (3H, s).

<etapa (3) >

10 En enfriamiento con hielo, a 200 ml de N,N-dimetilformamida se le añadieron 16,0 g de tricloruro de aluminio y la mezcla resultante se agitó durante media hora. Se añadieron a la misma, 7, 2 g de azida de sodio y la mezcla resultante se agitó durante una media hora, y después, se añadió a la misma el éster metílico del ácido 2-isocianato-6-metilbenzoico anteriormente preparado y la mezcla resultante se calentó a 80 °C durante ocho horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a la solución de reacción se le añadieron 11,5 g de nitrito de sodio y 300 ml de agua enfriada con hielo. La mezcla se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar éster metílico del ácido 2-metil-6-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)benzoico.

20 A una mezcla de éster metílico del ácido 2-metil-6-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)benzoico y 300 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 42,0 g de carbonato de potasio y 18,9 g de sulfato de dimetilo a temperatura ambiente y la mezcla resultante se agitó durante 24 horas. A la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 13,9 g del éster metílico del ácido 2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico.

25 éster metílico del ácido 2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico

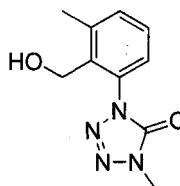


30 RMN ¹H (CDCl₃ δ: 7,50-7,46 (2H, m), 7,35-7,33 (1H, m), 3,83 (3H, s), 3,69 (3H, s), 2,48 (3H, s).

<etapa (4) >

35 A 0 °C, a una mezcla de 25,0 g del éster metílico del ácido 2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico y 300 ml de tetrahidrofurano se le añadió una solución 1,0 M de trietilborohidruro de litio en 201 ml de tetrahidrofurano y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una media hora. A la solución de reacción se le añadió agua, y la mezcla resultante se acidificó con ácido clorhídrico 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 21,2 g de 1-(2-hidroximetil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

40 1-(2-hidroximetil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,39-7,34 (2H, m), 7,21 (1H, dd, J = 6,5, 2,8 Hz), 4,48 (2H, s), 3,75 (3H, s), 2,57 (3H, s), 1,59 (1H, s a).

<etapa (5) >

50 A una mezcla de 21,2 g de la 1-(2-hidroximetil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada

y 300 ml de y cloroformo, se le añadieron 52,1 g de tribromuro de fósforo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. A la solución de reacción se le añadieron 200 ml de agua enfriada con hielo y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 26,0 g de 1-(2-bromometil-3-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

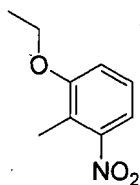
Ejemplo de Preparación de Referencia 16

Se preparó 1-(3-etoxi-2-bromometil-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona de acuerdo con las etapas (1) a (6) mencionadas a continuación.

<etapa (1) >

Una mezcla de 33,5 g de 2-metil-3-nitrofenol, 41 g de yodoetano, 90 g de carbonato de potasio y 400 ml de acetona, se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y se filtró. Después, el filtrado se concentró. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo y la capa orgánica se lavó con agua y solución salina, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 39,9 g de 1-etoxi-2-metil-3-nitrobenzeno.

1-etoxi-2-metil-3-nitrobenzeno

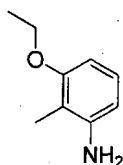


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,39 (1H, dd, $J = 8,2, 1,0$ Hz), 7,24 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,02 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 4,08 (2H, c, $J = 7,0$ Hz), 2,37 (3H, s), 1,50-1,42 (3H, m).

<etapa (2) >

Una mezcla de 39,9 del 1-etoxi-2-metil-3-nitrobenzeno anteriormente preparado, 4 g de paladio-carbón (paladio al 5 %) y 200 ml de etanol, se agitó con la adición de hidrógeno durante dieciocho horas. La mezcla resultante se filtró y el filtrado se concentró para dar 33,0 g de 3-etoxi-2-metil-anilina.

3-etoxi-2-metil-anilina

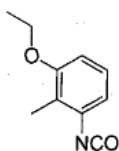


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 6,95 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 6,35 (1H, d, $J = 2,9$ Hz), 6,33 (1H, d, $J = 3,1$ Hz), 4,02-3,97 (2H, m), 3,61 (2H, s a), 2,05 (3H, s), 1,40 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

<etapa (3) >

A temperatura ambiente, a una mezcla de 33,0 g de la 3-etoxi-2-metil-anilina anteriormente preparada y 400 ml de tolueno, se le añadieron 25 g de trifosgeno y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar 37,2 g de 1-etoxi-3-isocianato-2-metilbenzeno.

1-etoxi-3-isocianato-2-metilbenzeno

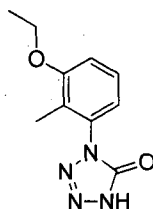


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,07 (1H, t, J = 8,2 Hz), 6,70 (1H, d, J = 7,7 Hz), 6,68 (1H, d, J = 8,2 Hz), 4,02 (2H, c, J = 7,0 Hz), 2,20 (3H, s), 1,42 (3H, t, J = 7,0 Hz).

<etapa (4) >

5 A 0 °C, a una mezcla de 350 ml de N,N-dimetilformamida y 33,6 g de tricloruro de aluminio, se le añadieron 15 g de azida de sodio y la mezcla resultante se agitó durante una hora. Después, se añadieron a la misma 37,2 g de 1-etoxi-3-isocianato-2-metilbenceno y la mezcla de reacción se calentó a 80 °C y se agitó durante cinco horas. La mezcla de reacción se enfrió, y a 0 °C, a la mezcla de reacción se le añadieron 100 ml de agua enfriada con hielo, seguido de una adición de una mezcla de 23 g de nitrito de sodio y 150 ml de agua. La mezcla se acidificó con una solución acuosa al 10 %, saturada de ácido clorhídrico para hacer el pH de aproximadamente 4. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y después, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 39,0 g de 1-(3-etoxi-2-metil-fenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(3-etoxi-2-metil-fenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

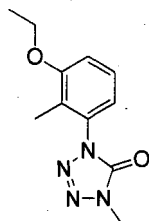


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,30 (1H, t, J = 8,1 Hz), 6,99 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,96 (1H, d, J = 8,0 Hz), 4,10 (2H, c, J = 6,9 Hz), 2,13 (3H, s), 1,46 (3H, t, J = 7,0 Hz).

<etapa (5) >

25 A 0 °C, a una mezcla de 400 ml de N,N-dimetilformamida, 39,0 g de la 1-(3-etoxi-2-metil-fenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 36,7 g de carbonato de potasio y 400 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 44,7 g de sulfato de dimetilo. La mezcla resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante siete horas. Se añadieron a la misma 100 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y después, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 38,2 g de 1-(3-etoxi-2-metilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

35 1-(3-etoxi-2-metil-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



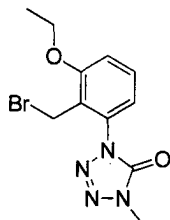
40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,29-7,23 (1H, m), 6,96 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,93 (1H, d, J = 8,2 Hz), 4,08 (2H, c, J = 6,9 Hz), 3,72 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,45 (3H, t, J = 7,1 Hz).

<etapa (6) >

45 Una mezcla de 38,2 g de la 1-(3-etoxi-2-metil-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 7,95 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 33,4 g de N-bromosuccinimida y 380 ml de clorobenceno, se agitó a 120 °C durante cinco horas. Después del enfriamiento de la solución de reacción, se añadió a la misma agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y después, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 38,2 g de 1-(3-etoxi-2-bromometil-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

50

1-(3-etoxi-2-bromometil-fenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

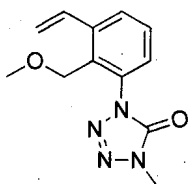


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,40 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,01 (2H, t, J = 8,3 Hz), 4,64 (2H, s), 4,17 (2H, c, J = 7,0 Hz), 3,74 (3H, s), 1,49 (3H, t, J = 6,9 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 17

- 10 Una mezcla de 29,8 g de 1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 14), 35,2 g de tributilvinilestaño, 11,6 g de tetraquis(trifenilfosfina)paladio y 500 ml de tolueno, se agitó con calentamiento a reflujo durante catorce horas. Después del enfriamiento de la solución de reacción, se añadió a la misma una solución acuosa saturada de cloruro de amonio y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 19,7 g de 1-(2-metoximetil-3-etenilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

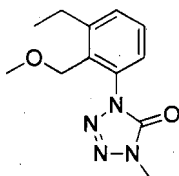
1-(2-metoximetil-3-etenilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,67 (1H, dd, J = 7,8, 1,3 Hz), 7,44 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,29 (1H, dd, J = 7,8, 1,3 Hz), 7,11 (1H, dd, J = 17,4, 11,1 Hz), 5,72 (1H, dd, J = 17,4, 1,3 Hz), 5,44 (1H, dd, J = 11,1, 1,3 Hz), 4,45 (2H, s), 3,72 (3H, s), 3,23 (3H, s).

- 25 Una mezcla de 19,7 g de la 1-(2-metoximetil-3-etenilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 3,02 g de complejo paladio frifoína y 1 l de metanol, se agitó a temperatura ambiente en atmósfera de hidrógeno durante once horas. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 19,3 g de 1-(2-metoximetil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

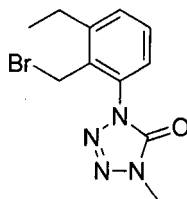
1-(2-metoximetil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,42-7,38 (2H, m), 7,23-7,20 (1H, m), 4,44 (2H, s), 3,72 (3H, s), 3,22 (3H, s), 2,82 (2H, c, J = 7,6 Hz), 1,27 (3H, t, J = 7,6 Hz).

- 40 Una mezcla de 19,3 g de la 1-(2-metoximetil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 40 ml de ácido acético y una solución de 40 ml de bromuro de hidrógeno al 25 %-ácido acético, se agitó a 65 °C durante una hora y media. A la mezcla de reacción se le añadió solución salina saturada y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla se concentró a presión reducida para dar 23,3 g de 1-(2-bromometil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

- 45 1-(2-bromometil-3-etilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,44-7,37 (2H, m), 7,23 (1H, dd, J = 7,1,2,0 Hz), 4,56 (2H, s), 3,75 (3H, s), 2,85 (2H, c, J = 7,6 Hz), 1,33 (3H, t, J = 7,6 Hz).

5

Ejemplo de Preparación de Referencia 18

1-(2-Bromometil-3-difluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidotetrazol-5-ona se preparó de acuerdo con las etapas (1) a (8) mencionadas a continuación.

10

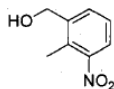
<etapa (1) >

Una mezcla de 9,4 g de borohidruro de sodio y 150 ml de tetrahidrofurano, se agitó a temperatura ambiente durante treinta minutos a 25 °C. Se añadieron a la misma 30,8 g de ácido 2-metil-3-nitrobenzoico y la mezcla resultante se agitó a 25 °C durante treinta minutos. La solución mezcla se enfrió con hielo y se añadió lentamente a la misma 11,0 ml de ácido metanosulfónico durante cuarenta y cinco minutos. La mezcla de reacción se agitó a 25 °C durante tres días. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 10 % y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 27,0 g de 3-hidroximetil-2-metil-1-nitrobenceno.

15

20

3-hidroximetil-2-metil-1-nitrobenceno



RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):1,81 (1H, s), 2,44 (3H, s), 4,79 (2H, s), 7,34 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,65 (1H, d, 7,6 Hz), 7,72 (1H, d, J = 8,1 Hz).

25

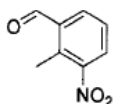
<etapa (2) >

Una mezcla de 17,0 g del 3-hidroximetil-2-metil-1-nitrobenceno anteriormente mencionado, 65,0 g de dióxido de manganeso y 170 ml de cloroformo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. La mezcla de reacción después de dejarse enfriar, se filtró a través de Celite y el filtrado se concentró a presión reducida para dar 14,0 g de 3-formil-2-metil-1-nitrobenceno.

30

3-formil-2-metil-1-nitrobenceno

35



RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):2,78 (3H, s), 7,53 (1H, t, J = 8,1 Hz), 7,97 (1H, dd, J = 1,5, 8,1 Hz), 8,06 (1H, dd, J = 1,5, 7,8 Hz), 10,39 (1H, s).

40

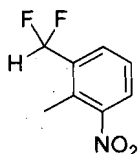
<etapa (3) >

A una mezcla de 13,0 g del 3-formil-2-metil-1-nitrobenceno anteriormente mencionado y 200 ml de cloroformo en enfriamiento a -78 °C, se le añadieron gota a gota 31,7 g de trifluoruro de N,N-dietilaminosulfuro y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante dieciséis horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con solución salina saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,8 g de 3-difluorometil-2-metil-1-nitrobenceno.

45

50

3-difluorometil-2-metil-1-nitrobenceno



RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):2,54 (3H, s), 6,84 (1H, t, J = 54,6 Hz), 7,45 (1H, t, J = 7,7 Hz), 7,78 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,89 (1H, d, J = 8,0 Hz)

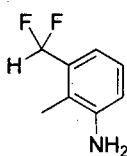
5

<etapa (4) >

Una mezcla de 6,80 g del 3-difluorometil-2-metil-1-nitrobenceno anteriormente mencionado, 0,30 g de platino al 5 %-carbono activado y 50 ml de metanol, se agitó a 35 °C en atmósfera de hidrógeno durante ocho horas. La mezcla de reacción se filtró a través de Celite y el filtrado se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,87 g de 3-difluorometil-2-metil-1-aminobenceno.

10

3-difluorometil-2-metil-1-aminobenceno



15

RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):2,20 (3H, s), 3,71 (2H, s), 6,72 (1H, t, J = 55,5 Hz), 6,79 (1H, d, J = 8,0 Hz), 6,92 (1H, d, J = 7,7 Hz), 7,09 (1H, t, J = 7,7 Hz).

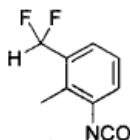
20

<etapa (5) >

Una mezcla de 3,87 g del 3-difluorometil-2-metil-1-aminobenceno anteriormente preparado, 10,96 g de trifosgeno y 80 ml de tolueno, se agitó con calentamiento a reflujo durante tres horas y media. La mezcla de reacción después de permanecer en enfriamiento, se concentró a presión reducida para dar 3-difluorometil-2-metil-1-isocianatobenceno.

25

3-difluorometil-2-metil-1-isocianatobenceno



30

RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):2,39 (3H, s), 6,74 (1H, t, J = 55,1 Hz), 7,21-7,27 (2H, m), 7,34 (1H, d, J = 7,2 Hz).

<etapa (6) >

Se añadieron 3,62 g de tricloruro de aluminio anhidro a 40 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla resultante se agitó durante veinte minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 1,76 g y la mezcla se agitó durante quince minutos. Después se añadió a la misma el 3-difluorometil-2-metil-1-isocianatobenceno anteriormente preparado (descrito en la <etapa (5)>) y la mezcla resultante se calentó a 80 °C durante cuatro horas. Después de un periodo de refrigeración, la solución de reacción se añadió a una mezcla de 6 g de nitrito de sodio, 0,5 l de agua y 100 g de hielo con agitación. La mezcla resultante se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 3,22 g de 1-(2-metil-3-difluorometilfenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

35

40

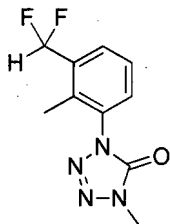
<etapa (7)>

Una mezcla de 3,22 g de la 1-(2-metil-3-difluorometilfenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 3,93 g de carbonato de potasio, 4,04 g de yoduro de metilo y 70 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a 25 °C durante cinco horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 10 %, agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre

50

gel de sílice para dar 1,14 g de 1-(2-metil-3-difluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-difluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



5

RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):2,31 (3H, s), 3,73 (3H, s), 6,83 (1H, t, J = 55,1 Hz), 7,44-7,46 (2H, m), 7,68-7,71 (1H, m).

<etapa (8) >

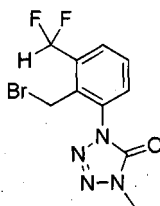
10

A una mezcla de 1,14 g de la 1-(2-metil-3-difluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona anteriormente preparada, 0,23 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 0,97 g de N-bromosuccinimida y 20 ml de clorobenceno se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. Después del enfriamiento de la solución de reacción, se añadió a la misma agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,21 g de 1-(2-bromometil-3-difluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

15

20

1-(2-bromometil-3-difluorometilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm):3,76 (3H, s), 4,66 (2H, s), 6,99 (1H, t, J = 54,8 Hz), 7,55 (1H, d, J = 8,0 Hz), 7,60 (1H, t, J = 7,7 Hz), 7,56 (1H, d, J = 7,5 Hz).

25

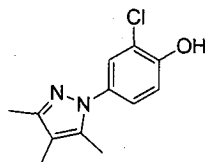
Ejemplo de Preparación de Referencia 19

30

Una mezcla de 3,0 g de sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 112), 1,5 g de 3-metil-2,4-pentanodiona, 100 ml de etanol, se agitó con calentamiento a reflujo durante doce horas. El disolvente se retiró por destilación y se añadieron a la misma 200 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó durante una hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano, y después se secaron a presión reducida para dar 3,3 g de 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol.

35

2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol



RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,43 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,24 (1H, dd, J = 8,7, 2,6 Hz), 7,07 (1H, d, J = 8,8 Hz), 2,15 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,92 (3H, s).

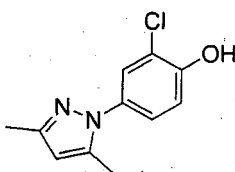
40

Ejemplo de Preparación de Referencia 20

45

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando acetilacetona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol



RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 8,66 (1H, s a), 7,46 (1H, d, $J = 2,6$ Hz), 7,26 (1H, dd, $J = 8,7, 2,6$ Hz), 7,10 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,07 (1H, s), 2,23 (3H, s), 2,14 (3H, s)

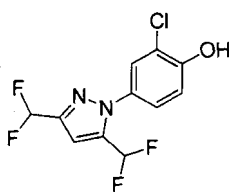
5

Ejemplo de Preparación de Referencia 21

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando 1,1,5,5-tetrafluoro-2,4-pentanodiona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(3,5-bis-difluorometil-pirazol-1-il)-fenol.

10

2-cloro-4-(3,5-bis-difluorometil-pirazol-1-il)-fenol

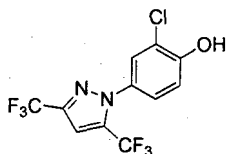


15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,53 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,33 (1H, dd, $J = 8,7, 2,6$ Hz), 7,15 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,94 (1H, s), 6,87-6,47 (2H, m), 5,81 (1H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 22

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando 1,1,1,5,5,5-hexafluoro-2,4-pentanodiona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(3,5-di(trifluorometil)-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(3,5-di-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol



25

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,52 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,35-7,31 (1H, m), 7,14 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 7,06 (1H, s), 5,93 (1H, s).

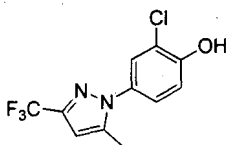
Ejemplo de Preparación de Referencia 23

30

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando 1,1,1-trifluoro-2,4-pentanodiona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol

35



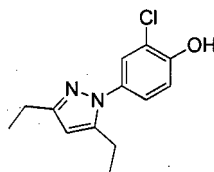
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,47 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,27 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 7,25 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,11 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,44 (1H, s), 5,79 (1H, s), 2,32 (2H, s).

40

Ejemplo de Preparación de Referencia 24

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando heptano-3,5-diona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(3,5-dietil-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(3,5-dietil-pirazol-1-il)-fenol

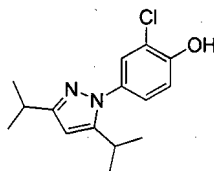


- 5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 10,56 (1H, s a), 7,42 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,24-7,21 (1H, m), 7,07 (1H, d, J = 8,8 Hz), 6,10 (1H, s), 2,60-2,52 (4H, m), 1,20-1,16 (3H, m), 1,11 (3H, dd, J = 7,9, 7,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 25

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando 2,6-dimetil-heptano-3,5-diona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(3,5-diisopropil-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(3,5-diisopropil-pirazol-1-il)-fenol

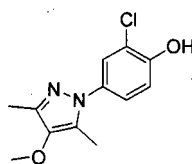


- 15 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,41-7,39 (1H, m), 7,21-7,17 (1H, m), 7,10-7,07 (1H, m), 6,12 (1H, s), 2,93-2,83 (2H, m), 1,21 (3H, d, J = 1,2 Hz), 1,19 (3H, d, J = 1,2 Hz), 1,10 (3H, s), 1,09 (3H, s).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 26

- Una mezcla de 2,5 g de yodosobenceno, 1,6 g de éter etílico de trifluoruro de boro, 20 ml de metanol y 1,14 g de 2,4-pentanodiona, se agitó a temperatura ambiente durante cinco horas. La mezcla resultante se concentró a presión reducida y se extrajo con *tert*-butil metil éter. La capa orgánica se lavó con solución acuosa de bicarbonato de sodio y agua, y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida y se añadieron a la misma 30 ml de etanol y 2 g de sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 112), y después, la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante dieciséis horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadieron a la misma 100 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante dos horas. Los precipitados se filtraron y se secaron a presión reducida para dar 0,75 g de 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenol

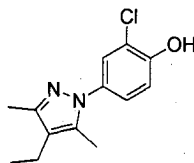


- 35 EM+; 253

Ejemplo de Preparación de Referencia 27

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando 3-etil-2,4-pentanodiona en lugar de 3-metil-2,4-pentanodiona dio 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol.

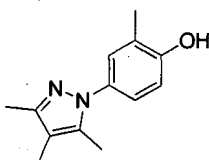
2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol



- 5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,45 (1H, s), 7,27-7,23 (1H, m), 7,11-7,07 (1H, m), 2,37 (2H, c, *J* = 7,5 Hz), 2,17 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,05 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 28

- 10 Una mezcla de 7,3 g de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 65), 50 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 50 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante treinta horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 400 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano, y se concentraron a presión reducida para dar 6,1 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol.
- 15

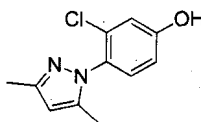


- 20 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,22 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,14 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,3 Hz), 6,91 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 2,22 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,97 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 29

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(2-cloro-4-metoxi-fenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 3-cloro-4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)-fenol.

3-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

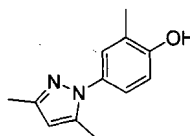


- 30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 10,65 (1H, s a), 7,02 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,76 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 6,55-6,52 (1H, m), 5,99 (1H, s), 2,32 (3H, s), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 30

- 35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 66) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

- 40 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

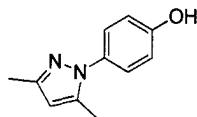


- 45 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,68 (1H, s a), 7,19 (1H, s), 7,10 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,3 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,13 (1H, s), 2,20 (6H, s), 2,16 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 31

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 74) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

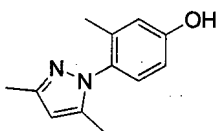


10 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,69-9,67 (1H, m), 7,22 (2H, dd, J = 6,6, 2,1 Hz), 6,83 (2H, dd, J = 6,6, 2,1 Hz), 5,98 (1H, s), 2,18 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 32

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-2-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 75) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 3-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

20 3-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

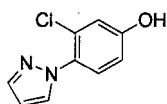


25 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,13 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,78 (1H, d, J = 2,4 Hz), 6,73 (1H, dd, J = 5,9, 2,7 Hz), 6,20 (1H, s), 2,23 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,88 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 33

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(2-cloro-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 76) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 3-cloro-4-(pirazol-1-il)-fenol.

3-cloro-4-(pirazol-1-il)-fenol

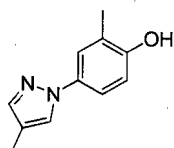


35 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,96 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,68-7,67 (1H, m), 7,34 (1H, d, J = 8,7 Hz), 6,98 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,85 (1H, dd, J = 8,7, 2,7 Hz), 6,47-6,45 (1H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 34

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 67) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol



50 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,04-8,03 (1H, m), 7,46 (1H, d, J = 2,8 Hz), 7,44 (1H, s), 7,34 (1H, dd, J = 8,6, 2,8 Hz), 6,82

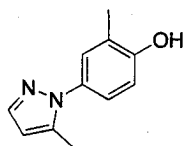
(1H, d, $J = 8,6$ Hz), 2,16 (3H, s), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 35

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 68) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenol

10



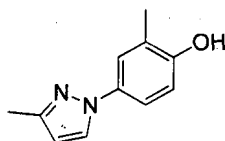
RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,50 (1H, d, $J = 1,5$ Hz), 7,17 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,09 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,87 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,22 (1H, d, $J = 1,5$ Hz), 2,24 (3H, s), 2,16 (3H, s).

15

Ejemplo de Preparación de Referencia 36

- 20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 68) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol



25

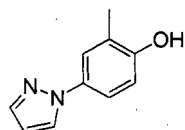
RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 8,13 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,46 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,35 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,81 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,23 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 2,23 (3H, s), 2,17 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 37

30

- Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 69) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(pirazol-1-il)-fenol.

35 2-metil-4-(pirazol-1-il)-fenol

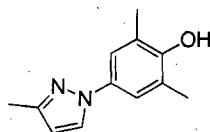


40 RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 8,27 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,65-7,63 (1H, m), 7,52 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,41 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,85 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,46 (1H, t, $J = 2,2$ Hz), 5,36 (1H, s a), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 38

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(3,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 77) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2,6-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2,6-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol



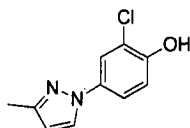
5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,14 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,33 (1H, s), 7,31 (2H, s), 6,23 (1H, d, J = 2,2 Hz), 2,23 (3H, s), 2,20 (6H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 39

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 78) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-cloro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2-cloro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol

15



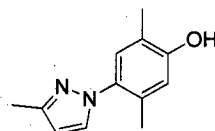
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,25 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,75 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,56 (1H, dd, J = 8,8, 2,7 Hz), 7,02 (1H, d, J = 8,8 Hz), 6,27 (1H, d, J = 2,2 Hz), 2,24 (3H, s).

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 40

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 81) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol



30

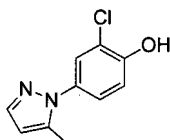
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,74 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,00 (1H, s), 6,70 (1H, s), 6,22 (1H, d, J = 2,2 Hz), 2,23 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 41

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-5-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 78) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-cloro-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenol.

40 2-cloro-4-(5-metil-pirazol-1-il)-fenol



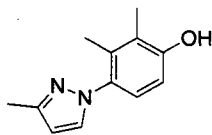
45 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 10,54 (1H, s), 7,50-7,49 (1H, m), 7,48-7,47 (1H, m), 7,28 (1H, ddd, J = 8,7, 2,6, 0,7 Hz), 7,06 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,22 (1H, dd, J = 1,7, 0,7 Hz), 2,27 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 42

50 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(2,3-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 82) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-

1H-pirazol dio 2,3-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2,3-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol



5

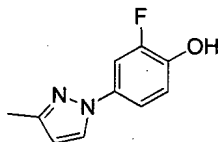
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,68 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 6,72 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 6,22 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 2,23 (3H, s), 2,10 (3H, s), 1,90 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 43

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(3-fluoro-4-metoxi-fenil)-3-metil-1 *H*-pirazol. (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 80) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-fluoro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

15

2-fluoro-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol

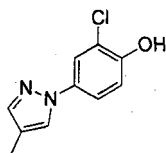


20 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,24 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,59 (1H, dd, *J* = 12,6, 2,6 Hz), 7,41 (1H, dc, *J* = 8,8, 1,2 Hz), 7,01 (1H, t, *J* = 8,8 Hz), 6,28 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 44

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-4-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 79) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol.

30 2-cloro-4-(4-metil-pirazol-1-il)-fenol

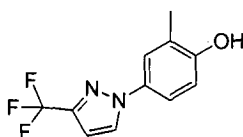


35 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,16-8,15 (1H, m), 7,74 (1H, dd, *J* = 2,6, 0,9 Hz), 7,55 (1H, dc, *J* = 8,8, 1,2 Hz), 7,49 (1H, s), 7,03 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 2,07 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 45

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 72) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol



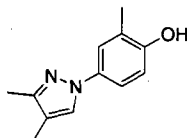
45

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,83-7,80 (1H, m), 7,45 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,32 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,4 Hz), 6,82 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,68 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 5,46 (1H, s), 2,29 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 46

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 70) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

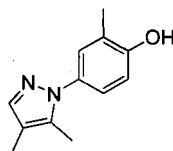


10 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,94 (1H, s), 7,41 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,29 (1H, dd, J = 8,5, 2,7 Hz), 6,80 (1H, d, J = 8,5 Hz), 2,15 (6H, s), 1,99 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 47

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 70) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(4,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

20 2-metil-4-(4,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

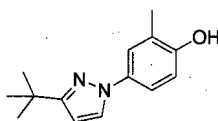


25 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,51 (1H, s), 7,17 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,08 (1H, dd, J = 8,5, 2,4 Hz), 6,88 (1H, d, J = 8,5 Hz), 2,16 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,01 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 48

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-*terc*-butil-1 H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 73) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(3-*terc*-butil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3-*terc*-butil-pirazol-1-il)-fenol

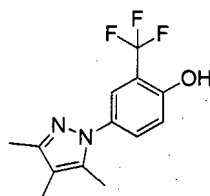


35 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,11 (1H, d, J = 2,4 Hz), 7,46 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,36 (1H, dd, J = 8,5, 2,7 Hz), 6,82 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,33 (1H, d, J = 2,2 Hz), 2,17 (3H, s), 1,29 (9H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 49

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-trifluorometil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 83) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-trifluorometil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol.

2-trifluorometil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol



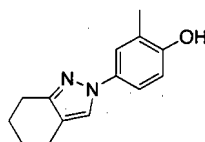
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 10,96 (1H, s), 7,59-7,55 (2H, m), 7,16-7,12 (1H, m), 2,16 (3H, s), 2,15 (3H, s), 1,94 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 50

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 2-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 71) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-il)-fenol.

2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-il)-fenol

10



RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,92 (1H, s), 7,43 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,31 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 6,79 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 2,61 (2H, t, *J* = 6,2 Hz), 2,55-2,51 (2H, m), 2,16-2,13 (3H, m), 1,79-1,72 (2H, m), 1,72-1,65 (2H, m).

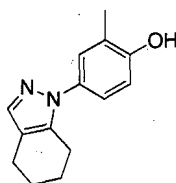
15

Ejemplo de Preparación de Referencia 51

- 20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 71) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(4,5,6,7-tetrahidro-indazol-1-il)-fenol

25



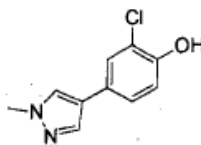
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,39 (1H, s), 7,20 (1H, s), 7,12-7,09 (1H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 2,64-2,59 (2H, m), 2,52-2,48 (2H, m), 2,16 (3H, s), 1,75-1,65 (4H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 52

30

- Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 85) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol.

35 2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol

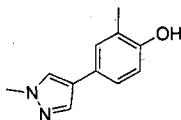


40 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,04 (1H, s), 7,77 (1H, s), 7,53 (1H, d, *J* = 2,0 Hz), 7,32 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,83 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 53

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 84) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol.

2-metil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol



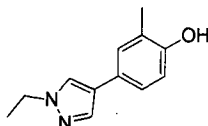
5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,92 (1H, s), 7,68 (1H, s), 7,24 (1H, s), 7,15 (1H, d, J= 8,2 Hz), 6,73 (1H, d, J= 8,5 Hz), 3,82 (3H, d, J= 0,7 Hz), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 54

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 86) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-etil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol.

2-metil-4-(1-etil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol

15



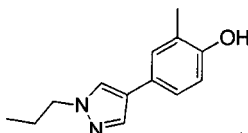
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,99 (1H, s), 7,70 (1H, s), 7,26 (1H, d, J= 1,2 Hz), 7,17 (1H, dd, J = 8,2, 2,4 Hz), 6,74 (1H, d, J = 8,2 Hz), 4,11 (2H, c, J = 7,2 Hz), 2,13 (3H, s), 1,38 (3H, dd, J = 7,8, 6,9 Hz).

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 55

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-propil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 87) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-propil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol.

2-metil-4-(1-propil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol



30

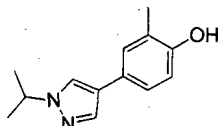
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,98 (1H, s), 7,71 (1H, s), 7,26 (1H, s), 7,19-7,14 (1H, m), 6,74 (1H, d, J= 8,2 Hz), 4,03 (2H, t, J= 6,9 Hz), 2,12 (3H, s), 1,83-1,73 (2H, m), 0,84 (3H, t, J = 7,2 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 56

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 88) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol.

40 2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol

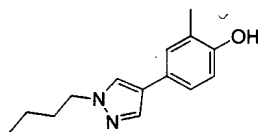


45 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,03 (1H, d, J= 1,5 Hz), 7,70 (1H, d, J= 1,7 Hz), 7,27 (1H, s), 7,17 (1H, d, J = 8,3 Hz), 6,75-6,72 (1H, m), 4,46 (1H, dt, J = 14,0, 6,0 Hz), 2,13 (3H, s), 1,43 (3H, d, J= 2,4 Hz), 1,41 (3H, d, J= 2,4 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 57

50 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-butil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 89) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-butil-1*H*-pirazol-4-il)-fenol.

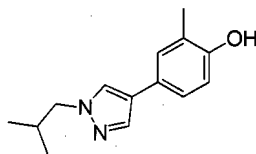
2-metil-4-(1-butil-1H-pirazol-4-il)-fenol



- 5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,97 (1H, s), 7,69 (1H, s), 7,26 (1H, s), 7,16 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,73 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,07 (2H, t, *J* = 6,8 Hz), 2,15-2,10 (3H, m), 1,79-1,72 (2H, m), 1,25 (2H, dd, *J* = 14,9, 7,6 Hz), 0,89 (3H, t, *J* = 7,4 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 58

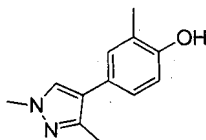
- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isobutil-1H-pirazol en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(1-isobutil-1H-pirazol-4-il)-fenol.



- 15 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,17 (1H, s), 7,94 (1H, s), 7,69 (1H, s), 7,26 (1H, s); 7,16 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,73 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,88 (2H, d, *J* = 7,0 Hz), 2,12 (3H, s), 0,84 (6H, d, *J* = 6,5 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 59

- 20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 90) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(1,3-dimetil-1H-pirazol-4-il)-fenol.

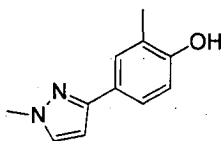


- 25 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,83 (1H, s), 7,10 (1H, s), 7,03 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,80 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,80 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 60

- 30 Una mezcla de 2,9 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 91), 21 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 21 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante veinte horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 100 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano, y se concentraron a presión reducida para dar 2,45 g de 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol



- 40 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,30 (1H, s), 7,64 (1H, s), 7,48 (1H, s), 7,38 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 6,76 (1H, d, *J* = 8,0 Hz), 6,50-6,49 (1H, m), 3,83 (3H, s), 2,14 (3H, s).

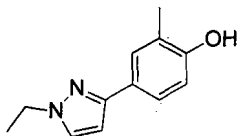
Ejemplo de Preparación de Referencia 61

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1H-pirazol

(descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 92) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

2-metil-4-(1-etil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol

5



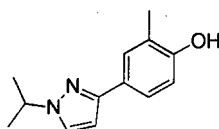
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,30 (1H, s a), 7,68 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,48 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,39 (1H, dd, J = 8,3, 2,2 Hz), 6,76 (1H, d, J = 8,3 Hz), 6,49 (1H, d, J = 2,2 Hz), 4,12 (2H, c, J = 6,2 Hz), 2,14 (3H, s), 1,38 (3H, t, J = 7,2 Hz).

10

Ejemplo de Preparación de Referencia 62

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 93) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-isopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

15



RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,30 (1H, s a), 7,71 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,49-7,48 (1H, m), 7,39 (1H, dd, J = 8,2, 2,2 Hz), 6,76 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,49 (1H, d, J = 2,2 Hz), 4,53-4,42 (1H, m), 2,15 (3H, s), 1,43 (6H, d, J = 6,5 Hz).

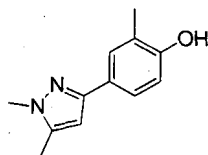
20

Ejemplo de Preparación de Referencia 63

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,5-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 95) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

25

2-metil-4-(1,5-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol



30

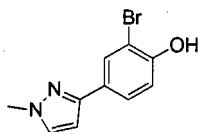
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,31 (1H, s a), 7,43 (1H, d, J = 1,7 Hz), 7,33 (1H, dd, J = 8,2, 2,2 Hz), 6,75 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,29 (1H, s), 3,71 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 64

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 3-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 94) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 2-bromo-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

40

2-bromo-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol



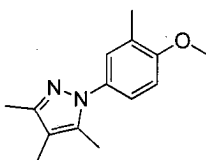
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,87-7,86 (1H, m), 7,69 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,60-7,57 (1H, m), 6,97 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,61-6,60 (1H, m), 3,85 (3H, s).

45

Ejemplo de Preparación de Referencia 65

Una mezcla de 10 g de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, 7,3 g de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 103), 18,4 g de acetato de cobre (II), 10,0 g de piridina, 20,0 g de tamices moleculares de 4 Å y 300 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante treinta horas. La mezcla de reacción se filtró a través de Celite y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 7,3 g de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol

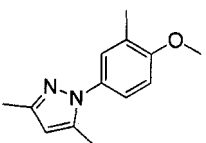


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,19-7,17 (1H, m), 7,14 (1H, dd, J = 8,5, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,5 Hz), 3,86 (3H, s), 2,24 (6H, s), 2,16 (3H, s), 1,97 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 66

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3,5-dimetil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol

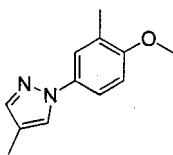


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,20 (1H, d, J = 2,0 Hz), 7,16 (1H, dd, J = 8,5, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,95 (1H, s), 3,86 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 67

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 4-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-metil-1*H*-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-metil-1*H*-pirazol

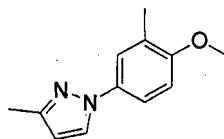


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, s), 7,48 (1H, s), 7,44 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 8,7, 2,7 Hz), 6,85 (1H, d, J = 8,7 Hz), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,15 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 68

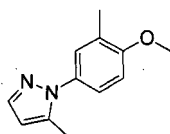
Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol y 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol



5 RMN ¹H (CDCl₃) δ 7,70 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,44 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,37 (1H, dd, J = 8,6, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,6 Hz), 6,20 (1H, d, J = 2,2 Hz), 3,85 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,26 (3H, s).

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol



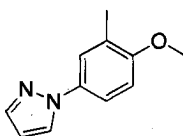
10

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,54 (1H, d, J = 1,7 Hz), 7,23-7,17 (2H, m), 6,87 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,17-6,15 (1H, m), 3,88 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,26 (3H, s).

15 Ejemplo de Preparación de Referencia 69

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol.

20 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol

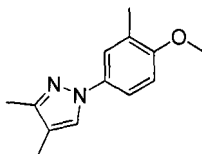


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,82-7,81 (1H, m), 7,69 (1H, d, J = 1,5 Hz), 7,48 (1H, d, J = 2,2 Hz), 7,42 (1H, dd, J = 8,6, 2,7 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,6 Hz), 6,43 (1H, t, J = 2,2 Hz), 3,86 (3H, s), 2,28 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 70

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3,4-dimetil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4-dimetil-1*H*-pirazol y 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5-dimetil-1*H*-pirazol.

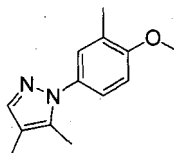
1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4-dimetil-1*H*-pirazol



35

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52 (1H, s), 7,41 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,32 (1H, dd, J = 8,7, 2,9 Hz), 6,82 (1H, d, J = 8,7 Hz), 3,84 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,06 (3H, s).

40 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5-dimetil-1*H*-pirazol

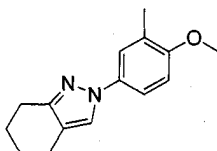


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,41 (1H, s), 7,20-7,15 (2H, m), 6,86 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,87 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 71

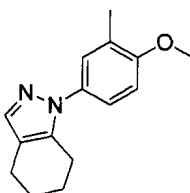
- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 4,5,6,7-tetrahidroindazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2*H*-indazol y 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol.

- 10 2-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2*H*-indazol



- 15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,51 (1H, s), 7,43 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,34 (1H, dd, $J = 8,7, 2,8$ Hz), 6,83 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 3,85 (3H, s), 2,77 (2H, t, $J = 6,2$ Hz), 2,61 (2H, t, $J = 6,1$ Hz), 2,25 (3H, s), 1,89-1,82 (2H, m), 1,81-1,74 (2H, m).

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1*H*-indazol

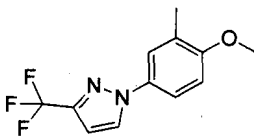


- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,42 (1H, s), 7,29-7,25 (1H, m), 7,22 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,85 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,86 (3H, s), 2,66 (2H, t, $J = 5,2$ Hz), 2,58 (2H, t, $J = 5,2$ Hz), 2,25 (3H, s), 1,83-1,74 (4H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 72

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3-trifluorometil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-1*H*-pirazol.

- 30 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-1*H*-pirazol

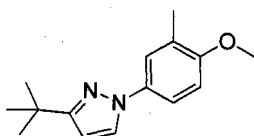


- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,83 (1H, dd, $J = 2,3, 0,9$ Hz), 7,48 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,43 (1H, dd, $J = 8,8, 2,7$ Hz), 6,87 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,68 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 3,87 (3H, s), 2,28 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 73

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3-*tert*-butil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-*tert*-butil-1*H*-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-*tert*-butil-1*H*-pirazol

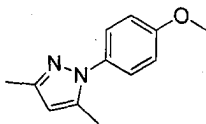


- 45 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,68 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,44 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,38 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,85-6,81 (1H, m), 6,27 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 3,84 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,37 (9H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 74

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3,5-dimetil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol

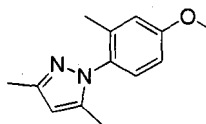


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,32 (2H, dt, *J* = 9,6, 2,8 Hz), 6,95 (2H, dt, *J* = 9,6, 2,8 Hz), 5,96 (1H, s), 3,84 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 75

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 4-metoxi-2-metil-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3,5-dimetil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-2-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol.

20 1-(4-metoxi-2-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol

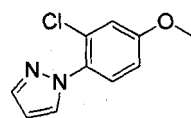


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,14 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,82-6,75 (2H, m), 5,94 (1H, s), 3,86-3,80 (3H, m), 2,28 (3H, s), 2,03 (3H, s), 2,01 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 76

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 2-cloro-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(2-cloro-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol.

1-(2-cloro-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol

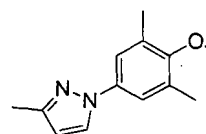


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,74 (2H, dd, *J* = 7,8, 2,1 Hz), 7,45 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 7,03 (1H, d, *J* = 2,9 Hz), 6,90 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,9 Hz), 6,45 (1H, t, *J* = 2,1 Hz), 3,85 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 77

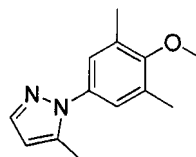
45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 3,5-dimetil-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3-metil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(3,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol y 1-(3,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-5-metil-1H-pirazol.

1-(3,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol



50 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,72 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,28 (2H, s), 6,20 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 3,73 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,33 (6H, s).

1-(3,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol

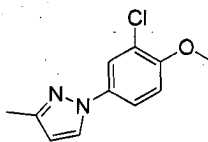


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,53 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 7,08 (2H, s), 6,16-6,15 (1H, m), 3,75 (3H, s), 2,32 (6H, s), 2,32 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 78

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 3-cloro-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol y 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol.

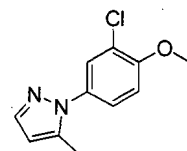
1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol



15

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,70 (2H, t, *J* = 2,3 Hz), 7,49 (1H, dd, *J* = 9,0, 2,7 Hz), 6,96 (1H, d, *J* = 9,0 Hz), 6,23 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 3,93 (3H, s), 2,37 (3H, s)

20 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol



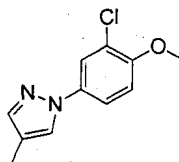
25

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,55 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 7,49 (1H, d, *J* = 2,6 Hz), 7,31 (1H, dd, *J* = 8,8, 2,6 Hz), 7,00 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,18-6,17 (1H, m), 3,95 (3H, s), 2,32 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 79

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 3-cloro-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 4-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-4-metil-1*H*-pirazol.

1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-4-metil-1*H*-pirazol



35

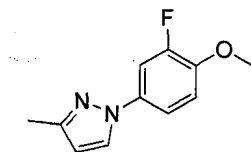
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,69 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,61-7,60 (1H, m), 7,51-7,48 (2H, m), 6,97 (1H, d, *J* = 9,0 Hz), 3,93 (3H, s), 2,15 (3H, s).

40 Ejemplo de Preparación de Referencia 80

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 3-fluoro-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(3-fluoro-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol.

45

1-(3-fluoro-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol



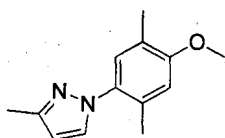
5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,70 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,44 (1H, dd, *J* = 12,2, 2,7 Hz), 7,33 (1H, dc, *J* = 8,9, 1,4 Hz), 6,99 (1H, t, *J* = 8,9 Hz), 6,22 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 3,91 (3H, s), 2,36 (3H; s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 81

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 2,5-dimetil-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol.

15 1-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol

15



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,40 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,09 (1H, s), 6,69 (1H, s), 6,17 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 3,86 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,18 (3H, s).

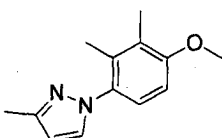
20

Ejemplo de Preparación de Referencia 82

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 2,3-dimetil-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, y usando 3-metil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(2,3-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol.

1-(2,3-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1*H*-pirazol

30



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,38 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,12 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,74 (1H, d, *J* = 8,8 Hz), 6,17 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 3,85 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,01 (3H, s).

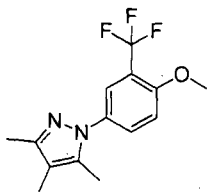
Ejemplo de Preparación de Referencia 83

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando ácido 4-metoxi-3-trifluorometil-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico dio 1-(4-metoxi-3-trifluorometil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol.

1-(4-metoxi-3-trifluorometil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol

40



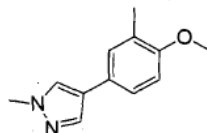
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,62 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,52 (1H, dd, *J* = 8,9, 2,7 Hz), 7,06 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 3,95 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,97 (3H, s).

45

Ejemplo de Preparación de Referencia 84

En atmósfera de nitrógeno, una mezcla de 1,62 g de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, 1,57 g de 4-bromo-1-metil-1H-pirazol, complejo de 0,79 g de complejo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II) dicloruro de diclorometano, 3,51 g de carbonato de sodio, 100 ml de dioxano y 30 ml de agua, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,3 g de 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

10 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol

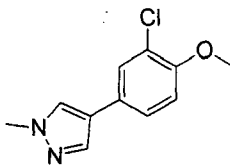


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, s), 7,52 (1H, s), 7,28-7,24 (2H, m), 6,82 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 3,93 (3H, s), 3,84 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 85

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 84 usando ácido 3-cloro-4-metoxi-fenilborónico en lugar de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico dio 1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol

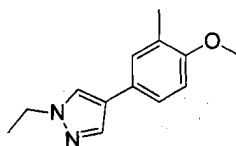


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, s), 7,54 (1H, s), 7,47 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,31 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,94 (3H, s), 3,91 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 86

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 84 usando 4-bromo-1-etil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 106) en lugar de 4-bromo-1-metil-1H-pirazol dio 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1H-pirazol.

35 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1H-pirazol

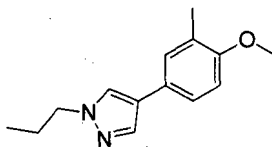


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,70 (1H, s), 7,56 (1H, s), 7,28-7,24 (2H, m), 6,82 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,19 (2H, c, *J* = 7,3 Hz), 3,84 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,52 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 87

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 84 usando 4-bromo-1-propil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 107) en lugar de 4-bromo-1-metil-1H-pirazol dio 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-propil-1H-pirazol.

4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-propil-1H-pirazol



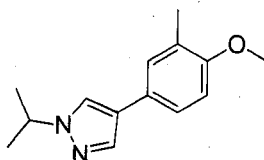
5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,70 (1H, s), 7,54 (1H, s), 7,29-7,24 (2H, m), 6,82 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 4,09 (2H, t, *J* = 7,1 Hz), 3,84 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,92 (2H, td, *J* = 14,5, 7,2 Hz), 0,94 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 88

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 84 usando 4-bromo-1-isopropil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 108) en lugar de 4-bromo-1-metil-1H-pirazol dio 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1 H-pirazol.

4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1H-pirazol

15



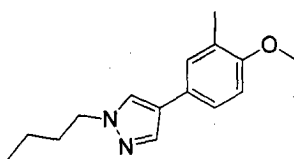
20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,71 (1H, s), 7,59 (1H, s), 7,29-7,26 (2H, m), 6,82 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 4,57-4,46 (1H, m), 3,84 (3H, s), 2,25 (3H, s), 1,54 (6H, d, *J* = 6,5 Hz).

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 89

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 84 usando 4-bromo-1-butil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 110) en lugar de 4-bromo-1-metil-1H-pirazol dio 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1 H-pirazol.

4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1 H-pirazol



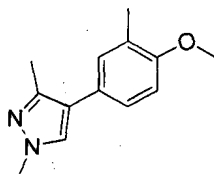
30

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,69 (1H, s), 7,54 (1H, s), 7,29-7,24 (2H, m), 6,82 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 4,13 (2H, t, *J* = 7,1 Hz), 3,84 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,91-1,84 (2H, m), 1,36 (2H, td, *J* = 14,9, 7,5 Hz), 0,95 (3H, t, *J* = 7,3 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 90

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 84 usando 4-bromo-1,3-dimetil-1H-pirazol en lugar de 4-bromo-1-metil-1H-pirazol dio 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1 H-pirazol.



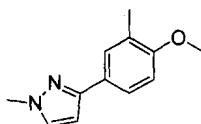
40

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,35 (1H, s), 7,19-7,14 (2H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,86 (3H, s), 3,85 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,25 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 91

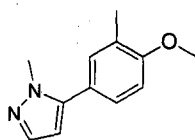
5 A temperatura ambiente, a una mezcla de 5,38 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 96) y 100 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 1,5 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante una media hora y se añadió a la misma 7.9 g de yoduro de metilo. La mezcla resultante se agitó durante doce horas y se añadió a la misma agua, y después, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,9 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol 2,9 g y 1,0 g de 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1 H-pirazol



15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61-7,58 (1H, m), 7,56 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,2 Hz), 7,34 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,3 Hz), 6,45 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 3,93 (3H, s), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s).

5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1 H-pirazol

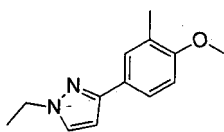


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 7,22-7,19 (2H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,24 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 3,88 (3H, s), 3,87 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 92

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 91 usando yoduro de etilo en lugar de yoduro de metilo dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1H-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1H-pirazol

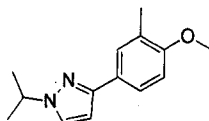


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, s), 7,57 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,38 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,45 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 4,20 (2H, c, *J* = 7,3 Hz), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,52 (3H, t, *J* = 7,4 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 93

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 91 usando isopropil yoduro en lugar de yoduro de metilo dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1H-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1H-pirazol

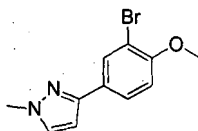


45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, s), 7,58-7,54 (1H, m), 7,42 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,45 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 4,60-4,50 (1H, m), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,54 (6H, d, *J* = 6,8 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 94

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 91 usando 3-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 97) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol dio 3-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol y 5-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.

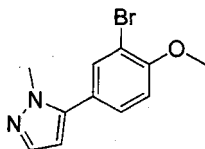
3-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol



10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,99 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,69 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,36 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 6,92 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,45 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 3,94 (3H, s), 3,92 (3H, s).

5-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol

15



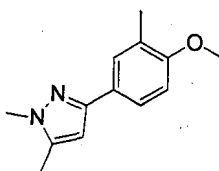
20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,50 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 7,33 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 6,99-6,96 (1H, m), 6,26 (1H, d, *J* = 1,7 Hz), 3,95 (3H, s), 3,87 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 95

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 91 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 98) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol y 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol.

25

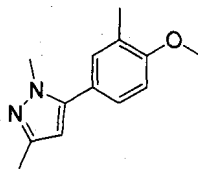
3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol



30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,56-7,55 (1H, m), 7,53-7,50 (1H, m), 6,82 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,24 (1H, d, *J* = 0,7 Hz), 3,84 (3H, s), 3,80 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,25 (3H, s).

5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol

35



40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,20-7,17 (2H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,02 (1H, s), 3,87 (3H, s), 3,79 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,26 (3H, s).

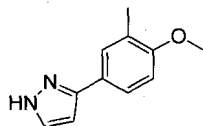
Ejemplo de Preparación de Referencia 96

A temperatura ambiente, a una mezcla de 7,69 g de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propanona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 98) y 100 ml de etanol se añadieron 9,8 ml de hidrato de hidrazina uno y la mezcla resultante se agitó durante veinticuatro horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para producir etanol en la mezcla de reacción aproximadamente 10 ml. El residuo resultante se sometió a una

45

cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol



5

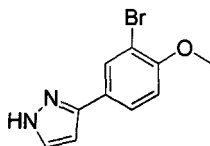
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 11,91 (1H, s a), 7,58 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,54-7,50 (2H, m), 6,84-6,80 (1H, m), 6,51 (1H, d, *J* = 2,0 Hz), 3,85 (3H, s), 2,24 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 97

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 96 usando 3-dimetilamino-1-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-propenona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 100) en lugar de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metilfenil)-propenona dio 3-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol.

15

3-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol

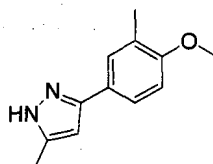


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,97 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,70-7,66 (1H, m), 7,61 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,55 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 3,93 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 98

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 96 usando 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-butano-1,3-diona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 101) en lugar de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propenona dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol.

30 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol



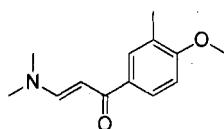
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,46 (2H, m), 6,83-6,80 (1H, m), 6,26 (1H, s), 3,84 (3H, s), 2,31 (3H, s), 2,23 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación de Referencia 99

Una mezcla de 5,76 g de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102) y 7,46 ml de N,N-dimetilformamida dietilacetal se agitó con calentamiento a reflujo durante veinticuatro horas. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 4,78 g de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propenona.

40

3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propenona



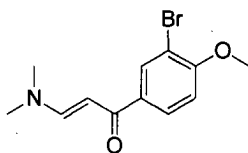
45

RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,76 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,72 (1H, s), 7,64 (1H, d, *J* = 12,4 Hz), 6,95 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,80 (1H, d, *J* = 12,4 Hz), 3,83 (3H, s), 3,11 (3H, s a), 2,90 (3H, s a), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 100

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 99 usando 1-(3-bromo-4-metoxi)-etanona en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona dio 3-dimetilamino-1-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-propenona.

5 3-dimetilamino-1-(3-bromo-4-metoxi-fenil)-propenona

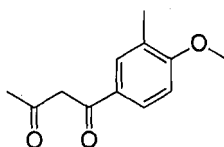


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,12 (1H, *d*, *J* = 2,2 Hz), 7,89 (1H, *dd*, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,80 (1H, *d*, *J* = 12,2 Hz), 6,91 (1H, *d*, *J* = 8,5 Hz), 5,65 (1H, *d*, *J* = 12,2 Hz), 3,94 (3H, *s*), 3,15 (3H, *s*), 2,96 (3H, *s*).

Ejemplo de Preparación de Referencia 101

15 A temperatura ambiente, a 50 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 3,07 g de hidruro de sodio al 55 % y 5,90 g de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó durante una media hora. Después, se añadieron a la misma 5,50 g de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102), 0,024 g de dibenzo-18-corona-6 y 1 ml de etanol y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas. A la mezcla de reacción se añadió agua y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,50 g de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona.

25 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona

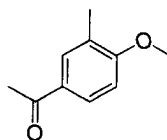


30 RMN ¹H (CDCl₃: 23 °C) δ: 7,76 (1H, *dd*, *J* = 8,6, 2,3 Hz), 7,69 (1H, *d*, *J* = 1,4 Hz), 6,85 (1H, *d*, *J* = 8,5 Hz), 6,12 (1H, *s*), 3,89 (3H, *s*), 2,25 (3H, *s*), 2,17 (3H, *s*).

Ejemplo de Preparación de Referencia 102

35 Una mezcla de 5,0 g de 1-(4-hidroxi-3-metil)-etanona, 5,70 g de yoduro de metilo, 20,0 g de carbonato de potasio y 200 ml de acetona, se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas. La mezcla de reacción se filtró y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después, se concentró a presión reducida para dar 5,3 g de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona.

1-(4-metoxi-3-metil)-etanona



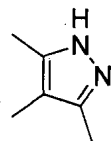
40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,82 (1H, *dd*, *J* = 8,5, 1,7 Hz), 7,79-7,76 (1H, *m*), 6,85 (1H, *d*, *J* = 8,5 Hz), 3,90 (3H, *s*), 2,55 (3H, *s*), 2,25 (3H, *s*).

Ejemplo de Preparación de Referencia 103

45 A 0 °C, a una mezcla de 5 ml de agua y 5 ml de ácido acético, se le añadieron 5,88 g de 3-metil-2,4-pentanodiona y 2,41 g de hidrato de hidrazina uno, y la mezcla resultante se agitó durante cinco horas. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua y hexano, y se secaron a presión reducida para dar 3,68 g de 3,4,5-torimetil-1*H*-pirazol.

50

3,4,5-trimetil-1H-pirazol

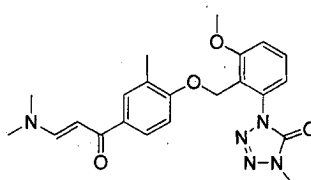


5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,19 (6H, s), 1,90 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 104

10 Una mezcla de 11,5 g de 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación 175) y 14 ml de N,N-dimetilformamida dietilacetal, se agitó con calentamiento a reflujo durante setenta y dos (72) horas. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 13,1 g 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

15 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



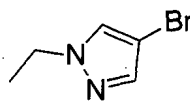
20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,76 (1H, d, J = 12,3 Hz), 7,71 (1H, dd, J = 8,6, 2,3 Hz), 7,68-7,66 (1H, m), 7,47 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,10-7,06 (2H, m), 6,88 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,69 (1H, d, J = 12,3 Hz), 5,32 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,57 (3H, s), 3,09 (3H, s a), 2,96 (3H, s a), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 106

25 A temperatura ambiente, a una mezcla de 3,0 g de 4-bromo-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 111) y 80 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 1,07 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante una media hora y se añadió a la misma yoduro de etilo y la mezcla resultante se agitó durante doce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, y después, la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice

30 para dar 2,72 g de 4-bromo-1-etil-1H-pirazol.

4-bromo-1-etil-1H-pirazol

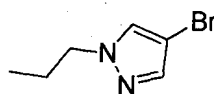


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, s), 7,41 (1H, s), 4,15 (2H, td, J = 7,5, 6,8 Hz), 1,47 (3H, td, J = 7,3, 0,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 107

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 106 usando yoduro de propilo en lugar de yoduro de etilo dio 4-bromo-1-propil-1H-pirazol.

4-bromo-1-propil-1H-pirazol



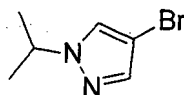
45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, s), 7,39 (1H, s), 4,06 (2H, t, J = 7,1 Hz), 1,87 (2H, td, J = 14,5, 7,3 Hz), 0,91 (3H, t, J = 7,3 Hz).

50

Ejemplo de Preparación de Referencia 108

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 106 usando isopropil yoduro en lugar de yoduro de etilo dio 4-bromo-1-isopropil-1H-pirazol.

5 4-bromo-1-isopropil-1H-pirazol

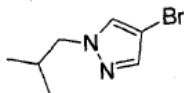


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, s), 7,43 (1H, s), 4,50-4,44 (1H, m), 1,49 (6H, d, J = 6,8 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 109

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 106 usando yoduro de isobutilo en lugar de yoduro de etilo dio 4-bromo-1-isobutil-1H-pirazol.

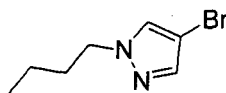
15 4-bromo-1-isobutil-1H-pirazol



20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, s), 7,37 (1H, s), 3,88 (2H, d, J = 7,3 Hz), 2,22-2,12 (1H, m), 0,90 (6H, d, J = 6,8 Hz).
Ejemplo de Preparación de Referencia 110

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 106 usando yoduro de butilo en lugar de yoduro de etilo dio 4-bromo-1-butil-1H-pirazol.

25 4-bromo-1-butil-1H-pirazol

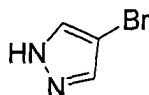


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44 (1H, s), 7,39 (1H, s), 4,09 (2H, t, J = 7,2 Hz), 1,82 (2H, ddd, J = 13,3, 8,8, 5,0 Hz), 1,32 (2H, td, J = 14,9, 7,5 Hz), 0,94 (3H, t, J = 7,3 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 111

A temperatura ambiente, a una mezcla de 50 g de 1H-pirazol y 700 ml de agua se le añadieron 137,0 g de N-bromosuccinimida y la mezcla resultante se agitó durante doce horas. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 80 g de 4-bromo-1H-pirazol.

40 4-bromo-1 H-pirazol



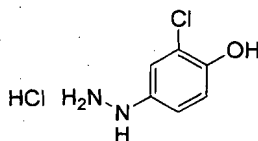
45 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (2H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 112

A 0 °C, a una mezcla de 100 g de 3-amino-2-clorofenol y 250 ml de ácido clorhídrico concentrado, se le añadieron lentamente 300 ml de una solución acuosa que contenía a 67,0 g de nitrito de sodio y seguido de la adición de 400 ml de agua. La mezcla resultante se agitó durante dos horas y se añadieron lentamente a la misma 292 g de cloruro de estaño (II) anhidro y 250 ml de ácido clorhídrico concentrado y la mezcla resultante se agitó durante una hora. A temperatura ambiente, la mezcla resultante se agitó durante doce horas adicionales, y después los precipitados se filtraron. El filtrado se lavó con ácido clorhídrico acuoso al 10 % y hexano y se secó a presión reducida para dar 105 g de sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol.

55

sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol

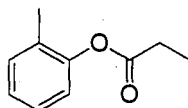


- 5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 10,00 (3H, s), 9,90 (1H, s), 7,92 (1H, s a), 1,01 (1H, d, J = 2,7 Hz), 6,93 (1H, d, J = 8,8 Hz), 6,85 (1H, dd, J = 8,8, 2,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 113

- 10 A 0 °C, a una mezcla de 10 g de O-cresol y 100 ml de cloroformo, se le añadieron 10 g de cloruro de propionilo y 28 g de trietilamina. La mezcla resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante dos horas. Después, la mezcla de reacción se extrajo con cloroformo y la capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 14 g de o-tolil éster del ácido propiónico.

- 15 o-tolil éster del ácido propiónico

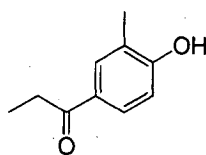


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,24-7,18 (2H, m), 7,15-7,11 (1H, m), 7,01-6,99 (1H, m), 2,61 (2H, c, J = 7,6 Hz), 2,17 (3H, s), 1,29 (3H, t, J = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 114

- 25 A 0 °C, a una mezcla de 150 ml de nitrometano ml y 14 g de o-tolil éster del ácido propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 113), se le añadieron 30 g de tricloruro de aluminio. La mezcla resultante se calentó a 50 °C y se agitó durante doce horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 200 ml de agua enfriada con hielo y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 8,8 g de 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona.

1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona



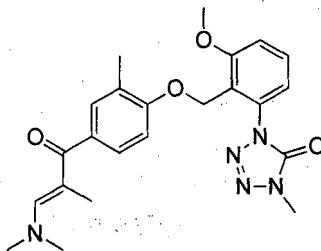
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, d, J = 1,9 Hz), 7,75 (1H, dd, J = 8,5, 2,2 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,65 (1H, s), 2,96 (2H, c, J = 7,2 Hz), 2,30 (3H, s), 1,22 (3H, td, J = 7,3, 1,3 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 115

- 40 Una mezcla de 3,5 g de 1-[2-(4-propionil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 176) y 2,6 g de N,N-dimetilformamida-dietil acetal se agitó a 100 °C durante treinta horas y se concentró a presión reducida para dar 3,9 g de 1-[2-[4-(3-dimetilamino-2-metil-acriloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

45

1-{2-[4-(3-dimetilamino-2-metil-acriiloil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

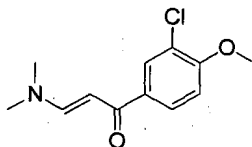


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49-7,44 (1H, m), 7,19-7,18 (2H, m), 7,10-7,05 (2H, m), 6,91 (1H, s), 6,82 (1H, d, *J* = 8,9 Hz), 5,28 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,60 (3H, s), 3,04 (6H, s), 2,11 (3H, s), 1,99 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 116

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 99 usando 1-1-(3-cloro-4-metoxi)-etanona en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona dio 3-dimetilamino-1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-propenona.

3-dimetilamino-1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-propenona

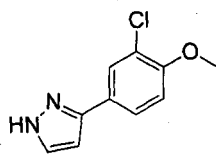


- 15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,95 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,84 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,2 Hz), 7,80 (1H, d, *J* = 12,3 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,65 (1H, d, *J* = 12,3 Hz), 3,95 (3H, s), 3,14 (3H, s), 2,95 (3H, s).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 117

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 96 usando 3-dimetilamino-1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-propenona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 116) en lugar de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metilfenil)-propenona dio 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol.

25 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol

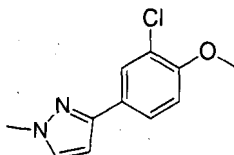


- 30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,78 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,61-7,59 (2H, m), 6,92 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 6,54 (1H, dd, *J* = 2,2, 0,7 Hz), 3,92 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 118

- 35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 91 usando 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 117) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol dio 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol y 5-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

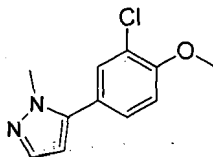
40 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,81 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,64 (1H, dd, $J = 8,6, 2,1$ Hz), 7,36 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 6,95 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,45 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 3,94 (3H, s), 3,93 (3H, s)

5-*(3-cloro-4-metoxi-fenil)*-1-metil-1*H*-pirazol

5



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,50 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,44 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,29-7,26 (1H, m), 7,01 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,26 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 3,96 (3H, s), 3,87 (3H, s).

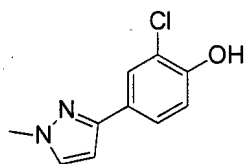
10

Ejemplo de Preparación de Referencia 119

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 3-*(3-cloro-4-metoxi-fenil)*-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 118) en lugar de 3-*(4-metoxi-3-metil-fenil)*-1*H*-pirazol dio 2-cloro-4-*(1-metil-1H-pirazol-3-il)*-fenol.

15

2-cloro-4-*(1-metil-1H-pirazol-3-il)*-fenol



20

RMN ^1H ($\text{DMSO-}D_6$) δ : 7,70 (2H, dd, $J = 7,2, 1,7$ Hz), 7,55 (1H, dd, $J = 8,5, 1,4$ Hz), 6,98 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,61-6,60 (1H, m), 3,85 (3H, s).

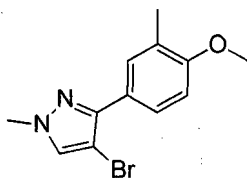
Ejemplo de Preparación de Referencia 120

25

A temperatura ambiente, una mezcla de 3 g de 3-*(4-metoxi-3-metil-fenil)*-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 91), 2,9 g de N-bromosuccinimida y 50 ml de cloroformo, se agitó durante dieciséis horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,9 g de 3-*(4-metoxi-3-metil-fenil)*-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol.

30

3-*(4-metoxi-3-metil-fenil)*-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol



35

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,69 (1H, dd, $J = 8,5, 2,4$ Hz), 7,63 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,43 (1H, s), 6,87 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,91 (3H, s), 3,86 (3H, s), 2,26 (3H, s).

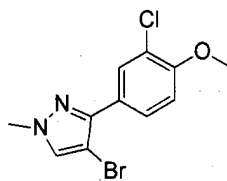
Ejemplo de Preparación de Referencia 121

40

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 120 usando 3-*(3-cloro-4-metoxi-fenil)*-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 118) en lugar de 3-*(4-metoxi-3-metil-fenil)*-1-metil-1*H*-pirazol dio 3-*(4-metoxi-3-cloro-fenil)*-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol.

45

3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-4-bromo-1-metil-1H-pirazol

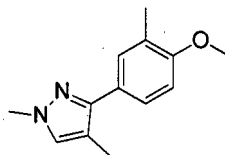


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,92-7,91 (1H, m), 7,79-7,76 (1H, m), 7,44 (1H, s), 6,98 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,94 (3H, s), 3,92 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 122

- 10 Una mezcla de 3,9 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 120), 80 ml de 1,4-dioxano, 20 ml de agua, 3,3 g de ácido metilborónico, 1,4 g de aducto 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II) dicloruro de diclorometano y 11,8 g de fosfato de potasio, se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol

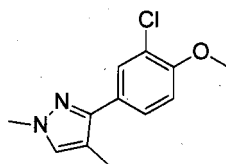


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,47 (1H, s), 7,43 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 7,16 (1H, s), 6,86 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,87 (3H, s), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,20 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 123

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 122 usando 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-4-bromo-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 121) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1-metil-1H-pirazol dio 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol.

- 30 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol



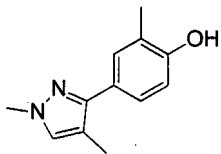
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,70 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,53 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,18 (1H, s), 6,97 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,93 (3H, s), 3,88 (3H, s), 2,20 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 124

- 40 Una mezcla de 2,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 122), 18 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 18 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante dieciséis horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 50 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano, y se secaron a presión reducida para dar 2,1 g de 4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

45

4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol



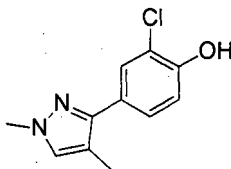
5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,58 (1H, s), 7,34 (1H, s), 7,25 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 6,83 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,81 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,13 (3H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 125

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 124 usando 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 123) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol dio 4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-cloro-fenol.

4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-cloro-fenol

15

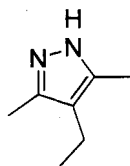


20 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,54 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,52 (1H, s), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,5, 1,9 Hz), 7,01 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,79 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 126

25 A temperatura ambiente, a una mezcla de 5 g de 3-etil-2,4-pentanodiona y 50 ml de etanol, se le añadieron 2,9 g de hidrato de hidrazina uno y la mezcla resultante se agitó durante cinco horas. El etanol se retiró por destilación y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,0 g de 3,5-dimetil-4-etil-1H-pirazol.

3,5-dimetil-4-etil-1H-pirazol



30

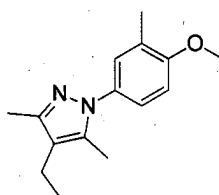
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,36 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,20 (6H, s), 1,07 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 127

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3,5-dimetil-4-etil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 126) en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-4-etil-1H-pirazol.

40 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-4-etil-1H-pirazol



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,19 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,14 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 3,86 (3H, s), 2,41

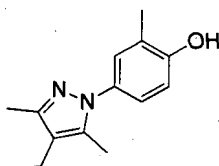
(2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,26 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,11 (3H, t, $J = 7,5$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 128

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-4- etil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 127) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol

10



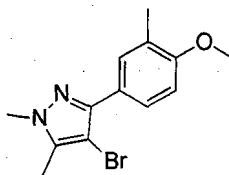
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,24 (1H, d, $J = 2,5$ Hz), 7,15 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,93-6,91 (1H, m), 2,43 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,25 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,07 (3H, t, $J = 7,6$ Hz)

15

Ejemplo de Preparación de Referencia 129

- A temperatura ambiente, una mezcla de 5,9 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,5-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 95), 5,8 g de N-bromosuccinimida y 100 ml de cloroformo se agitó durante diecisiete horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 4,0 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1,5-dimetil-1*H*-pirazol.

- 25 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1,5-dimetil-1*H*-pirazol



- RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,67 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,62 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 6,87 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,86 (3H, s), 3,84 (3H, s), 2,31 (3H, s), 2,26 (3H, s).

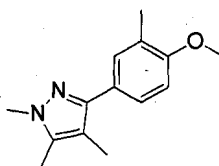
30

Ejemplo de Preparación de Referencia 130

- Una mezcla de 1,3 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1,5-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 129), 30 ml de 1,4-dioxano, 5 ml de agua, 1,0 g de ácido metilborónico, 0,4 g de aducto 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II) dicloruro de diclorometano y 3,7 g de fosfato de potasio, se agitó con calentamiento a reflujo durante nueve horas. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,6 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol.

40

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol



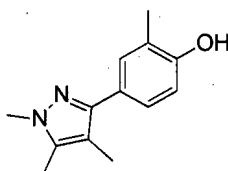
45

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43 (1H, s), 7,40 (1H, dd, $J = 8,2, 2,2$ Hz), 6,86 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,85 (3H, s), 3,80 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 131

Una mezcla de 0,6 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4,5-trimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 130), 5 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 5 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante trece horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 30 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano, y se secaron a presión reducida para dar 0,5 g de 4-(1,4,5-trimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

4-(1,4,5-trimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

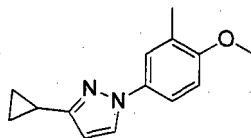


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,33 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,26 (1H, dd, $J = 8,2, 2,2$ Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 3,82 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,08 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 132

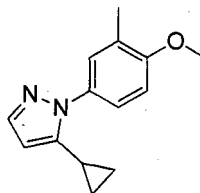
Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 3-ciclopropil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-ciclopropil-1H-pirazol y 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-ciclopropil-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-ciclopropil-1H-pirazol



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,67 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,43 (1H, d, $J = 2,9$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 6,83 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 6,05 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,07-2,00 (1H, m), 0,98-0,93 (2H, m), 0,80-0,76 (2H, m).

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-ciclopropil-1H-pirazol

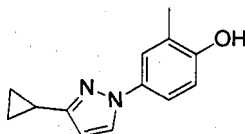


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,51 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,37-7,35 (2H, m), 6,89-6,87 (1H, m), 5,91 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 3,88 (3H, s), 2,27 (3H, s), 1,81-1,74 (1H, m), 0,97-0,93 (2H, m), 0,76-0,72 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 133

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 28 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-ciclopropil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 132) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-(4-metoxi-3-ciclopropil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

2-metil-(4-metoxi-3-ciclopropil-1H-pirazol-3-il)-fenol



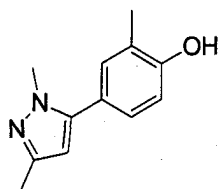
RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 8,10 (1H, d, $J = 1,4$ Hz), 7,45 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,35-7,32 (1H, m), 6,81 (1H, d, $J = 8,2$ Hz),

6,15-6,14 (1H, m), 2,16 (3H, s), 1,97-1,90 (1H, m), 0,91-0,87 (2H, m), 0,71-0,67 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 134

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 95) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol dio 2-metil-(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)-fenol.

10 2-metil-(1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il)-fenol

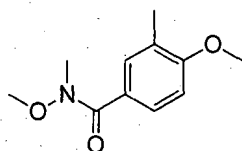


15 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,22 (1H, s), 7,15 (1H, dd, *J* = 8,2, 1,9 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,20 (1H, s), 3,77 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,16 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 135

- 20 A temperatura ambiente, a una mezcla de 5,0 g de ácido 4-metoxi-3-metil-benzoico y 100 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 4,0 g de cloruro de oxalilo y 0,2 ml de dimetilformamida. La mezcla resultante se agitó durante dos horas y media y después se concentró a presión reducida. Además, a la mezcla resultante se le añadieron 150 ml de cloroformo, 3,5 g de sal clorhidrato de N,O-dimetil-hidroxiamina y 9,3 g de N,N-diisopropil-etilamina a temperatura ambiente, y la mezcla resultante se agitó durante cuatro horas. Se añadió a la misma agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,1 g de 4-metoxi-N-metoxi-3-metil-N-metilbenzamida.

25 4-metoxi-N-metoxi-3-metil-N-metilbenzamida

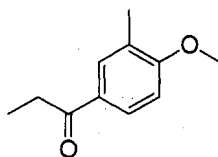


- 30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61-7,58 (1H, m), 7,54 (1H, dd, *J* = 2,1, 0,6 Hz), 6,81 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,87 (3H, s), 3,57 (3H, s), 3,35 (3H, s), 2,23 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 136

- 35 Una mezcla de 5,7 g de 4-metoxi-N-metoxi-3-metil-N-metilbenzamida (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 135), 100 ml de tetrahidrofurano y una solución 0,95 mol/l de bromuro de etilmagnesio en 43 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas. Se añadió a la misma una solución saturada de cloruro de amonio a temperatura ambiente y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 4,6 g de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona.

45 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona

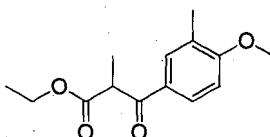


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,83 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,3 Hz), 7,79-7,78 (1H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 3,89 (3H, s), 2,95 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 2,25 (3H, s), 1,21 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 137

Una mezcla de 5,2 g de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propano-1-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 136), 100 ml de tetrahidrofurano, 4,1 g de *tert*-butóxido de potasio y 3,6 g de carbonato de dietilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas y media. Se añadió a la misma, una solución acuosa de 20 ml 6 N de ácido clorhídrico a temperatura ambiente y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,5 g de éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-oxo-propiónico.

éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-oxo-propiónico

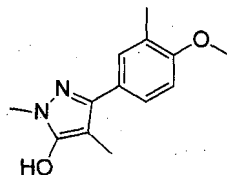


- 15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,86 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,3 Hz), 7,80 (1H, *d*, *J* = 2,2 Hz), 6,86 (1H, *d*, *J* = 8,7 Hz), 4,19-4,10 (3H, m), 3,90 (3H, s), 2,25 (3H, s), 1,47 (3H, *d*, *J* = 7,2 Hz), 1,19 (3H, *t*, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 138

- 20 Una mezcla de 3,5 g de éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 137), 100 ml de tolueno y 7,4 g de hidrazina de metilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante dieciocho horas. El tolueno se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadió una solución acuosa 3 N de ácido clorhídrico y los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano para dar 1,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-5-hidroxi-1*H*-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-5-hidroxi-1*H*-pirazol

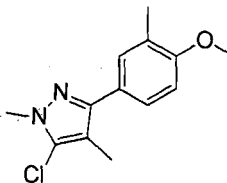


- 30 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,47-7,44 (2H, m), 7,07 (1H, *d*, *J* = 8,2 Hz), 3,84 (3H, s), 3,66 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 139

- 35 Una mezcla de 1,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-5-hidroxi-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 138) y 31,8 g de oxocloruro de fósforo, se agitó a 100 °C durante once horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,4 g de 5-cloro-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol.

5-cloro-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol

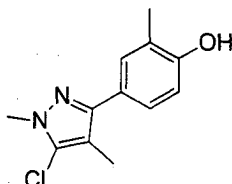


- 45 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,42-7,40 (2H, m), 6,98 (1H, *d*, *J* = 9,2 Hz), 3,81 (3H, s), 3,80 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 140

Una mezcla de 0,4 g de 5-cloro-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de preparación de la referencias 139 y 168), 3 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 3 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante quince horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 20 ml de acetato de etilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Los precipitados se filtraron y se lavaron con hexano, y se secaron a presión reducida para dar 0,3 g de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

10 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

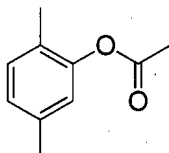


15 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,33 (1H, s), 7,24 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,83 (1H, d, J = 8,2 Hz), 3,78 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 141

A 0 °C, a una mezcla de 20 g de 2,5-dimetilfenol y 150 ml de cloroformo, se le añadieron 15 g de cloruro de acetilo y 49 g de trietilamina. La mezcla resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante cuatro horas. Después, la mezcla de reacción se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 24 g de 2,5-dimetilfenil éster del ácido acético.

25 2,5-dimetilfenil éster del ácido acético

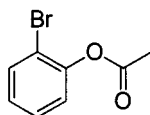


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,10 (1H, d, J = 7,7 Hz), 6,95 (1H, d, J = 7,2 Hz), 6,82 (1H, s), 2,31 (6H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 142

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 141 usando 2-bromofenol en lugar de 2,5-dimetilfenol dio 2-bromofenil éster del ácido acético.

35 2-bromofenil éster del ácido acético

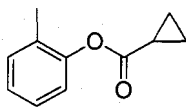


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, d, J = 7,3 Hz), 7,34 (1H, t, J = 7,3 Hz), 7,16-7,10 (2H, m), 2,36 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 143

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 113 usando cloruro de ciclopropanocarbonilo en lugar de cloruro de propionilo dio 2-metilfenil éster del ácido ciclopropano carboxílico.

2-metilfenil éster del ácido ciclopropano carboxílico.



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,24-7,17 (2H, m), 7,13 (1H, td, *J* = 7,38, 1,26 Hz), 7,01 (1H, dd, *J* = 7,67, 1,26 Hz), 2,19 (3H, s), 1,88 (1H, tt, *J* = 8,01, 3,78 Hz), 1,21-1,16 (2H, m), 1,06-1,00 (2H, m).

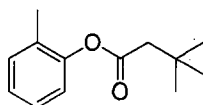
5

Ejemplo de Preparación de Referencia 144

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 113 usando cloruro de 3,3-dimetilbutanoilo en lugar de cloruro de propionilo dio 2-metilfenil éster del ácido 3,3-dimetilbutanoico.

10

2-metilfenil éster del ácido 3,3-dimetilbutanoico

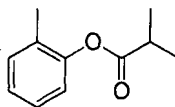


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,24-7,18 (2H, m), 7,13 (1H, td, *J* = 7,33, 1,37 Hz), 7,00 (1H, d, *J* = 7,33 Hz), 2,48 (2H, s), 2,20 (3H, s), 1,15 (9H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 145

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 113 usando cloruro de 2-metilpropionilo en lugar de cloruro de propionilo dio 2-metilfenil éster del ácido 2-metilpropiónico.

2-metilfenil éster del ácido 2-metilpropiónico



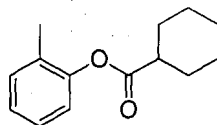
25

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,24-7,17 (2H, m), 7,13 (1H, t, *J* = 7,10 Hz), 6,98 (1H, d, *J* = 7,79 Hz), 2,89-2,80 (1H, m), 2,17 (3H, s), 1,34 (6H, d, *J* = 6,87 Hz).

30 Ejemplo de Preparación de Referencia 146

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 113 usando cloruro de ciclohexanocarbonilo en lugar de cloruro de propionilo dio 2-metilfenil éster ácido ciclohexano carboxílico.

35 2-metilfenil éster del ácido ciclohexano carboxílico

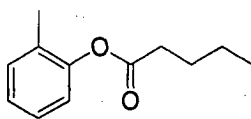


40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,24-7,17 (2H, m), 7,12 (1H, t, *J* = 7,33 Hz), 6,97 (1H, d, *J* = 8,01 Hz), 2,63-2,55 (1H, m), 2,16 (3H, s), 2,11-2,07 (2H, m), 1,88-1,80 (2H, m), 1,70-1,59 (2H, m), 1,43-1,28 (4H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 147

45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 113 usando cloruro de pentanoilo en lugar de cloruro de propionilo dio 2-metilfenil éster del ácido pentanoico.

2-metilfenil éster del ácido pentanoico



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,22-7,19 (2H, m), 7,13 (1H, td, J = 7,37, 1,09 Hz), 6,99 (1H, dd, J = 7,61, 1,09 Hz), 2,58 (2H, t, J = 7,61 Hz), 2,18 (3H, s), 1,80-1,73 (2H, m), 1,50-1,42 (2H, m), 0,98 (3H, t, J = 7,37 Hz).

5

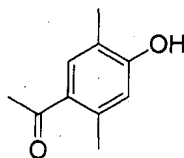
Ejemplo de Preparación de Referencia 148

A temperatura ambiente, a una mezcla de 24 g de 2,5-dimetilfenil éster del ácido acético (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 141) y 200 ml de nitrometano, se le añadieron 49 g de tricloruro de aluminio y la mezcla resultante se calentó a 50 °C. La mezcla resultante se agitó durante ocho horas y media y se añadieron a la misma 300 ml de agua enfriada con hielo. La mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 21 g de 1-(2,5-dimetil-4-hidroxi-fenil)-etanona.

10

15

1-(2,5-dimetil-4-hidroxi-fenil)-etanona

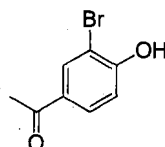


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,59 (1H, s), 6,64 (1H, s), 5,56 (1H, s), 2,55 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,26 (3H, s). Ejemplo de Preparación de Referencia 149

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 114 usando 2-bromofenil éster del ácido acético (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 142) en lugar de o-tolil éster ácido propiónico dio 1-(3-bromo-4-hidroxi-fenil)-etanona.

25

1-(3-bromo-4-hidroxi-fenil)-etanona



30

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,08 (1H, d, J = 8,01 Hz), 6,68-6,60 (2H, m), 5,31 (1H, s a), 2,30 (3H, s).

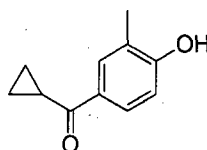
Ejemplo de Preparación de Referencia 150

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 114 usando 2-metilfenil éster del ácido ciclopropano carboxílico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 143) en lugar de o-tolil éster ácido propiónico dio ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona.

40

ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona



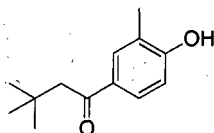
45

RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,85 (1H, d, J = 2,17 Hz), 7,80 (1H, dd, J = 8,45, 2,17 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,45 Hz), 6,15 (1H, s a), 2,68-2,61 (1H, m), 2,30 (3H, s), 1,25-1,20 (2H, m), 1,04-0,98 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 151

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 114 usando 2-metilfenil éster del ácido 3,3-dimetilbutanoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 144) en lugar de o-tolil éster del ácido propiónico dio 1-(4-hidroxi-3-metilfenil)-3,3-dimetilbutano-1-ona.

1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-3,3-dimetilbutano-1-ona

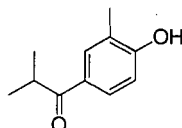


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,79-7,77 (1H, m), 7,72 (1H, dd, J = 8,47, 2,29 Hz), 6,83 (1H, d, J = 8,47 Hz), 6,23 (1H, s), 2,80 (2H, s), 2,29 (3H, s), 1,05 (9H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 152

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 114 usando 2-metilfenil éster del ácido 2-metilpropiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 145) en lugar de o-tolil éster del ácido propiónico dio 1-(4-hidroxi-3-metilfenil)-2-metil-propano-1-ona.

20 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-2-metil-propano-1-ona

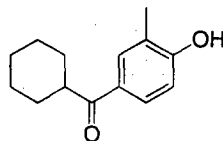


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, d, J = 2,18 Hz), 7,74 (1H, dd, J = 8,24, 2,18 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,24 Hz), 6,08 (1H, s), 3,57-3,49 (1H, m), 2,30 (3H, s), 1,20 (6H, d, J = 6,75 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 153

30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 114 usando 2-metilfenil éster del ácido ciclohexanoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 146) en lugar de o-tolil éster de ácido propiónico dio ciclohexil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona.

ciclohexil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona

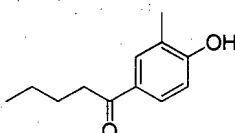


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,77 (1H, d, J = 2,17 Hz), 7,73 (1H, dd, J = 8,45, 2,17 Hz), 6,82 (1H, d, J = 8,45 Hz), 3,25-3,19 (1H, m), 2,29 (3H, s), 1,87-1,83 (4H, m), 1,76-1,25 (6H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 154

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 114 usando 2-metilfenil éster del ácido pentanoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 147) en lugar de o-tolil éster del ácido propiónico dio 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-pentano-1-ona.

45 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-pentano-1-ona

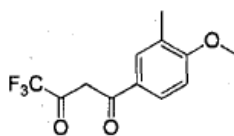


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80 (1H, d, J = 2,17 Hz), 7,74 (1H, dd, J = 8,45, 2,17 Hz), 6,85 (1H, d, J = 8,45 Hz), 6,28 (1H, s a), 2,92 (2H, t, J = 7,49 Hz), 2,31 (3H, t, J = 5,31 Hz), 1,75-1,67 (2H, m), 1,44-1,36 (2H, m), 0,95 (3H, t, J = 7,31 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 155

5 A temperatura ambiente, a una mezcla de 6,9 g de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102) y 200 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 11,9 g de éster etílico del ácido trifluoroacético y una solución al 20 % de etóxido de sodio en 28,5 g de etanol. La mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas. A la mezcla de reacción se añadió agua, y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa 6 N de ácido clorhídrico. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 10 g de

15 4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona

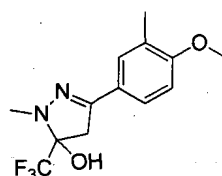


20 RMN ¹H (CDCl₃: 23 °C) δ: 7,84 (1H, dd, J = 8,7, 2,4 Hz), 7,75 (1H, dd, J = 1,7, 0,7 Hz), 6,90 (1H, d, J = 8,7 Hz), 6,51 (1H, s), 3,93 (3H, s), 2,27 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 156

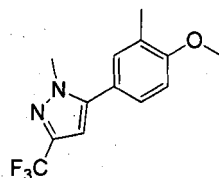
25 A 0 °C, a una mezcla de 6,8 g de 4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 155) y 100 ml de etanol, se le añadieron 1,7 g de hidrazina de metilo. La mezcla resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,2 g de 5-(4-metoxi-3-metilfenil)-2- metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol y 2 g de 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol.

30 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol



35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44-7,44 (1H, m), 7,33 (1H, dd, J = 8,5, 2,4 Hz), 6,79 (1H, d, J = 8,5 Hz), 3,85 (3H, s), 3,50 (1H, d, J = 17,6 Hz), 3,24 (1H, d, J = 17,6 Hz), 3,06 (3H, s), 2,87 (1H, s), 2,22 (3H, s).

5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol



40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,22-7,17 (2H, m), 6,91 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,48 (1H, s), 3,90 (3H, s), 3,89 (3H, s), 2,27 (3H, s).

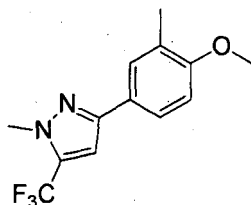
Ejemplo de Preparación de Referencia 157

45 Una mezcla de 2,3 g de 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 156), 4 ml de una solución acuosa 6 N de ácido clorhídrico y 30 ml de tetrahidrofurano se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de carbonato de sodio y solución salina

saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,2 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol

5



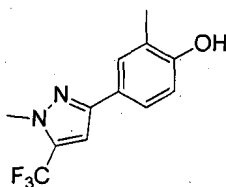
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,56-7,53 (2H, m), 6,85 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,81 (1H, s), 4,01 (3H, s), 3,86 (3H, s), 2,26 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 158

Una mezcla de 0,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 157), 24 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 24 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante doce horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 70 ml de agua enfriada con hielo. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua enfriada con hielo 70 ml, y después se secaron a presión reducida para dar 2 g de 2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

15

2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol



20

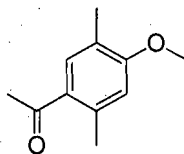
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,52 (1H, s), 7,57 (1H, s), 7,47 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 7,22 (1H, s), 6,80 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,96 (3H, s), 2,15 (3H, s).

25 Ejemplo de Preparación de Referencia 159

Una mezcla de 14,6 g de 1-(2,5-dimetil-4-hidroxi-fenil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 148), 16,6 g de yoduro de metilo, 26,8 g de carbonato de potasio y 200 ml de acetona, se agitó con calentamiento a reflujo durante ocho horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró, y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 15,1 g de 1-(4-metoxi-2,5-dimetil)-etanona.

30

1-(4-metoxi-2,5-dimetil)-etanona



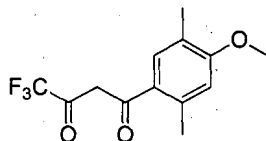
35

Ejemplo de Preparación de Referencia 160

A temperatura ambiente, a una mezcla de 6,9 g de 1-(4-metoxi-2,5-dimetil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 159) y 200 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 7,9 g de éster etílico del ácido trifluoroacético y una solución al 20 % de etóxido de sodio en 19 g de etanol. La mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante siete horas, y después a la mezcla de reacción se le añadieron 70 ml de agua y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa 6 N de ácido clorhídrico. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,8 g de 4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-butano-1,3-diona.

45

4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-butano-1,3-diona

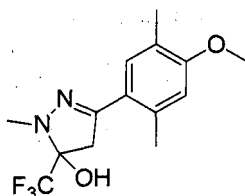


5 RMN ¹H (CDCl₃: 23 °C) δ: 7,44 (1H, s), 6,69 (1H, s), 6,35 (1H, s), 3,89 (3H, s), 2,57 (3H, s), 2,21 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 161

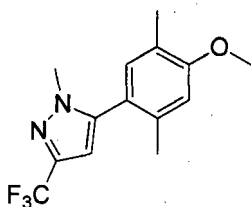
10 A 0 °C, a una mezcla de 6,8 g de 4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-butano-1,3-diona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 160) y 100 ml de etanol, se le añadieron 1,7 g de hidrazina de metilo. La mezcla resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,2 g de 5-(4-metoxi-2,5-dimetilfenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol y 3 g de 5-(4-metoxi-2,5-

15 5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol



20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,06 (1H, s), 6,67 (1H, s), 3,84 (3H, s), 3,59 (1H, d, *J* = 17,4 Hz), 3,27 (1H, d, *J* = 17,4 Hz), 3,06 (3H, s), 2,78 (1H, s), 2,53 (3H, s), 2,18 (3H, s).

5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol

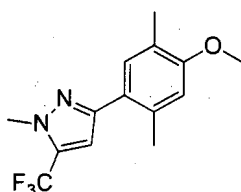


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 6,96 (1H, s), 6,75 (1H, s), 6,41 (1H, s), 3,87 (3H, s), 3,69 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,14 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 162

30 Una mezcla de 3,2 g de 5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 161), 5,3 ml de solución acuosa 6 N de ácido clorhídrico y 50 ml de tetrahidrofurano, se agitó con calentamiento a reflujo durante una hora. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de carbonato de sodio y solución salina saturada. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3 g de 3-(4-metoxi-2,5-

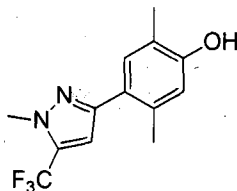
40 3-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,30 (1H, s), 6,70 (1H, s), 6,69 (1H, s), 4,03 (3H, s), 3,85 (3H, s), 2,43 (3H, s), 2,21 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 163

Una mezcla de 3 g de 3-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 162), 29 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 29 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante veintiuna horas. El disolvente se retiró por destilación y al residuo resultante se le añadieron 90 ml de agua enfriada con hielo. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua enfriada con hielo 90 ml y 100 ml de hexano, y después se concentró a presión reducida para dar 2,9 g de 2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

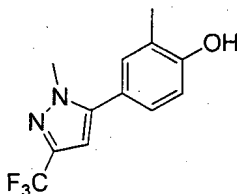


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,37 (1H, s), 7,26 (1H, s), 7,02 (1H, s), 6,66 (1H, s), 3,98 (3H, s), 2,32 (3H, s), 2,10 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 164

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 158 usando 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 156) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1*H*-pirazol dio 2-metil-4-(1-metil-3-trifluorometil-1*H*-pirazol-5-il)-fenol.

2-metil-4-(1-metil-3-trifluorometil-1*H*-pirazol-5-il)-fenol

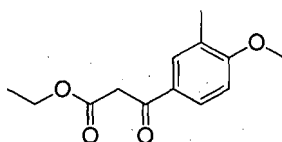


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,29 (1H, s), 7,22 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,74 (1H, s), 3,88 (3H, s), 2,17 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 165

A temperatura ambiente, a una mezcla de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102) y 200 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 16,1 g de carbonato de dietilo, 6,2 g de hidruro de sodio al 55 %, 0,05 g de dibenzo-18-crona-6 y 3 ml de etanol y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante ocho horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 14,8 g de éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico.

éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico

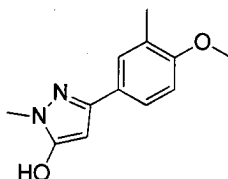


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,4 Hz), 7,76-7,76 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,21 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 3,93 (2H, s), 3,90 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,26 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 166

A temperatura ambiente, a una mezcla de 14,8 g del éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 165) y 100 ml de tolueno, se le añadieron 29 g de *N*-metil hidrazina y la mezcla resultante se agitó durante doce horas. El tolueno se retiró por destilación. A temperatura ambiente, a la mezcla de reacción se le añadieron 100 ml de agua y la mezcla resultante se acidificó con una

solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se agitó durante tres horas. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 400 ml de agua y 500 ml de acetato de etilo y después se secaron a presión reducida para dar 9,3 g de 5-hidroxi-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.



5

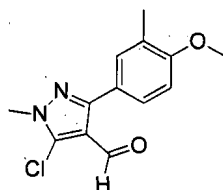
RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,58-7,56 (2H, m), 6,97 (1H, d, $J = 8,9$ Hz), 5,90 (1H, s), 3,81 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,18 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 167

A 0 °C, a 56 g de oxícloruro de fósforo, se les añadieron 4,0 g de N,N-dimetilformamida y la mezcla resultante se agitó durante una media hora. Se añadieron a la misma 9,3 g de 5-hidroxi-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 166). La mezcla resultante se agitó durante siete horas y el disolvente de reacción se retiró por destilación a presión reducida. A la mezcla de reacción se le añadieron 100 ml de agua enfriada con hielo y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,3 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

20

5-cloro-4-formil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol



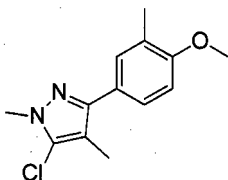
25 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 9,93 (1H, s), 7,55 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,51 (1H, s), 6,90 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,92 (3H, s), 3,88 (3H, s), 2,27 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 168

30 A 0 °C, a una mezcla de 0,3 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 167) y 10 ml de ácido trifluoroacético, se le añadieron 0,27 g de trietilsilano. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante tres horas y se añadieron a la misma 5 ml de agua. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,28 g de 5-cloro-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol.

35

5-cloro-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol



40

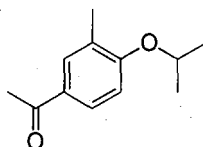
RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,42-7,40 (2H, m), 6,98 (1H, d, $J = 9,2$ Hz), 3,81 (3H, s), 3,80 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 169

45

Una mezcla de 10 g de 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-etanol, 13,6 g de yoduro de isopropilo, 18,4 g de carbonato de potasio y 250 ml de acetona se agitó con calentamiento a reflujo durante doce horas. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado resultante se concentró a presión reducida, y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 9,5 g de 1-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-etanol.

1-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-etanona



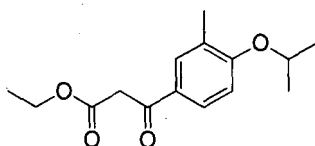
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,80-7,78 (2H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,69-4,60 (1H, m), 2,54 (3H, s), 2,23 (3H, s), 1,37 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 170

- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 9,4 g de 1-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 169) y 150 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 11,6 g de carbonato de dietilo, 4,5 g de hidruro de sodio al 55 %, 0,04 g de dibenzo-18-corona-6 y 3 ml de etanol y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante nueve horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 12,1 g de éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico.

éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico

20



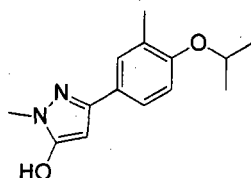
- 25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,79-7,76 (2H, m), 6,85-6,83 (1H, m), 4,68-4,62 (1H, m), 4,21 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 3,93 (2H, s), 2,22 (3H, s), 1,37 (6H, d, *J* = 6,0 Hz), 1,26 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 171

- 30 A temperatura ambiente, a una mezcla de 12,1 g del éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 170) y 100 ml de tolueno, se le añadieron 21 g de N-metil hidrazina, y la mezcla resultante se agitó durante doce horas. El tolueno se retiró por destilación a presión reducida. A temperatura ambiente, a la mezcla de reacción se le añadieron 100 ml de agua y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se agitó durante tres horas. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 400 ml de agua y 500 ml de acetato de etilo y después se secaron a presión reducida para dar 9,5 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

35

5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol



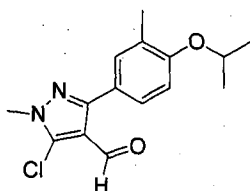
- 40 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,58-7,54 (2H, m), 7,01-6,98 (1H, m), 5,95 (1H, s), 4,66-4,60 (1H, m), 3,62 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,28 (6H, d, *J* = 5,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 172

- 45 A 0 °C, a 150 g de oxocloruro de fósforo, se les añadieron 10,9 g de N,N-dimetilformamida y la mezcla resultante se agitó durante una media hora. Se añadieron a la misma 28 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-

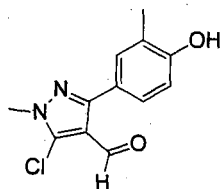
pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 171). La mezcla resultante se agitó durante diez horas a 100 °C y el disolvente de reacción se retiró por destilación a presión reducida. A la mezcla de reacción se le añadieron 100 ml de agua enfriada con hielo y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 21 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol, 1 g de 2-metil-4-(5-cloro-4-formil-1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol y 1 g de 4-formil-5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol



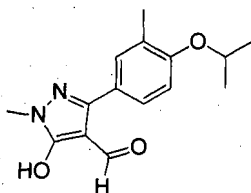
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,93 (1H, s), 7,52-7,50 (2H, m), 6,91-6,89 (1H, m), 4,63-4,54 (1H, m), 3,92 (3H, s), 2,25 (3H, s), 1,36 (6H, d, J = 6,0 Hz).

2-metil-4-(5-cloro-4-formil-1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,92 (1H, s), 7,52-7,51 (1H, m), 7,47 (1H, dd, J = 8,2, 2,3 Hz), 6,85 (1H, d, J = 8,2 Hz), 4,95 (1H, s), 3,93 (3H, s), 2,30 (3H, s).

4-formil-5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol

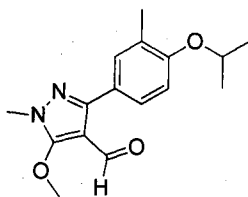


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 10,79 (1H, s), 9,45 (1H, s), 7,31-7,29 (2H, m), 7,08 (1H, d, J = 8,8 Hz), 4,74-4,65 (1H, m), 3,55 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,32 (6H, d, J = 5,9 Hz)

Ejemplo de Preparación de Referencia 173

A temperatura ambiente, a una mezcla de 4,8 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 172) y 100 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 0,6 g de metanol y 0,8 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se agitó durante tres horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 50 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 4,5 g de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol.

4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol

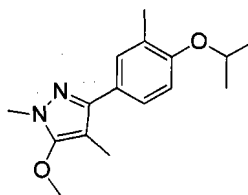


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,75 (1H, s), 7,39 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,63-4,54 (1H, m), 4,30 (3H, s), 3,71 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,36 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 174

- 10 A 0 °C, a una a mezcla de 4,2 g de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 173) y 20 ml de ácido trifluoroacético, se le añadieron 4,2 g de trietilsilano. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante seis horas, y el disolvente se retiró por destilación a presión reducida y se añadieron a la misma 10 ml de agua. La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,8 g de 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-5-metoxi-1H-pirazol.

1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1H-pirazol

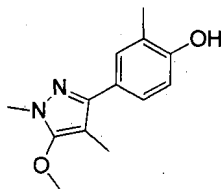


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43 (1H, dd, *J* = 2,1, 0,7 Hz), 7,37-7,34 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,57-4,51 (1H, m), 3,93 (3H, s), 3,71 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,35 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

25 Ejemplo de Preparación de Referencia 175

- Una mezcla de 7,4 g de 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 174) y 100 ml de una solución acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante quince horas. A continuación, se realizaron los siguientes tratamientos. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, y los precipitados resultantes se filtraron y se lavaron con agua fría para dar un sólido. De nuevo, el filtrado se concentró a presión reducida a aproximadamente medio volumen y se enfrió a 0 °C, y los precipitados resultantes se filtraron y se lavaron con agua fría para dar un sólido. Estos tratamientos se realizaron cuatro veces y todos los sólidos resultantes se secaron a presión reducida para dar 6,4 g de 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

- 35 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

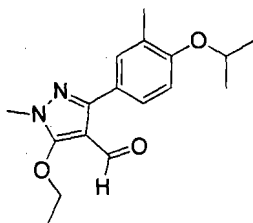


- 40 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,33 (1H, s), 7,29 (1H, s), 7,20 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,79 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,87 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,04 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 176

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 173 usando etanol en lugar de metanol dio 5-etoxi-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

5-etoxi-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.



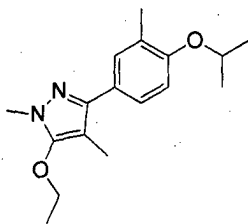
5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,74 (1H, s), 7,39 (1H, d, *J* = 1,8 Hz), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,63 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 4,61-4,55 (1H, m), 3,72 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,44 (3H, t, *J* = 7,1 Hz), 1,36 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 177

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 174 usando 5-etoxi-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 176) en lugar de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol dio 1,4-dimetil-5-etoxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol.

1,4-dimetil-5-etoxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol

15



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,38-7,35 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,57-4,51 (1H, m), 4,14 (2H, c, *J* = 7,0 Hz), 3,71 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,41 (3H, t, *J* = 7,0 Hz), 1,35 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

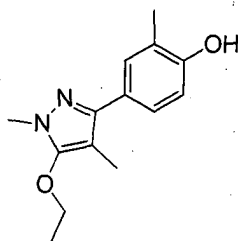
20

Ejemplo de Preparación de Referencia 178

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 175 usando 1,4-dimetil-5-etoxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 177) en lugar de 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol dio 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

25

4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol



30

RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,32 (1H, d, *J* = 1,4 Hz), 7,23 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,18 (2H, c, *J* = 7,0 Hz), 3,65 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,34 (3H, t, *J* = 7,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 179

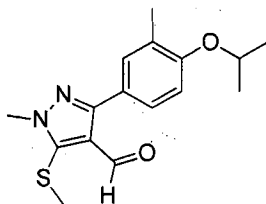
35

A temperatura ambiente, a una mezcla de 10 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 172) y de 100 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 2,9 g de tiometóxido de sodio y la mezcla resultante se agitó durante ocho horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 50 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 10,4 g de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-

40

pirazol.

4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol



5

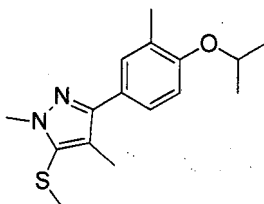
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 10,02 (1H, s), 7,50-7,48 (2H, m), 6,91-6,89 (1H, m), 4,62-4,56 (1H, m), 4,02 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,25 (3H, s), 1,36 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 180

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 174 usando 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 179) en lugar de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol dio 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol.

15

1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol



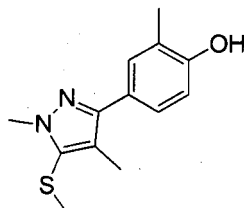
20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, dd, *J* = 2,2, 0,6 Hz), 7,39 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,3 Hz), 6,87 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,58-4,52 (1H, m), 3,99 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,35 (6H, d, *J* = 6,2 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 181

25 Una mezcla de 8,9 g de 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 180) y 120 ml de una solución acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante veinte horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C y se añadieron a la misma 50 ml de agua enfriada con hielo. Los precipitados resultantes se filtraron y se lavaron con agua fría y hexano, y se secaron a presión reducida para dar 7,3 g de 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

30

4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

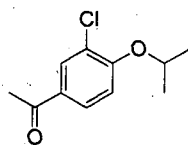


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,33 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,2 Hz), 6,80 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,99 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 182

40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 169 usando 1-(3-cloro-4-hidroxi-fenil)-etanona en lugar de 1-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-etanona dio 1-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-etanona.

1-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-etanona



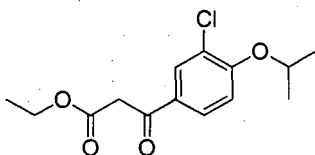
5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,99 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,83 (1H, dd, $J = 8,7, 2,2$ Hz), 6,96 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 4,73-4,64 (1H, m), 2,55 (3H, s), 1,42 (6H, d, $J = 6,3$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 183

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 170 usando 1-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 182) en lugar de 1-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-etanona dio 3 éster etílico del ácido -(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-3-oxo-propiónico.

éster etílico del ácido 3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-3-oxo-propiónico

15



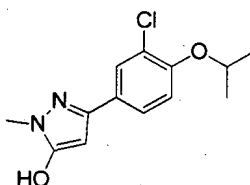
20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,98 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,83 (1H, dd, $J = 8,7, 2,2$ Hz), 6,96 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 4,72-4,62 (1H, m), 4,22 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,92 (2H, s), 1,42 (6H, d, $J = 6,0$ Hz), 1,27 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 184

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 171 usando éster etílico del ácido 3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 183) en lugar de éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico dio 5-hidroxi-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

5-hidroxi-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol



30

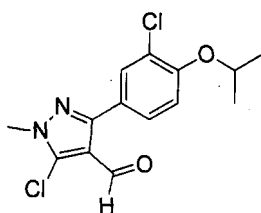
RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 7,77 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,65-7,62 (1H, m), 7,18 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,90 (1H, s), 4,72-4,66 (1H, m), 3,58 (3H, s), 1,30 (6H, d, $J = 6,0$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 185

35

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 172 usando 5-hidroxi-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 184) en lugar de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol dio 5-cloro-4-formil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

40 5-cloro-4-formil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-1-metil-1H-pirazol



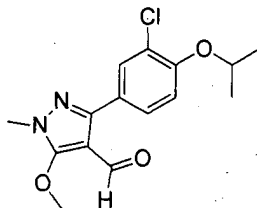
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 9,93 (1H, s), 7,84-7,83 (1H, m), 7,69-7,66 (1H, m), 7,00 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 4,66-4,60 (1H, m), 3,93 (3H, s), 1,41 (6H, d, $J = 6,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 186

5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 173 usando 5-cloro-4-formil-3-(3-cloro-4-isopropoxifenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 185) en lugar de 5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 4-formil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol.

10

4-formil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol



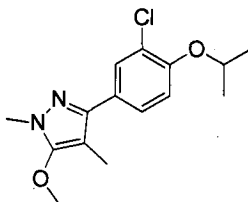
15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 9,75 (1H, s), 7,65 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,44 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,01 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 4,65-4,59 (1H, m), 4,30 (3H, s), 3,72 (3H, s), 1,42-1,39 (6H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 187

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 174 usando 4-formil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 186) en lugar de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol dio 1,4-dimetil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol.

25

1,4-dimetil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol



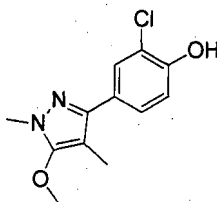
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,60 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,44 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 6,99 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 4,62-4,56 (1H, m), 3,99 (3H, s), 3,75 (3H, s), 2,15 (3H, s), 1,40 (6H, d, $J = 6,0$ Hz).

30

Ejemplo de Preparación de Referencia 188

35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 175 usando 1,4-dimetil-3-(3-cloro-4-isopropoxi-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 187) en lugar de 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol dio 2-cloro-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol 3-il)-fenol.

2-cloro-4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol 3-il)-fenol



40

RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 7,50 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,00 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,89 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,06 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 189

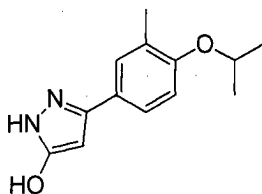
45

A una mezcla de 8,6 g del éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico (descrito en el

Ejemplo de Preparación de Referencia 170) y 80 ml de etanol, se le añadieron 3,5 g de hidrato de hidrazina uno, y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante dos horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y después, los precipitados resultantes se filtraron y se lavaron con etanol y hexano, y se secaron a presión reducida para dar 4 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-1H-pirazol.

5

5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol



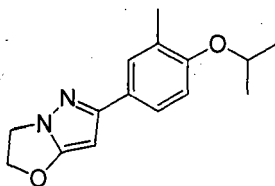
10 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,44-7,41 (2H, m), 6,96 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,75 (1H, s), 4,64-4,58 (1H, m), 2,14 (3H, s), 1,28 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 190

15 Una mezcla de 2,7 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 189), 4,3 g de 1,2-dibromoetano, 3,5 g de carbonato de potasio y 80 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante doce horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró y el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,2 g de 6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol.

20

6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol



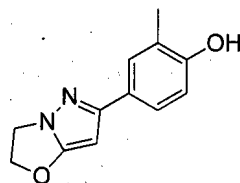
25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,55-7,54 (1H, m), 7,48 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,4 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,62 (1H, s), 5,04 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 4,57-4,51 (1H, m), 4,32 (2H, t, *J* = 8,0 Hz), 2,23 (3H, s), 1,35 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 191

30 Una mezcla de 3,3 g de 6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 190) y 25 ml de una solución acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante once horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C y los precipitados resultantes se filtraron. El sólido resultante se lavó con agua fría y hexano y se secó a presión reducida para dar 0,5 g de 4-(2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol-6-il)-2-metil-fenol.

35

4-(2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol-6-il)-2-metil-fenol



40 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,44-7,43 (1H, m), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 6,76 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,76 (1H, s), 5,08-5,03 (2H, m), 4,25 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 2,13 (3H, s).

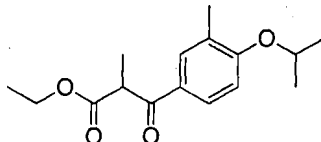
Ejemplo de Preparación de Referencia 192

45 Una mezcla de 8 g de éster etílico del ácido 3-(isopropoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 170), 5,1 g de yoduro de metilo, 5 g de carbonato de potasio y 150 ml de acetona, se agitó con calentamiento a reflujo durante tres horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se

filtró. El filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 6,4 g de éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-2-metil-3-oxo-propiónico.

éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-oxo-propiónico

5



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,83-7,76 (2H, m), 6,84 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,68-4,61 (1H, m), 4,34 (1H, c, *J* = 7,1 Hz), 4,17-4,12 (2H, m), 2,22 (3H, s), 1,47 (3H, d, *J* = 7,2 Hz), 1,37 (6H, d, *J* = 6,0 Hz), 1,19 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

10

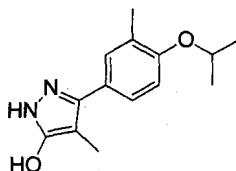
Ejemplo de Preparación de Referencia 193

A una mezcla de 6,4 g del éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 192) y 80 ml de etanol, se le añadieron 2,5 g de hidrato de hidrazina uno, y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y después, los precipitados resultantes se filtraron y se lavaron con etanol y hexano, y se secaron a presión reducida para dar 2,8 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-4-metil-1*H*-pirazol.

15

5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-4-metil-1*H*-pirazol

20



RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,30-7,27 (2H, m), 7,01 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,65-4,59 (1H, m), 2,16 (3H, s), 1,95 (3H, s), 1,29 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

25

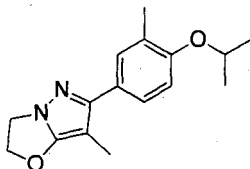
Ejemplo de Preparación de Referencia 194

Una mezcla de 2,1 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-4-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 193), 3,2 g de 1,2-dibromoetano, 2,6 g de carbonato de potasio y 80 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante trece horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró y el filtrado se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,2 g de 6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-*b*]oxazol.

30

6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-*b*]oxazol

35



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,39 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,01 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 4,58-4,52 (1H, m), 4,30 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 2,24 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,35 (6H, d, *J* = 5,9 Hz).

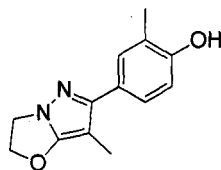
40

Ejemplo de Preparación de Referencia 195

Una mezcla de 2,0 g de 6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-*b*]oxazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 194) y 14 ml de una solución acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante catorce horas. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C y se añadieron a la misma 10 ml de agua enfriada con hielo y los precipitados resultantes se filtraron. El sólido resultante se lavó con agua fría y hexano y se secó a presión reducida para dar 0,5 g de 4-(7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-*b*]oxazol-6-il)-2-metil-fenol.

45

4-(7-metil-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol-6-il)-2-metil-fenol

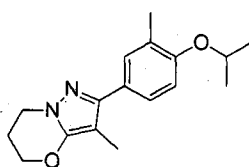


5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,31-7,31 (1H, m), 7,23-7,21 (1H, m), 6,81 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,04 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 4,25 (2H, t, *J* = 7,8 Hz), 2,14 (3H, s), 1,97 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 196

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 194 usando 1,3-dibromopropano en lugar de 1,2-dibromoetano dio 2-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-metil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b]oxazina.

2-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-metil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b]oxazina

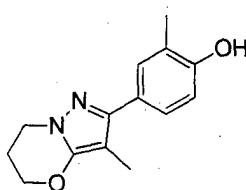


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,39 (1H, dd, *J* = 8,3, 2,3 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,57-4,51 (1H, m), 4,30 (2H, t, *J* = 5,1 Hz), 4,19 (2H, t, *J* = 6,3 Hz), 2,29-2,23 (5H, m), 2,03 (3H, s), 1,35 (6H, d, *J* = 5,9 Hz).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 197

25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 191 usando 2-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-3-metil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b]oxazina (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 196) en lugar de 6-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-2,3-dihidro-pirazolo[5,1-b]oxazol dio 2-metil-4-(3-metil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazin-2-il)-fenol.

2-metil-4-(3-metil-6,7-dihidro-5H-pirazolo[5,1-b][1,3]oxazin-2-il)-fenol



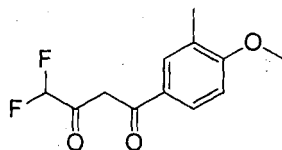
30 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,39 (1H, s a), 7,32-7,31 (1H, m), 7,23-7,21 (1H, m), 6,79 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 4,29 (2H, t, *J* = 5,1 Hz), 4,06 (2H, t, *J* = 6,2 Hz), 2,21-2,16 (2H, m), 2,14 (3H, s), 1,93 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 198

35 A temperatura ambiente, a una mezcla de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102) y 100 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 11,5 g de difluoroacetato de etilo, 31,4 g de una solución de etóxido de sodio al 20 %-etanol y 0,03 g de dibenzo-18-corona-6, y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante doce horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a la mezcla de reacción se le añadió agua, y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 9,5 g de 4,4-difluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona.

45

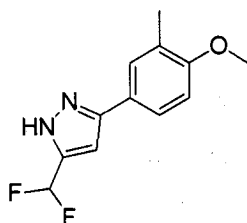
4,4-difluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona



- 5 RMN ¹H (CDCl₃: 23 °C) δ: 7,83 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,4 Hz), 7,76 (1H, dd, *J* = 2,3, 0,7 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,50 (1H, s), 6,01 (1H, t, *J* = 53,8 Hz), 3,92 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 199

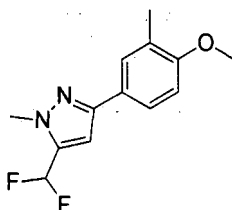
- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 5,2 g de 4,4-difluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 198) y 50 ml de etanol, se le añadieron 3,2 g de hidrato de hidrazina uno y la mezcla resultante se agitó durante quince horas. La mezcla de reacción se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 4,9 g de 3-difluorometil-5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2*H*-pirazol.
- 15 3-difluorometil-5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2*H*-pirazol



- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,39-7,34 (2H, m), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 6,72 (1H, t, *J* = 55,0 Hz), 6,66 (1H, s), 3,88 (3H, s), 2,27 (3H, s), 1,66 (1H, s a).

Ejemplo de Preparación de Referencia 200

- 25 A 0 °C, a una mezcla de 4,9 g de 3-difluorometil-5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 199) y 80 ml de *N,N*-dimetilformamida, se le añadió 1 g de hidruro de sodio al 55 %. La mezcla resultante se agitó durante una hora y se añadieron a la misma 4,3 g de yoduro de metilo. La mezcla de reacción se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante doce horas. A la mezcla de reacción se le añadieron 5 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El sólido resultante se filtró y se lavó
- 30 con hexano, y se secó a presión reducida para dar 0,9 g de 5-difluorometil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.

5-difluorometil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol

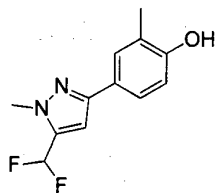
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,57-7,57 (1H, m), 7,54 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 6,85 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,74 (1H, t, *J* = 54,2 Hz), 6,68-6,67 (1H, m), 4,00 (3H, s), 3,86 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 201

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 5-difluorometil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 200) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 4-(5-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

45

4-(5-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol



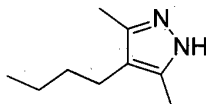
- 5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,52-7,52 (1H, m), 7,44-7,41 (1H, m), 7,30 (1H, t, *J* = 53,8 Hz), 6,88 (1H, s), 6,79 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 3,90 (3H, s), 2,15 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 202

- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 7 g de 3-butil-pentano-2,4-diona y 70 ml de etanol, se le añadieron 3,3 g de hidrato de hidrazina uno y la mezcla resultante se agitó durante doce horas. La mezcla de reacción se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 7 g de 4-butil-3,5-dimetil-1*H*-pirazol.

4-butil-3,5-dimetil-1*H*-pirazol

15



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,33 (2H, t, *J* = 7,5 Hz), 2,20 (3H, s), 2,20 (3H, s), 1,46-1,37 (2H, m), 1,36-1,27 (2H, m), 0,91 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

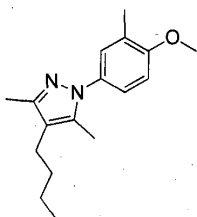
20

Ejemplo de Preparación de Referencia 203

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 65 usando 4-butil-3,5-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 202) en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 4-butil-1-(4-metoxi-3-metilfenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol.

25

4-butil-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol



30

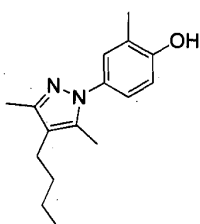
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,19 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,15 (1H, dd, *J* = 8,7, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 3,86 (3H, s), 2,38 (2H, t, *J* = 7,5 Hz), 2,25 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,50-1,43 (2H, m), 1,36 (2H, td, *J* = 14,6, 7,3 Hz), 0,94 (3H, t, *J* = 7,1 Hz).

35 Ejemplo de Preparación de Referencia 204

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 60 usando 4-butil-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 203) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 4-(4-butil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-metil-fenol.

40

4-(4-butil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-metil-fenol



RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,18 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,09 (1H, dd, J = 8,7, 2,7 Hz), 6,86 (1H, d, J = 8,5 Hz), 2,37 (2H, t, J = 7,2 Hz), 2,17 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,45-1,37 (2H, m), 1,36-1,27 (2H, m), 0,91 (3H, t, J = 7,2 Hz).

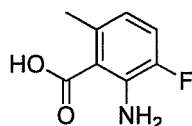
Ejemplo de Preparación de Referencia 205

5 A una mezcla de 136,2g de sulfato de sodio, 480 ml de agua y 8,6 g de hidrato de Chloral, se le añadió una mezcla de 6,1 g de 2-fluoro-5-metil-anilina, 4,2 ml de ácido clorhídrico concentrado y 24 ml de agua en agitación, seguido de la adición adicional de una mezcla de 10,6 g de sal clorhidrato de hidroxilamina y 30 ml de agua. La mezcla
10 resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante una hora y media, y después, el sólido precipitado se filtró para dar N-(2-fluoro-5-metilfenil)-2-hidroxiiminoacetamida.

15 A una mezcla de 19,5 ml de ácido sulfúrico concentrado y 4 ml de agua se le añadió N-(2-fluoro-5-dimetilfenil)-2-hidroxiiminoacetamida, y la mezcla resultante se agitó a 80 °C durante una hora. Después de un periodo de refrigeración, la solución de reacción se añadió a agua enfriada con hielo. Los sólidos precipitados se filtraron para dar 4-metil-7-fluoroisatina.

20 A una mezcla de 4-metil-7-fluoroisatina, 9,0 g de hidróxido de sodio y 40 ml de agua, se le añadieron 3 ml de una solución al 30 % de peróxido de hidrógeno. A la mezcla de reacción se añadió gota a gota ácido acético mientras que la temperatura de reacción se mantenía aproximadamente a 70 °C, así que el pH de la solución de reacción se ajustó a aproximadamente 4. El sólido precipitado se filtró para dar 2,3 g de ácido 2-amino-3-fluoro-6-metil benzoico.

ácido 2-amino-3-fluoro-6-metil benzoico



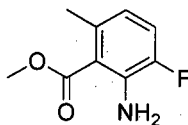
25 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ(ppm): 7,03 (1H, dd, J = 11,3, 8,2 Hz), 6,39 (1H, dd, J = 8,2, 5,1 Hz), 2,32 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 206

30 A una mezcla de 2,3 g de ácido 2-amino-3-fluoro-6-metil benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 205), 70 ml de acetato de etilo y 70 ml de etanol se le añadió una solución 2,0 M de trimetilsilil diazometano en 13,7 ml de éter dietílico en enfriamiento con hielo. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora y media y la solución de reacción se concentró después a presión reducida. Al residuo
35 resultante se le añadió agua y la mezcla se extrajo con metil *terc*-butil éter. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,81 g de éster metílico del ácido 2-amino-3-fluoro-6-metil-benzoico.

éster metílico del ácido 2-amino-3-fluoro-6-metil-benzoico

40

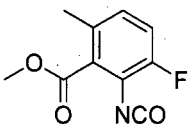


RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 6,94 (1H, dd, J = 10,9, 8,2 Hz), 6,45-6,41 (1H, m), 5,26 (2H, s a), 3,91 (3H, s), 2,41 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 207

A una mezcla de 0,81 g de éster metílico del ácido 2-amino-3-fluoro-6-metil-benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 206) y 15 ml de tolueno, se le añadieron 2,0 g de trifosgeno a temperatura ambiente, y la mezcla resultante se agitó con calentamiento en reflujo durante tres horas. La mezcla de reacción se concentró a
50 presión reducida para dar 0,92 g de éster metílico del ácido 2-isocianato-3-fluoro-6-metil benzoico.

éster metílico del ácido 2-isocianato-3-fluoro-6-metil benzoico

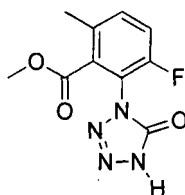


RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,09 (1H, t, J = 8,7 Hz), 7,02-6,98 (1H, m), 3,96 (3H, s), 2,30 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 208

5 Se añadieron 0,65 g de tricloruro de aluminio anhidro a 10 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla se agitó durante veinte minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 0,32 g y la mezcla resultante se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma 0,92 g de éster metílico del ácido 2-isocianato-3-fluoro-6-metil benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 207) y la mezcla resultante se calentó a 80 °C con agitación durante cuatro horas. Después de un periodo de refrigeración, la solución de reacción se añadió a una
10 mezcla de 1,0 g de nitrito de sodio 200 ml de agua enfriada con hielo con agitación. La mezcla de reacción se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 1,4 g de éster metílico del ácido 3-fluoro-6-metil-2-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)benzoico.

15 éster metílico del ácido 3-fluoro-6-metil-2-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico



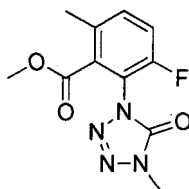
20 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ(ppm): 7,65-7,62 (1H, m), 7,59-7,56 (1H, m), 3,71 (3H, s), 2,38 (3H, s).

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 209

A una mezcla de 1,4 g de éster metílico del ácido 3-fluoro-6-metil-2-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 208) y 20 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 1,2 g de carbonato de potasio y 1,3 g de yoduro de metilo a temperatura ambiente y la mezcla resultante se agitó durante cuatro horas. A la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,65 g del éster metílico del ácido 3-fluoro-6-metil-2-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico.
30

éster metílico del ácido 3-fluoro-6-metil-2-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico

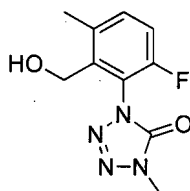


35 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,38 (1H, dd, J = 8,6, 5,0 Hz), 7,28 (1H, t, J = 8,6 Hz), 3,80 (3H, s), 3,71 (3H, s), 2,45 (3H, s). Ejemplo de Preparación de Referencia 210

En enfriamiento con hielo, a una mezcla de 0,65 g del éster metílico del ácido 3-fluoro-6-metil-2-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 209) y 11 ml de tetrahidrofurano, se le añadió una solución 1,0 M de trietilborohidruro de litio en 5,4 ml de tetrahidrofurano y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una hora. A la solución de reacción se le añadió agua, y la mezcla de reacción se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 0,58 g de 1-(2-hidroximetil-3-metil-6-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.
40

45

1-(2-hidroximetil-3-metil-6-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

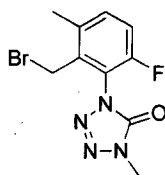


RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,37 (1H, dd, J = 8,6, 5,4 Hz), 7,15 (1H, t, J = 8,6 Hz), 4,54-4,36 (2H, m), 3,76 (3H, s), 3,28-3,24 (1H, m), 2,50 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 211

5 A una mezcla de 0,58 g de 1-(2-hidroximetil-3-metil-6-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 211) y 8 ml de cloroformo, se le añadieron 1,32 g de tribromuro de fósforo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante veinte horas. A la solución de reacción se le añadió agua enfriada con hielo y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y
10 solución salina saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,66 g de 1-(2-bromometil-3-metil-6-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

15 1-(2-bromometil-3-metil-6-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,36 (1H, dd, J = 8,7, 5,6 Hz), 7,16 (1H, t, J = 8,7 Hz), 4,43 (1H, d, J = 10,6 Hz), 4,32 (1H, d, J = 10,6 Hz), 3,76 (3H, s), 2,46 (3H, s).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 212

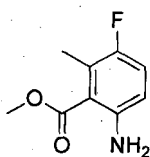
A una mezcla de 272,4 g de sulfato de sodio, 960 ml de agua y 17,2 g de hidrato de Chloral, se le añadió una de 12,2 g de 4-fluoro-3-metil-anilina, 8,4 ml de ácido clorhídrico concentrado y 48 ml de agua en agitación, seguido de la
25 adición adicional de una mezcla de 21,1 g de sal clorhidrato de hidroxilamina y 60 ml de agua. Después de la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante cuarenta minutos, el sólido precipitado se retiró por filtración para dar 25,4 g de N-(4-fluoro-3-metilfenil)-2-hidroxiiminoacetamida.

A una mezcla de 78 ml de ácido sulfúrico concentrado y 16 ml de agua, se le añadieron 25,4 g de N-(4-fluoro-3-metilfenil)-2-hidroxiiminoacetamida. La mezcla se agitó a 80 °C durante una hora y la solución de reacción se añadió
30 a 500 ml de agua enfriada con hielo. El sólido precipitado se retiró por filtración para dar una mezcla de 4-metil-5-fluoroisatina y 6-metil-5-fluoroisatina.

A una mezcla que contenía una mezcla de 4-metil-5-fluoroisatina y 6-metil-5-fluoroisatina, 18,0 g de hidróxido de sodio y 80 ml de agua, se le añadieron 6 ml de una solución al 30 % de peróxido de hidrógeno. A la mezcla de
35 reacción se añadió gota a gota ácido acético mientras que la temperatura de reacción se mantenía aproximadamente a 70 °C, así que el pH de la solución de reacción se ajustó a aproximadamente 4. El sólido precipitado se filtró para dar una mezcla de 11,5 g de ácido 6-amino-3-fluoro-2-metil benzoico y ácido 2-amino-5-fluoro-4-metil benzoico.

A una mezcla que contenía una mezcla de 11,5 g de ácido 6-amino-3-fluoro-2-metil benzoico y ácido 2-amino-5-fluoro-4-metil benzoico, 340 ml de acetato de etilo y 340 ml de etanol se le añadió una solución 2,0 M de trimetilsilil diazometano en 68 ml de éter dietílico en enfriamiento con hielo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante
45 una hora y media y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,0 g de éster metílico del ácido 6-amino-3-fluoro-2-metil-benzoico.

éster metílico del ácido 6-amino-3-fluoro-2-metil-benzoico

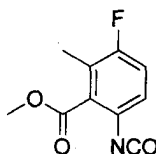


50 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 6,93 (1H, t, J = 9,0 Hz), 6,48 (1H, dd, J = 9,0, 4,5 Hz), 4,82 (2H, s a), 3,91 (3H, s), 2,31 (3H, d, J = 2,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 213

A una mezcla de 3,0 g de éster metílico del ácido 6-amino-3-fluoro-2-metil-benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 212) y 60 ml de tolueno, se le añadieron 7,6 g de trifosgeno a temperatura ambiente, y la mezcla resultante se agitó con calentamiento en reflujo durante tres horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar 3,6 g de éster metílico del ácido 6-isocianato-3-fluoro-2-metil benzoico.

éster metílico del ácido 6-isocianato-3-fluoro-2-metil benzoico

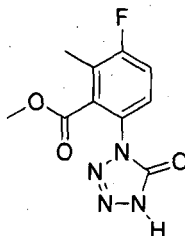


RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 7,04 (1H, t, J = 8,8 Hz), 6,94 (1H, dd, J = 8,8, 4,6 Hz), 3,98 (3H, s), 2,26 (3H, d, J = 2,5 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 214

Se añadieron 2,5 g de tricloruro de aluminio anhidro a 30 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla resultante se agitó durante veinte minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 1,2 g y la mezcla resultante se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma 3,6 g de éster metílico del ácido 6-isocianato-3-fluoro-2-metil benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 213) y la mezcla resultante se calentó a 80 °C con agitación durante cuatro horas. Después de un periodo de refrigeración, la solución de reacción se añadió a una mezcla de 4,0 g de nitrito de sodio 500 ml de agua enfriada con hielo con agitación. La mezcla de reacción se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 6,0 g de éster metílico del ácido 2-metil-3-fluoro-6-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)benzoico.

éster metílico del ácido 2-metil-3-fluoro-6-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico

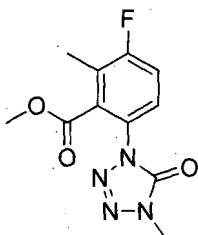


RMN ^1H ($\text{DMSO}-D_6$) δ (ppm): 7,62-7,56 (2H, m), 5,29 (1H, s a), 3,73 (3H, s), 2,29 (3H, d, J = 2,3 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 215

A una mezcla de 6,0 g de éster metílico del ácido 2-metil-3-fluoro-6-(5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 214) y 85 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 4,7 g de carbonato de potasio y 4,9 g de yoduro de metilo a temperatura ambiente y la mezcla resultante se agitó durante seis horas. A la solución de reacción se le añadió agua y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,8 g de éster metílico del ácido 2-metil-3-fluoro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico.

éster metílico del ácido 2-metil-3-fluoro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico

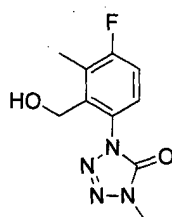


RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,47 (1H, dd, J = 8,9, 4,6 Hz), 7,25 (1H, t, J = 8,9 Hz), 3,84 (3H, s), 3,69 (3H, s), 2,36 (3H, d, J = 2,4 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 216

5 En enfriamiento con hielo, a una mezcla de 2,8 g de éster metílico del ácido 2-metil-3-fluoro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benzoico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 215) y 46 ml de tetrahidrofurano, se le añadió una solución 1,0 M de trietilborohidruro de litio en 22,9 ml de tetrahidrofurano y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante una hora. A la solución de reacción se le añadió agua, y la mezcla de reacción
10 se acidificó con ácido clorhídrico al 10 % y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida para dar 2,4 g de 1-(2-hidroximetil-3-metil-4-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

15 1-(2-hidroximetil-3-metil-4-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



20 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,21 (1H, dd, J = 8,7, 5,1 Hz), 7,15 (1H, t, J = 8,7 Hz), 4,47 (2H, dd, J = 7,2, 1,0 Hz), 3,75 (3H, s), 2,45 (3H, d, J = 2,4 Hz).

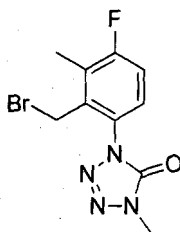
20

Ejemplo de Preparación de Referencia 217

A una mezcla de 2,4 g de 1-(2-hidroximetil-3-metil-4-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 215) y 34 ml de cloroformo, se le añadieron 5,5 g de tribromuro de fósforo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante veinte horas. A la solución de reacción se le añadió
25 agua enfriada con hielo y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,5 g de 1-(2-bromometil-3-metil-4-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

30

1-(2-bromometil-3-metil-4-fluorofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



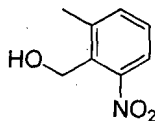
35 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,22 (1H, dd, J = 8,7, 5,1 Hz), 7,16 (1H, t, J = 8,7 Hz), 4,46 (2H, s), 3,75 (3H, s), 2,39 (3H, d, J = 2,4 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 218

40 A temperatura ambiente, a una mezcla de 15,6 g de tetrahidrobórato de sodio y se añadieron 200 ml de tetrahidrofurano

50 g de ácido 2-metil-6-nitrobenzoico. A 0 °C, a la mezcla de reacción se le añadieron 34 ml de sulfato de dimetilo, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante veinte horas. A 0 °C, se le añadieron a la misma, 300
45 ml de una solución acuosa al 5 % de ácido clorhídrico y la mezcla resultante se agitó durante una hora. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo, y la capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró a presión reducida para dar 30,5 g de alcohol 2-metil-6-nitrobenzílico.

2-metil-6-nitrobencilo alcohol

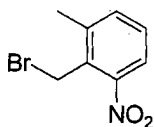


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,71 (1H, d, *J* = 7,7 Hz), 7,49 (1H, d, *J* = 7,5 Hz), 7,36 (1H, t, *J* = 7,9 Hz), 4,71 (2H, d, *J* = 7,2 Hz), 2,62 (1H, t, *J* = 7,4 Hz), 2,56 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 219

- 10 A temperatura ambiente, a una mezcla de 30,5 g de alcohol 2-metil-6-nitrobencílico y 100 ml de cloroformo, se le añadieron 74,1 g de tribromuro de fósforo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante diez horas. A la solución de reacción se le añadieron 200 ml de agua enfriada con hielo y la mezcla de reacción se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y después se concentró a presión reducida para dar 35 g de bromuro de 2-metil-6-nitrobencilo.

- 15 bromuro 2-metil-6-nitrobencilo

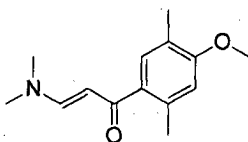


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,75 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 7,46 (1H, d, *J* = 7,7 Hz), 7,36 (1H, t, *J* = 7,8 Hz), 4,72 (2H, s), 2,54 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 220

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 99 usando 1-(4-metoxi-2,5-dimetil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 159) en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil)-etanona dio 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-propenona.

- 30 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-propenona



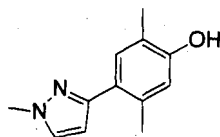
- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44 (1H, d, *J* = 12,3 Hz), 7,19 (1H, s), 6,63 (1H, s), 5,37 (1H, d, *J* = 12,8 Hz), 3,83 (3H, s), 3,04 (3H, s), 2,88 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 221

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 96 usando 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-2,5-dimetilfenil)-propenona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 220) en lugar de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil)-propenona dio 3-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol.

- A continuación, una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 91 usando el 3-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol preparado anteriormente en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol dio 3-(2,5-dimetil-4-metoxifenil)-1-metil-1*H*-pirazol. Una mezcla de 1,5 g del 3-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol obtenido, 18 ml de ácido bromhídrico y 18 ml de ácido acético se agitó a 100 °C durante cuarenta y ocho. El disolvente se retiró por destilación a presión reducida y el residuo resultante se lavó con 100 ml de agua, 100 ml de acetato de etilo y 100 ml de hexano, y se secó a presión reducida para dar 1,4 g de 2,5-dimetil-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

2,5-dimetil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol

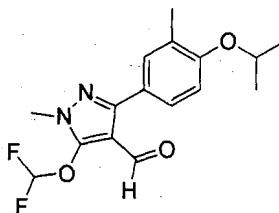


- 5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,70 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 7,22 (1H, s), 6,64 (1H, s), 6,36 (1H, d, *J* = 2,3 Hz), 3,86 (3H, s), 2,30 (3H, s), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 222

- 10 A 0 °C, a una mezcla de 3 g de 4-formil-5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 172), 30 ml de acetonitrilo, 30 ml de agua y 6,1 g de hidróxido de potasio, se le añadieron 6,1 g de bromo-difluorometil-dimetil fosfonato y la mezcla resultante se agitó durante quince horas. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía
- 15 en columna sobre gel de sílice para dar 1 g de 4-formil-5-difluorometoxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol.

4-formil-5-difluorometoxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol

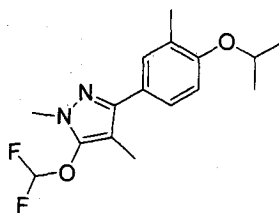


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,60 (1H, s), 7,20-7,17 (2H, m), 7,13 (1H, t, *J* = 72,8 Hz), 6,94 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 4,67-4,58 (1H, m), 3,69 (3H, s), 2,25 (3H, s), 1,40 (6H, d, *J* = 6,1 Hz).

25 Ejemplo de Preparación de Referencia 223

- A temperatura ambiente, una mezcla de 1 g de 4-formil-5-difluorometoxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 222) y 7 ml de ácido trifluoroacético, se le añadieron 0,9 g de trietilsilano. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante quince horas. El disolvente se retiró por destilación a presión reducida y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,9 g de 5-difluorometoxi-1,4-
- 30 dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-1H-pirazol.

35 5-difluorometoxi-1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol

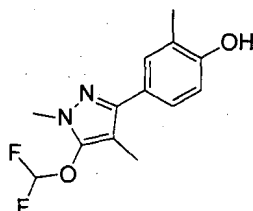


- 40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 6,56-6,54 (2H, m), 6,41-6,38 (1H, m), 6,39 (1H, t, *J* = 74,0 Hz), 4,13-4,04 (1H, m), 3,14 (3H, s), 1,74 (3H, s), 1,39 (3H, s), 0,88 (6H, d, *J* = 5,9 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 224

Una mezcla de 0,9 g de 5-difluorometoxi-1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 223) y 15 ml de una solución acuosa al 30 % de ácido sulfúrico se agitó a 100 °C durante treinta y una horas. La mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y solución salina saturada y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro para dar 0,5 g de 4-(5-difluorometoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

4-(5-difluorometoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

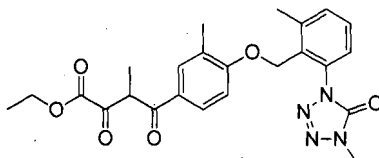


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,06 (1H, s), 7,03-6,98 (1H, m), 6,92-6,86 (1H, m), 6,89 (1H, t, J = 74,8 Hz), 3,64 (3H, s), 2,30 (3H, s), 1,89 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 225

A temperatura ambiente, a una mezcla de 6,1 g de 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 179) (Presente Compuesto 179), 4,8 g de oxalato de dietilo y 100 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 3,7 g de *tert*-butóxido de potasio. La mezcla resultante se agitó durante doce horas. Se añadieron a la misma 70 ml de agua y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,8 g de éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico.

éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico

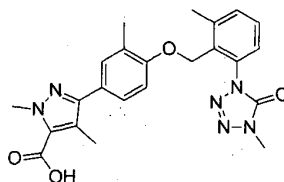


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,84 (1H, dd, J = 8,4, 2,3 Hz), 7,77 (1H, d, J = 1,6 Hz), 7,48-7,41 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J = 7,2, 1,8 Hz), 6,92 (1H, d, J = 8,6 Hz), 5,13 (2H, s), 5,01 (1H, c, J = 7,1 Hz), 4,27 (2H, c, J = 7,2 Hz), 3,65 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,44 (3H, d, J = 7,2 Hz), 1,30 (3H, t, J = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 226

A temperatura ambiente, a una mezcla de 2,1 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 253) (Presente Compuesto 253), 30 ml de tetrahydrofurano, 10 ml de metanol y 5 ml de agua, se le añadieron 0,3 g de hidróxido de litio. La mezcla resultante se agitó durante doce horas, y el disolvente se retiró por destilación. La mezcla de reacción se acidificó con 30 ml de una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y los precipitados se filtraron y se lavaron con agua y hexano, y se concentraron a presión reducida para dar 1,6 g de ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxil-fenil]-2H-pirazol-3-carboxílico.

ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxil-fenil]-2H-pirazol-3-carboxílico

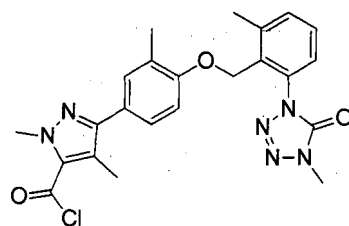


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,54-7,51 (2H, m), 7,39-7,36 (1H, m), 7,34-7,32 (2H, m), 7,03 (1H, d, $J = 9,2$ Hz), 5,05 (2H, s), 4,05 (3H, s), 3,55 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,31 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 227

5 A temperatura ambiente, a una mezcla de 2,1 g del ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carboxílico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 226) y 25 ml de tetrahidrofurano se le añadieron 0,89 g de dicloruro de oxalilo y 0,1 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla resultante se agitó durante tres horas y el disolvente se retiró por destilación para dar 2,1 g de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carbonilo cloruro.

cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carbonilo

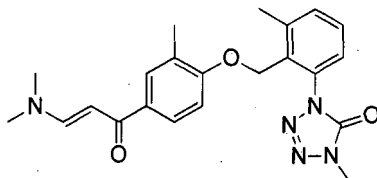


15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,46-7,41 (2H, m), 7,31-7,28 (3H, m), 6,92 (1H, d, $J = 9,1$ Hz), 5,08 (2H, s), 4,16 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,48 (3H, s), 2,14 (3H, s).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 228

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 104 usando 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 178) en lugar de 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona dio 1-[2-[4-(3-dimetilamino-acrilóil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-[2-[4-(3-dimetilamino-acrilóil)-2-metil-fenoximetil]-3-metoxi-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

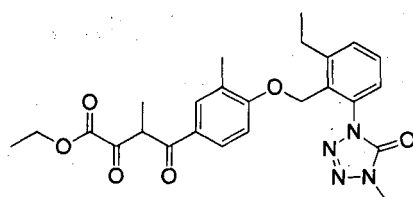


30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,78 (1H, d, $J = 12,4$ Hz), 7,76-7,72 (2H, m), 7,45-7,40 (2H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,85 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,70 (1H, d, $J = 12,4$ Hz), 5,09 (2H, s), 3,61 (3H, s), 3,12 (3H, s), 2,94 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,12 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación de Referencia 229

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 225 usando 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-2-etil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 268) en lugar de 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 179) dio éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico.

éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico



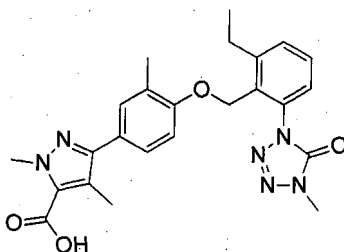
45 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,84 (1H, dd, $J = 8,5, 2,3$ Hz), 7,77-7,77 (1H, m), 7,53-7,46 (2H, m), 7,30 (1H, dd, $J = 7,3, 1,8$

Hz), 6,94 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,15 (2H, s), 5,01 (1H, c, $J = 7,1$ Hz), 4,27 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,61 (3H, s), 2,84 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,12 (3H, s), 1,44 (3H, d, $J = 7,1$ Hz), 1,31 (3H, t, $J = 7,6$ Hz), 1,29 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 230

5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 226 usando 1-{3-etil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 271) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 253) dio ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carboxílico.

ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carboxílico

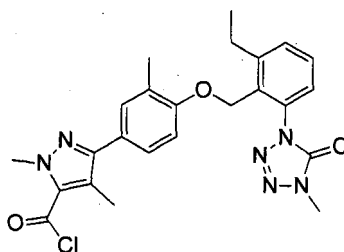


15 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,50-7,45 (2H, m), 7,36-7,33 (2H, m), 7,29 (1H, dd, $J = 7,1,2,3$ Hz), 6,92 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 5,09 (2H, s), 4,21 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,86 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,42 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,29 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 231

20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 227 usando ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carboxílico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 230) en lugar de ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carboxílico dio cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carbonilo.

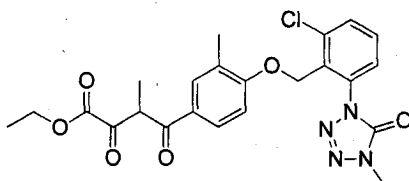
cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carbonilo



30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,53-7,42 (3H, m), 7,30-7,27 (2H, m), 6,94-6,92 (1H, m), 5,09 (2H, s), 4,15 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,89-2,83 (2H, m), 2,48 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,29 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

35 Ejemplo de Preparación de Referencia 232

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 225 usando 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-3-cloro-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 278) en lugar de 1-[2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 179) dio éster etílico del ácido 3-metil-4-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2,4-dioxo-butírico.

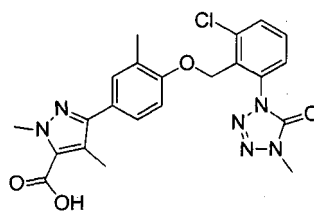


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,82 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,2 Hz), 7,76-7,75 (1H, m), 7,64 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 7,50 (1H, t, *J* = 7,9 Hz), 7,42 (1H, d, *J* = 7,8 Hz), 6,93 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,40 (2H, s), 5,00 (1H, c, *J* = 7,1 Hz), 4,27 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 3,62 (3H, s), 2,07 (3H, s), 1,44 (3H, d, *J* = 7,1 Hz), 1,30 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

5 Ejemplo de Preparación de Referencia 233

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 226 usando 1-{3-cloro-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 280) en lugar de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(5-etoxicarbonil-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 253) dio ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-2-carboxílico.

ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-2-carboxílico.



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,61 (1H, dd, *J* = 7,9, 1,1 Hz), 7,47 (1H, t, *J* = 7,9 Hz), 7,41 (1H, dd, *J* = 7,9, 1,1 Hz), 7,35-7,33 (2H, m), 6,91 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 5,35 (2H, s), 4,22 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,40 (3H, s), 2,08 (3H, s).

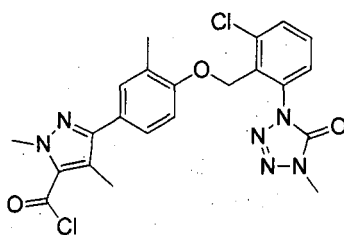
20

Ejemplo de Preparación de Referencia 234

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 227 usando ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-2-carboxílico. (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 233) en lugar de ácido 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carboxílico dio cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carbonilo.

cloruro de 2,4-dimetil-5-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2*H*-pirazol-3-carbonilo

30



RMN ¹H (DMSO-*D*₆) δ: 7,79 (1H, dd, *J* = 8,2, 1,1 Hz), 7,67-7,63 (1H, m), 7,56 (1H, dd, *J* = 7,9, 1,1 Hz), 7,31-7,28 (2H, m), 6,99 (1H, d, *J* = 9,1 Hz), 5,18 (2H, s), 4,02 (3H, s), 3,52 (3H, s), 2,27 (3H, s), 1,99 (3H, s).

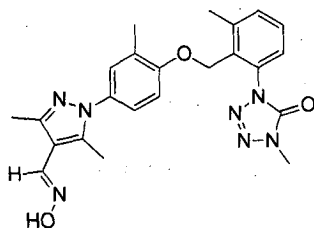
35

Ejemplo de Preparación de Referencia 235

A temperatura ambiente, 3,3 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 283), 0,8 g de sal clorhidrato de hidroxilamina, 1,5g de piridina y 70ml de cloroformo se agitó durante 15 horas. La mezcla resultante se concentró a presión reducida y se añadió una solución al 10 % de ácido clorhídrico. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua y hexano, y se concentraron a presión reducida para dar 3,5-dimetil-1-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidrotetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1*H*-pirazol-4-carbaldehído oxima

45

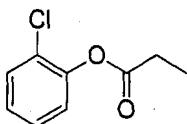
3,5-Dimetil-1-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxil-fenil]-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima



5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,14 (1H, s), 7,77 (1H, s), 7,46-7,40 (2H, m), 7,29 (1H, dd, *J* = 7,1,2,1 Hz), 7,16 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 7,12 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,6 Hz), 6,88 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 5,07 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,38 (3H, s), 2,34 (3H, s), 2,12 (3H, s).

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 236

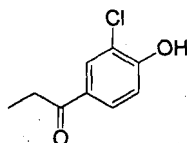
Se obtuvo 2-cloro-fenil éster del ácido propiónico haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 113. 2-cloro-fenil éster del ácido propiónico



15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,43 (1H, m), 7,28 (1H, td, *J* = 7,9, 1,8 Hz), 7,21-7,17 (1H, m), 7,14-7,12 (1H, m), 2,66 (2H, c, *J* = 7,7 Hz), 1,30 (3H, t, *J* = 7,7 Hz).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 237

Se obtuvo 1-(3-cloro-4-hidroxi-fenil)-propan-1-ona haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 114. 1-(3-Cloro-4-hidroxi-fenil)-propan-1-ona

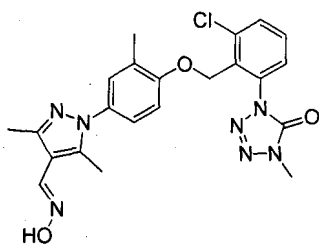


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,00 (1H, d, *J* = 2,0 Hz), 7,83 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,0 Hz), 7,08 (1H, d, *J* = 8,4 Hz), 6,19 (1H, s a), 2,94 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 1,22 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

30 Ejemplo de Preparación de Referencia 238

Se obtuvo 3,5-dimetil-1-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 235.

35 3,5-Dimetil-1-{3-metil-4-[2-cloro-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima

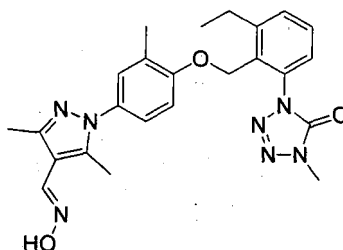


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,13 (1H, s), 7,96 (1H, s a), 7,62 (1H, dd, J = 8,0, 1,2 Hz), 7,48 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,41 (1H, dd, J = 8,0, 1,2 Hz), 7,14-7,13 (1H, m), 7,12-7,09 (1H, m), 6,89 (1H, d, J = 8,6 Hz), 5,33 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,37 (3H, s), 2,32 (3H, s), 2,05 (3H, s).

5 Ejemplo de Preparación de Referencia 239

Se obtuvo 3,5-dimetil-1-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 235.

10 3,5-Dimetil-1-{3-metil-4-[2-etil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima

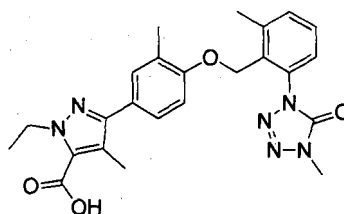


15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,15 (1H, s), 7,99 (1H, s), 7,51-7,45 (2H, m), 7,30 (1H, dd, J = 7,2, 1,8 Hz), 7,16-7,12 (2H, m), 6,90 (1H, d, J = 8,6 Hz), 5,09 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,85 (2H, c, J = 7,6 Hz), 2,39 (3H, s), 2,34 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,29 (3H, t, J = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 240

20 Se obtuvo ácido 2-etil-4-metil-5-{3-metil-2-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carboxílico haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 226.

25 ácido 2-etil-4-metil-5-{3-metil-2-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carboxílico

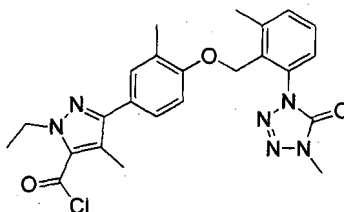


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43-7,38 (2H, m), 7,34 (1H, s), 7,30 (1H, s), 7,28-7,25 (2H, m), 6,87 (1H, d, J = 8,4 Hz), 5,05 (2H, s), 4,56 (2H, c, J = 7,1 Hz), 3,62 (3H, s), 2,49 (3H, s), 2,35 (3H, s), 2,11 (3H, s), 1,40 (3H, t, J = 7,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 241

35 Se obtuvo cloruro de 2-etil-4-metil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carbonilo haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 227.

cloruro de 2-etil-4-metil-5-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-fenil}-2H-pirazol-3-carbonilo



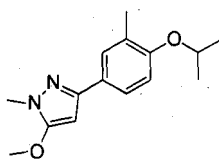
40 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,46-7,40 (2H, m), 7,30-7,27 (3H, m), 6,91 (1H, d, J = 8,0 Hz), 5,08 (2H, s), 4,52 (2H, c, J = 7,2

Hz), 3,64 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,47 (3H, s), 2,14 (3H, s), 1,44 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 242

- 5 A temperatura ambiente, a la mezcla de 9,5 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 171) y 70 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 2,5 g de hidruro de sodio al 55 % y se agitó durante una hora, y se añadieron a la misma 9,7 g de sulfato de dimetilo y se agitó a 100 °C durante 12 horas. Se añadieron a la misma 50 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5,8 g de 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol.

3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol



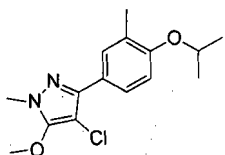
15

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,55 (1H, dd, $J = 2,3, 0,7$ Hz), 7,49-7,47 (1H, m), 6,84 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,75 (1H, s), 4,56-4,50 (1H, m), 3,92 (3H, s), 3,66 (3H, s), 2,23 (3H, s), 1,35 (3H, s), 1,33 (3H, s).

20 Ejemplo de Preparación de Referencia 243

- A temperatura ambiente, una mezcla de 5,8 g de 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 242), 3,3 g de N-clorosuccinimida y 70 ml de cloroformo se agitó durante 14 horas. Se añadieron a la misma 50 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5,6 g de 4-cloro-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol.

30 4-Cloro-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol



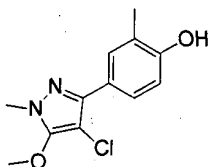
35

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,62-7,59 (2H, m), 6,87 (1H, d, $J = 9,1$ Hz), 4,59-4,53 (1H, m), 4,11 (3H, s), 3,70 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,36 (3H, s), 1,34 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 244

- Una mezcla de 5,6 g de 4-cloro-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 243) y una solución de 60 ml, acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante 24 horas. Se añadieron a la misma 10 ml de agua y la mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua, y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 1,2 g de 4-(4-cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

45 4-(4-Cloro-5-metoxi-1-metil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

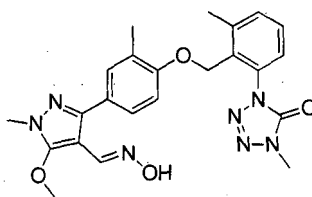


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,59 (1H, d, *J* = 2,0 Hz), 7,55 (1H, dd, *J* = 8,4, 2,0 Hz), 6,80 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,06 (1H, s), 4,11 (3H, s), 3,70 (3H, s), 2,28 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 245

5 A temperatura ambiente, 1,6 g de 1-{3-metil-2-[2-metil-4-(4-formil-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 266), 0,8 g de sal clorhidrato de hidroxilamina, 1,4 g de piridina y 20 ml de cloroformo se agitó durante 15 horas. La mezcla resultante se concentró a presión reducida y se añadió una solución al 10 % de ácido clorhídrico. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua y hexano, y se concentraron a presión reducida para dar 5-metoxi-1-metil-3-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxil]-fenil}-1*H*-pirazol-4-

15 carbaldehído oxima

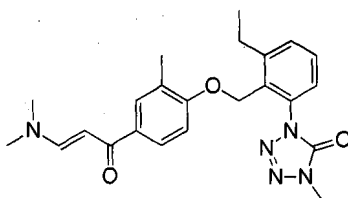


20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 8,09 (1H, s), 7,43-7,40 (2H, m), 7,32-7,27 (3H, m), 6,88 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,07 (2H, s), 4,04 (3H, s), 3,75 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,51 (3H, s), 2,12 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 246

25 Se obtuvo 1-{2-[4-(3-dimetilamino-acrililo)-2-metil-fenoximetil]-3-etil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona haciendo referencia al Ejemplo de Preparación de Referencia 104.

1-{2-[4-(3-dimetilamino-acrililo)-2-metil-fenoximetil]-3-etil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

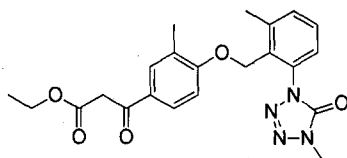


30 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,83-7,77 (2H, m), 7,75-7,74 (1H, m), 7,54-7,47 (2H, m), 7,32 (1H, dd, *J* = 7,2, 2,0 Hz), 6,90 (1H, d, *J* = 8,6 Hz), 5,73 (1H, d, *J* = 12,5 Hz), 5,14 (2H, s), 3,61 (3H, s), 3,17-2,97 (6H, m), 2,88 (2H, c, *J* = 7,2 Hz), 2,14 (3H, s), 1,31 (3H, t, *J* = 7,2 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 247

35 6,3 g de 1-[2-(4-acetil-2-metil-fenoximetil)-3-metil-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente Compuesto 178) y 100 ml de tetrahidrofurano, se añadieron 4,2 g de carbonato de dietilo, 1,6 g de hidruro de sodio al 55 %, 0,01 g de dibenzo 18-corona-6 0,8 g de etanol, y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante diez horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, y la mezcla resultante se acidificó con una solución acuosa al 10 % de ácido clorhídrico y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 3,7 g de éster etílico del ácido 3-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-

45 éster etílico del ácido 3-{3-metil-4-[2-metil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxil]-fenil}-3-oxo-propiónico

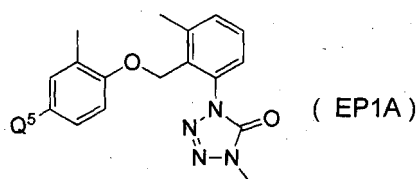


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,78 (1H, dd, $J = 8,5, 2,3$ Hz), 7,74-7,73 (1H, m), 7,47-7,40 (2H, m), 7,29 (1H, dd, $J = 7,3, 1,8$ Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,12 (2H, s), 4,21 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 3,93 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,27 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

5 De acuerdo con los procesos mencionados anteriormente, pueden prepararse los siguientes compuestos:

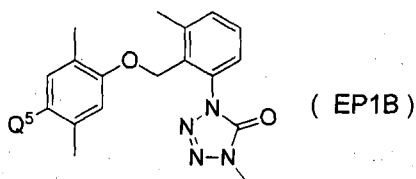
Los Compuestos EP1A-001~EP1A-1023, EP1B-001~EP1B-1023, EP1C-001~EP1C-1023, EP1D-001~EP1D-1023, EP1E-001~EP1E-1023, EP1F-001~EP1F-1023, EP1G-001~EP1G-1023, EP1H-001~EP1H-1023, EP1I-001~EP1I-1023, EP1J-001~EP1J-1023, EP2A-001~EP2A-1023, EP2B-001~EP2B-1023, EP2C-001~EP2C-1023, EP2D-001~EP2D-1023, EP2E-001~EP2E-1023, EP2F-001~EP2F-1023, EP2G-001~EP2G-1023, EP2H-001~EP2H-1023, EP2I-001~EP2I-1023, EP2J-001~EP2J-1023, EP3A-001~EP3A-1023, EP3B-001~EP3B-1023, EP3C-001~EP3C-1023, EP3D-001~EP3D-1023, EP3E-001~EP3E-1023, EP3F-001~EP3F-1023, EP3G-001~EP3G-1023, EP3H-001~EP3H-1023, EP3I-001~EP3I-1023, EP3J-001~EP3J-1023, EP4A-001~EP4A-1023, EP4B-001~EP4B-1023, EP4C-001~EP4C-1023, EP4D-001~EP4D-1023, EP4E-001~EP4E-1023, EP4F-001~EP4F-1023, EP4G-001~EP4G-1023, EP4H-001~EP4H-1023, EP4I-001~EP4M023, EP4J-001~EP4J-1023, EP5A-001~EP5A-1023, EP5B-001~EP5B-1023, EP5C-001~EP5C-1023, EP5D-001~EP5D-1023, EP5E-001~EP5E-1023, EP5F-001~EP5F-1023, EP5G-001~EP5G-1023, EP5H-001~EP5H-1023, EP5I-001~EP5M023, EP5J-001~EP5J-1023, EP6A-001~EP6A-1023, EP6B-001~EP6B-1023, EP6C-001~EP6C-1023, EP6D-001~EP6D-1023, EP6E-001~EP6E-1023, EP6F-001~EP6F-1023, EP6G-001~EP6G-1023, EP6H-001~EP6H-1023, EP6I-001~EP6I-1023, EP6J-001~EP6J-1023, EP7A-001~EP7A-1023, EP7B-001~EP7B-1023, EP7C-001~EP7C-1023, EP7D-001~EP7D-1023, EP7E-001~EP7E-1023, EP7F-001~EP7F-1023, EP7G-001~EP7G-1023, EP7H-001~EP7H-1023, EP7I-001~EP7I-1023, EP7J-001~EP7J-1023, EP8A-001~EP8A-1023, EP8B-001~EP8B-1023, EP8C-001~EP8C-1023, EP8D-001~EP8D-1023, EP8E-001~EP8E-1023, EP8F-001~EP8F-1023, EP8G-001~EP8G-1023, EP8H-001~EP8H-1023, EP8I-001~EP8M023, EP8J-001~EP8J-1023, EP9A-001~EP9A-1023, EP9B-001~EP9B-1023, EP9C-001~EP9C-1023, EP9D-001~EP9D-1023, EP9E-001~EP9E-1023, EP9F-001~EP9F-1023, EP9G-001~EP9G-1023, EP9H-001~EP9H-1023, EP9I-001~EP9I-1023 y EP9J-001~EP9J-1023.

Los Compuestos EP1A-001~EP1A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



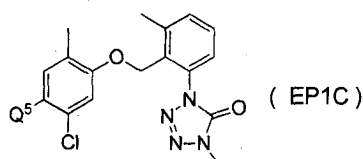
[en la fórmula (EP1A), Q^5 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP1B-001~EP1B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



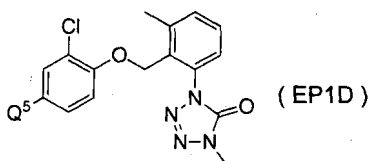
[en la fórmula (EP1B), Q^5 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP1C-001~EP1C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



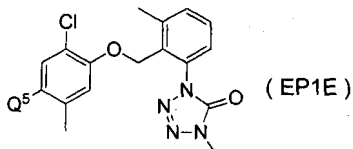
[en la fórmula (EP1C), Q^5 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP1D-001~EP1D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



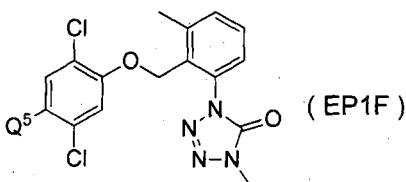
[en la fórmula (EP1D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP1E-001~EP1E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



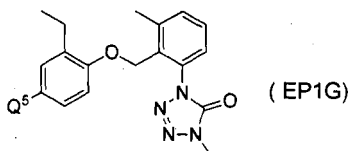
[en la fórmula (EP1E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP1F-001~EP1F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



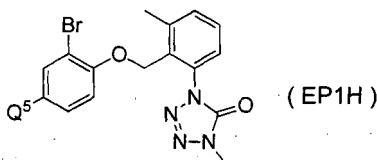
15 [en la fórmula (EP1F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP1G-001~EP1G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



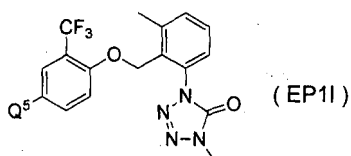
20 [en la fórmula (EP1G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP1H-001~EP1H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EP1H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

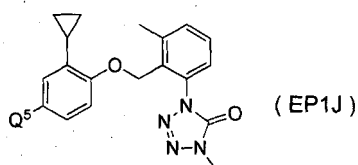
30 Los Compuestos EP1I-001~EP1I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP1I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023

indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

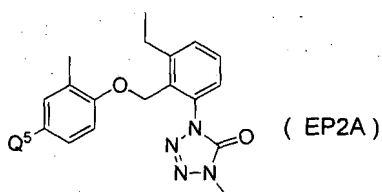
Los Compuestos EP1J-001~EP1J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



5

[en la fórmula (EP1J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2A-001~EP2A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

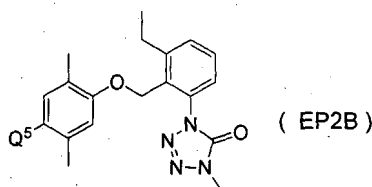


10

[en la fórmula (EP2A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2B-001~EP2B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

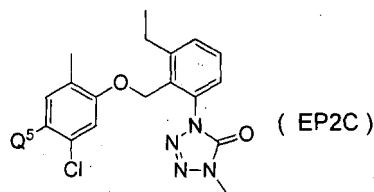
15



[en la fórmula (EP2B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2C-001~EP2C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

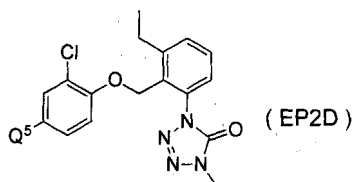
20



[en la fórmula (EP2C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

25

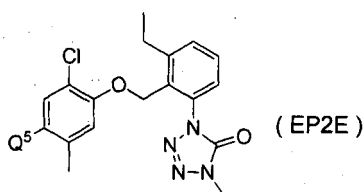
Los Compuestos EP2D-001~EP2D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



30

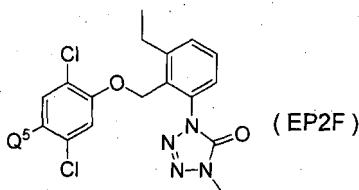
[en la fórmula (EP2D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2E-001~EP2E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



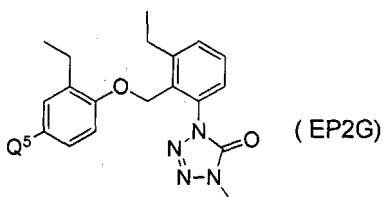
[en la fórmula (EP2E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP2F-001~EP2F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



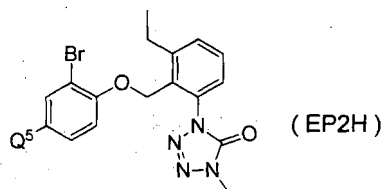
[en la fórmula (EP2F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP2G-001~EP2G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



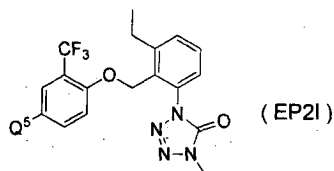
[en la fórmula (EP2G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP2H-001~EP2H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP2H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

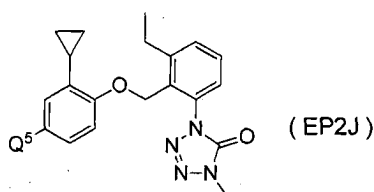
20 Los Compuestos EP2I-001~EP2I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP2I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

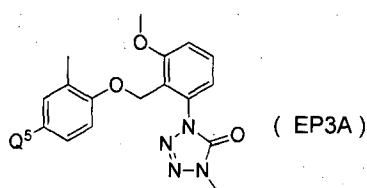
25 Los Compuestos EP2J-001~EP2J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



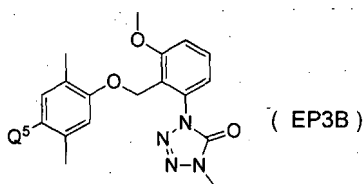
[en la fórmula (EP2J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP3A-001~EP3A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



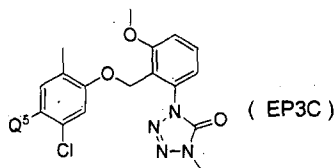
[en la fórmula (EP3A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP3B-001~EP3B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



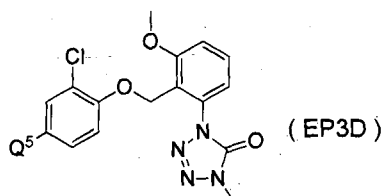
[en la fórmula (EP3B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP3C-001~EP3C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP3C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

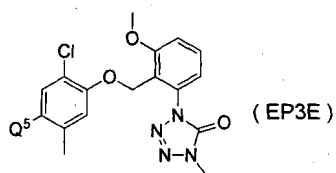
20 Los Compuestos EP3D-001~EP3D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP3D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

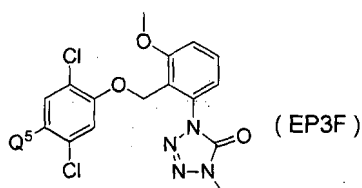
25

Los Compuestos EP3E-001~EP3E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

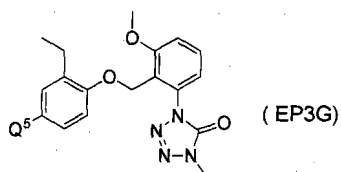


- 5 [en la fórmula (EP3E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3F-001~EP3F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

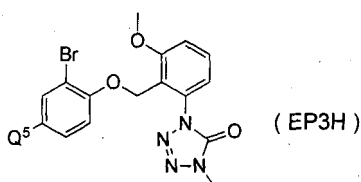


- 10 [en la fórmula (EP3F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];
- Los Compuestos EP3G-001~EP3G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



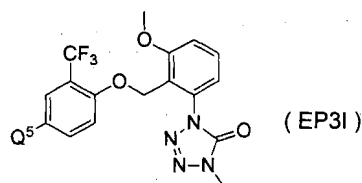
- 15 [en la fórmula (EP3G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3H-001~EP3H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



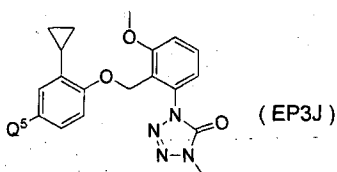
- 20 [en la fórmula (EP3H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

25 Los Compuestos EP3I-001~EP3I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



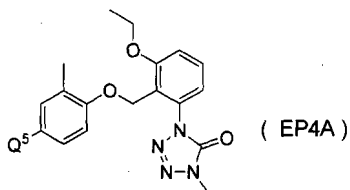
- 30 [en la fórmula (EP3I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3J-001~EP3J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



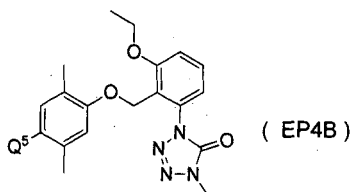
[en la fórmula (EP3J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP4A-001~EP4A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



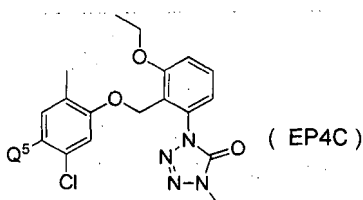
[en la fórmula (EP4A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP4B-001~EP4B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



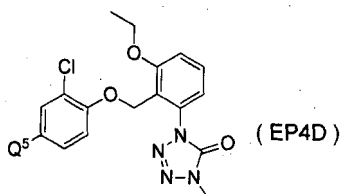
[en la fórmula (EP4B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP4C-001~EP4C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP4C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

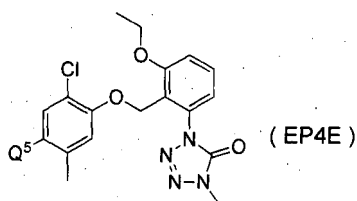
20 Los Compuestos EP4D-001~EP4D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP4D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

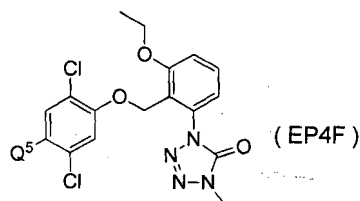
25 Los Compuestos EP4E-001~EP4E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



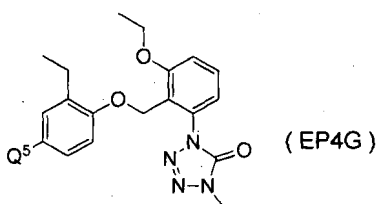
[en la fórmula (EP4E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP4F-001~EP4F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



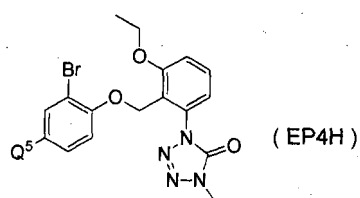
[en la fórmula (EP4F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP4G-001~EP4G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



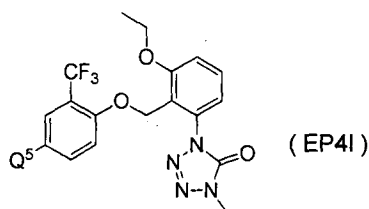
[en la fórmula (EP4G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP4H-001~EP4H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP4H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

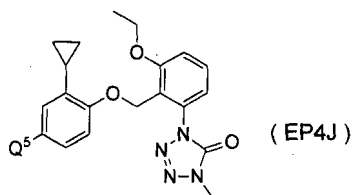
20 Los Compuestos EP4I-001~EP4I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP4I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

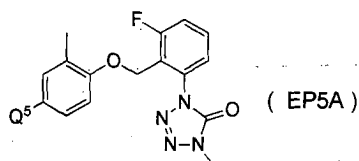
25 Los Compuestos EP4J-001~EP4J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



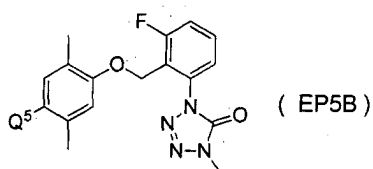
[en la fórmula (EP4J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP5A-001~EP5A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



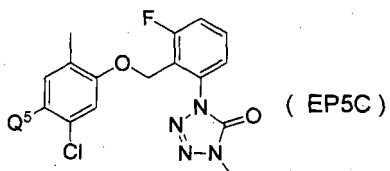
[en la fórmula (EP5A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP5B-001~EP5B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



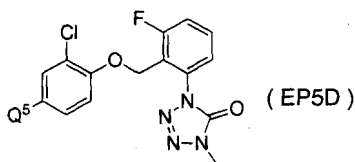
[en la fórmula (EP5B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP5C-001~EP5C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP5C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

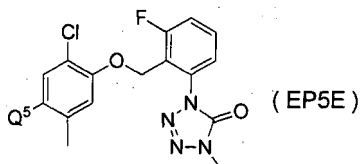
20 Los Compuestos EP5D-001~EP5D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP5D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

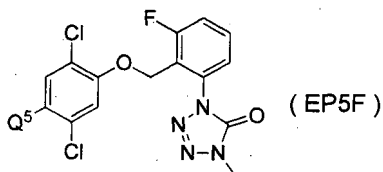
25 Los Compuestos EP5E-001~EP5E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



[en la fórmula (EP5E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5F-001~EP5F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

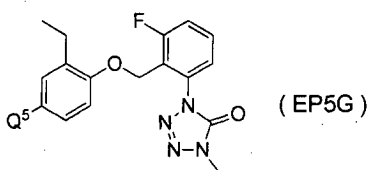


5

[en la fórmula (EP5F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5G-001~EP5G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

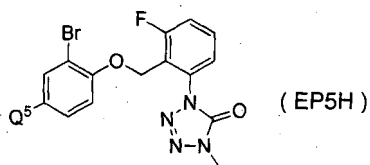
10



[en la fórmula (EP5G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5H-001~EP5H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

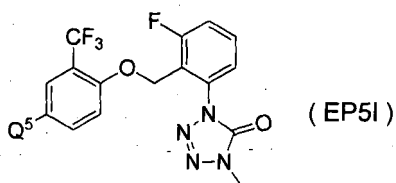
15



[en la fórmula (EP5H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20

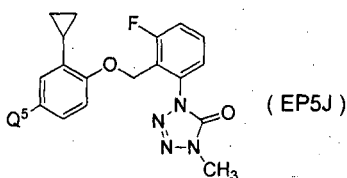
Los Compuestos EP5I-001~EP5I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP5I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

25

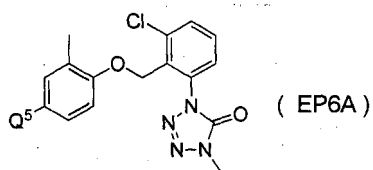
Los Compuestos EP5J-001~EP5J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



30

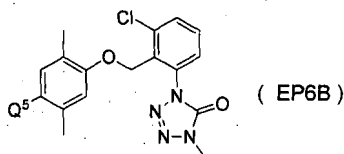
[en la fórmula (EP5J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP6A-001~EP6A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



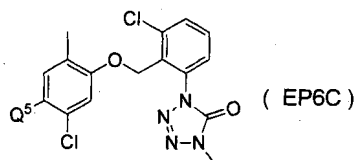
[en la fórmula (EP6A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP6B-001~EP6B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



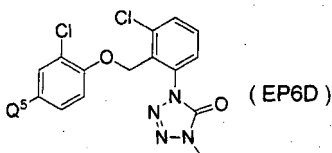
[en la fórmula (EP6B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP6C-001~EP6C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



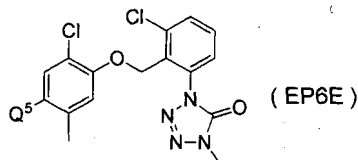
[en la fórmula (EP6C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP6D-001~EP6D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



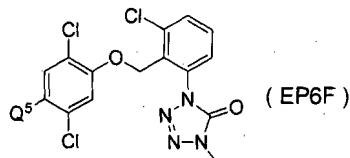
[en la fórmula (EP6D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EP6E-001~EP6E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



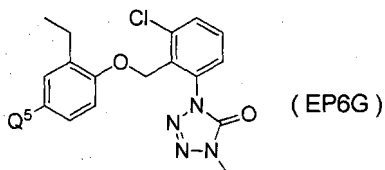
[en la fórmula (EP6E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

25 Los Compuestos EP6F-001~EP6F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP6F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP6G-001~EP6G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

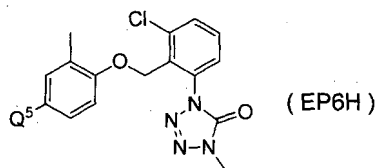


5

[en la fórmula (EP6G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

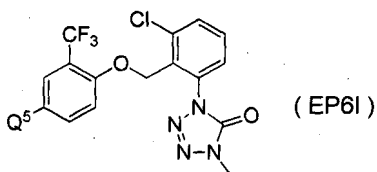
Los Compuestos EP6H-001~EP6H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

10



[en la fórmula (EP6H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

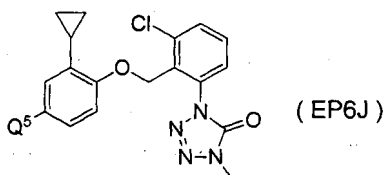
15 Los Compuestos EP6I-001~EP6I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



20

[en la fórmula (EP6I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

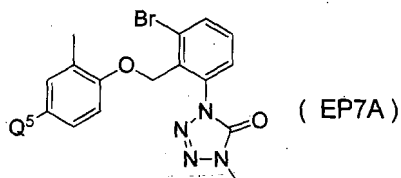
Los Compuestos EP6J-001~EP6J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25

[en la fórmula (EP6J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

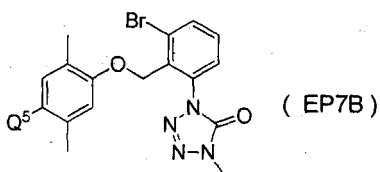
Los Compuestos EP7A-001~EP7A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



30

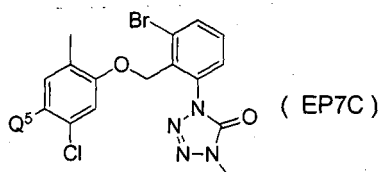
[en la fórmula (EP7A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP7B-001~EP7B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP7B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

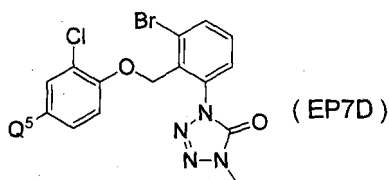
5 Los Compuestos EP7C-001~EP7C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP7C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10

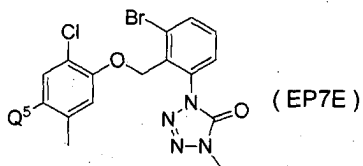
Los Compuestos EP7D-001~EP7D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP7D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15

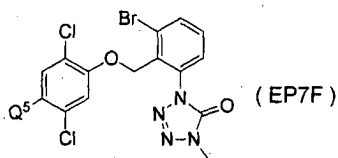
Los Compuestos EP7E-001~EP7E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP7E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20

Los Compuestos EP7F-001~EP7F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

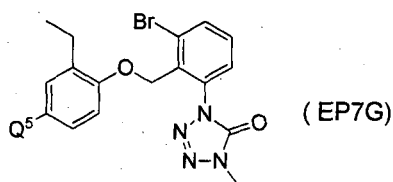


25

[en la fórmula (EP7F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

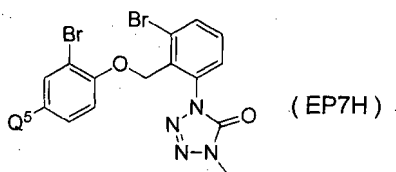
Los Compuestos EP7G-001~EP7G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



[en la fórmula (EP7G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP7H-001~EP7H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

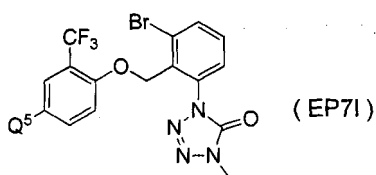


5

[en la fórmula (EP7H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP7I-001~EP7I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

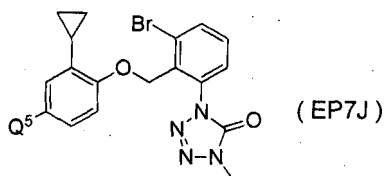
10



[en la fórmula (EP7I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP7J-001~EP7J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

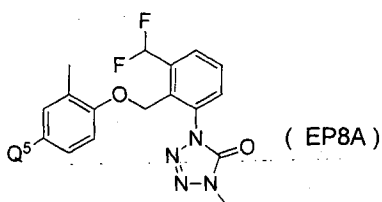
15



[en la fórmula (EP7J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20

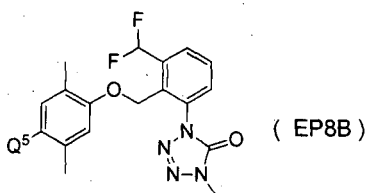
Los Compuestos EP8A-001~EP8A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP8A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP8B-001~EP8B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

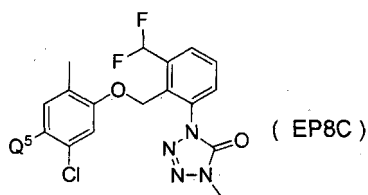
25



30

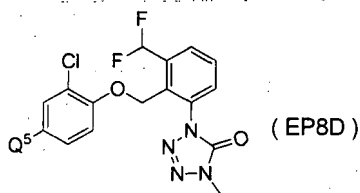
[en la fórmula (EP8B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP8C-001~EP8C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



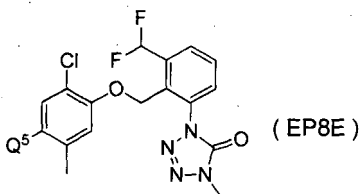
[en la fórmula (EP8C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP8D-001~EP8D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



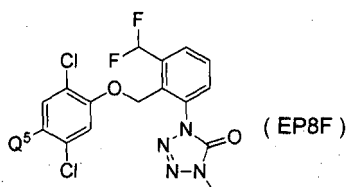
[en la fórmula (EP8D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP8E-001~EP8E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



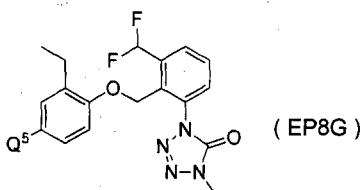
[en la fórmula (EP8E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EP8F-001~EP8F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP8F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

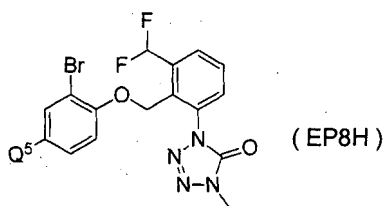
20 Los Compuestos EP8G-001~EP8G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP8G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

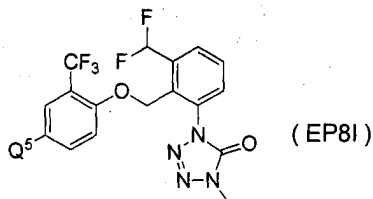
25 Los Compuestos EP8H-001~EP8H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



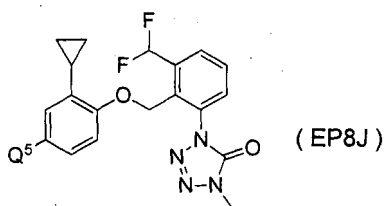
[en la fórmula (EP8H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP8I-001~EP8I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



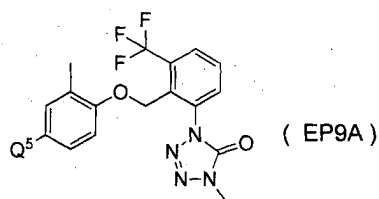
[en la fórmula (EP8I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP8J-001~EP8J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



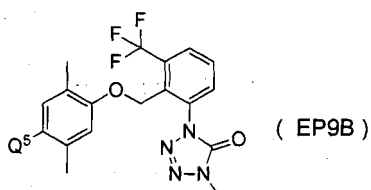
15 [en la fórmula (EP8J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP9A-001~EP9A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



20 [en la fórmula (EP9A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

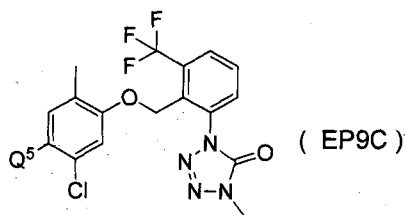
Los Compuestos EP9B-001~EP9B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EP9B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

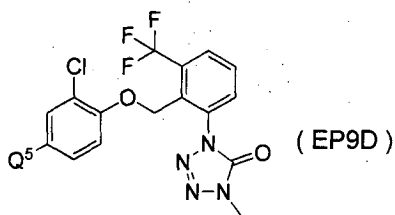
Los Compuestos EP9C-001~EP9C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



[en la fórmula (EP9C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

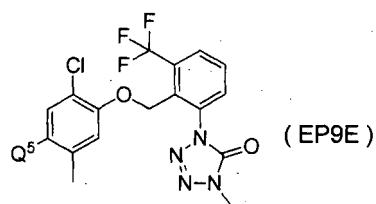
5 Los Compuestos EP9D-001~EP9D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP9D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10

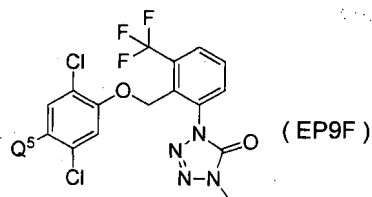
Los Compuestos EP9E-001~EP9E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP9E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

15

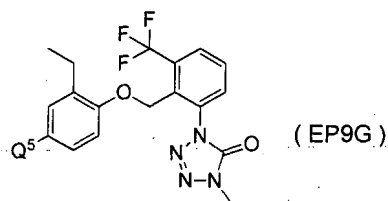
Los Compuestos EP9F-001~EP9F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



20

[en la fórmula (EP9F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP9G-001~EP9G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

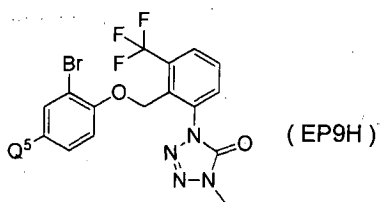


25

[en la fórmula (EP9G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

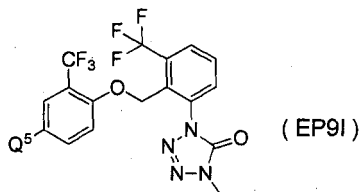
Los Compuestos EP9H-001~EP9H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



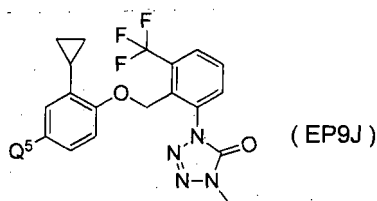
[en la fórmula (EP9H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EP9I-001~EP9I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP9I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación]; y

10 Los Compuestos EP9J-001~EP9J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



15 [en la fórmula (EP9J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación].

[Tabla 1]

sustituyentes n.º	Q ⁵
1	grupo pirazol-1-ilo
2	grupo 4-fluoro-pirazol-1-ilo
3	grupo 4-cloro-pirazol-1-ilo
4	grupo 4-bromo-pirazol-1-ilo
5	grupo 4-metil-pirazol-1-ilo
6	grupo 4-etil-pirazol-1-ilo
7	grupo 4-propil-pirazol-1-ilo
8	grupo 4-isopropil-pirazol-1-ilo
9	grupo 4-ciclopropil-pirazol-1-ilo
10	grupo 4-difluorometil-pirazol-1-ilo
11	grupo 4-ciano-pirazol-1-ilo
12	grupo 4-etinil-pirazol-1-ilo
13	grupo 4-propinil-pirazol-1-ilo
14	grupo 5-metil-pirazol-1-ilo
15	grupo 4-fluoro-5-metil-pirazol-1-ilo
16	grupo 4-cloro-5-metil-pirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

17	grupo 4-bromo-5-metil-pirazol-1-ilo
18	grupo 4,5-dimetilpirazol-1-ilo
19	grupo 4-etil-5-metil-pirazol-1-ilo
20	grupo 5-metil-4-propil-pirazol-1-ilo
21	grupo 4-isopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
22	grupo 4-ciclopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
23	grupo 4-difluorometil-5-metil-pirazol-1-ilo
24	grupo 4-ciano-5-metil-pirazol-1-ilo
25	grupo 4-etinil-5-metil-pirazol-1-ilo
26	grupo 5-metil-4-propinil-pirazol-1-ilo
27	grupo 5-etilpirazol-1-ilo
28	grupo 4-fluoro-5-etilpirazol-1-ilo
29	grupo 4-cloro-5-etilpirazol-1-ilo

[Tabla 2]

sustituyentes n.º	Q ⁵
30	grupo 4-bromo-5-etil-pirazol-1-ilo
31	grupo 5-etil-4-metil-pirazol-1-ilo
32	grupo 4,5-dietil-pirazol-1-ilo
33	grupo 4,5,6,7-tetrahidro-indazol-1-ilo
34	grupo 3-metil-4,5,6,7-tetrahidro-indazol-1-ilo
35	grupo 4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-ilo
36	grupo 3-metil-4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-ilo
37	grupo 1,4,5,6-tetrahidro-ciclopentapirazol-1-ilo
38	grupo 3-metil-4,5,6,7-tetrahidro-indazol-2-ilo
39	grupo 3-metil-pirazol-1-ilo
40	grupo 4-fluoro-3-metil-pirazol-1-ilo
41	grupo 4-cloro-3-metil-pirazol- 1-ilo
42	grupo 4-bromo-3-metil-pirazol-1-ilo
43	grupo 3,4-dimetil-pirazol-1-ilo
44	grupo 4-etil-3-metil-pirazol-1-ilo
45	grupo 4-propil-3-metil-pirazol-1-ilo
46	grupo 4-isopropil-3-metil-pirazol-1-ilo
47	grupo 4-ciclopropil-3-metil-pirazol-1-ilo
48	grupo 4-difluorometil-3-metil-pirazol-1-ilo
49	grupo 3-metil-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo
50	grupo 4-ciano-3-metil-pirazol-1-ilo
51	grupo 4-etinil-3-metilpirazol-1-ilo
52	grupo 3-metil-4-propinil-pirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

53	grupo 3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
54	grupo 4-fluoro-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
55	grupo 4-cloro-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
56	grupo 4-bromo-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
57	grupo 3,4,5-trimetil-pirazol-1-ilo
58	grupo 4-etil-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo

[Tabla 3]

sustituyentes n.º	Q ⁵
59	grupo 3,5-dimetil-4-propil-pirazol-1-ilo
60	grupo 3,5-dimetil-4-isopropil-pirazol-1-ilo
61	grupo 3,5-dimetil-4-ciclopropil-pirazol-1-ilo
62	grupo 4-difluorometil-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
63	grupo 4-ciano-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
64	grupo 4-etinil-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
65	grupo 3,5-dimetil-4-propinil-pirazol-1-ilo
66	grupo 5-etil-3-metil-pirazol-1-ilo
67	grupo 5-etil-4-fluoro-3-metil-pirazol-1-ilo
68	grupo 4-cloro-5-etil-3-metil-pirazol-1-ilo
69	grupo 4-bromo-5-etil-3-metil-pirazol-1-ilo
70	grupo 3,4-dimetil-5-etil-pirazol-1-ilo
71	grupo 4,5-dietil-3-metil-pirazol-1-ilo
72	grupo 5-etil-4-propil-3-metil-pirazol-1-ilo
73	grupo 5-etil-4-isopropil-3-metil-pirazol-1-ilo
74	grupo 5-etil-4-ciclopropil-3-metil-pirazol-1-ilo
75	grupo 5-etil-4-difluorometil-3-metil-pirazol-1-ilo
76	grupo 4-ciano-5-etil-3-metil-pirazol-1-ilo
77	grupo 5-etil-4-etinil-3-metil-pirazol-1-ilo
78	grupo 5-etil-3-metil-4-propinil-pirazol-1-ilo
79	grupo 3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-ilo
80	grupo 4-etoxi-3,5-dimetil-pirazol-1-ilo
81	grupo 3,5-dimetil-4-(2-propiniloxi)-pirazol-1-ilo
82	grupo 3,5-dimetil-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo
83	grupo 3-etil-pirazol-1-ilo
84	grupo 4-fluoro-3-etil-pirazol-1-ilo
85	grupo 4-cloro-3-etil-pirazol-1-ilo
86	grupo 4-bromo-3-etil-pirazol-1-ilo
87	grupo 3-etil-4-metil-pirazol-1-ilo

[Tabla 4]

sustituyentes n.º	Q ⁵
88	grupo 3,4-dietilpirazol-1-ilo
89	grupo 3-etil-4-propil-pirazol-1-ilo
90	grupo 3-etil-4-isopropil-pirazol-1-ilo
91	grupo 4-ciclopropil-3-etilpirazol-1-ilo
92	grupo 3-etil-4-difluorometil-pirazol-1-ilo
93	grupo 4-ciano-3-etilpirazol-1-ilo
94	grupo 3-etil-4-etinil-pirazol-1-ilo
95	grupo 3-etil-4-propinil-pirazol-1-ilo
96	grupo 3-etil-5-metil-pirazol-1-ilo
97	grupo 3-etil-4-fluoro-5-metil-pirazol- 1-ilo
98	grupo 4-cloro-3-etil-5-metil-pirazol-1-ilo
99	grupo 4-bromo-3-etil-5-metil-pirazol-1-ilo
100	grupo 3-etil-4,5-dimetil-pirazol-1-ilo
101	grupo 3,4-dietil-5-metil-pirazol-1-ilo
102	grupo 3-etil-5-metil-4-propil-pirazol-1-ilo
103	grupo 3-etil-4-isopropil-5-metil-pirazol-1-ilo

[Tabla 5]

sustituyentes n.º	Q ⁵
104	grupo 4-difluorometil-3-etil-5-metil-pirazol-1-ilo
105	grupo 3-etil-5-metil-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo
106	grupo 3-etil-4-etinil-5-metil-pirazol-1-ilo
107	grupo 3-etil-5-metil-4-propinil-pirazol-1-ilo
108	grupo 3-ciclopropil-pirazol-1-ilo
109	grupo 3-ciclopropil-4-fluoro-pirazol-1-ilo
110	grupo 4-cloro-3-ciclopropil-pirazol-1-ilo
111	grupo 4-bromo-3-ciclopropil-pirazol-1-ilo
112	grupo 3-ciclopropil-4-metil-pirazol-1-ilo
113	grupo 3-ciclopropil-4-etil-pirazol-1-ilo
114	grupo 3-ciclopropil-4-propil-pirazol-1-ilo
115	grupo 3,5-dimetil-4-(2-propinilo)-1-ilo
116	grupo 3,5-dimetil-4-(2-butinilo)-1-ilo

[Tabla 6]

sustituyentes n.º	Q ⁵
117	grupo 3-ciclopropil-4-isopropil-pirazol-1-ilo
118	grupo 3,5-diciclopropil-pirazol-1-ilo
119	grupo 3-ciclopropil-4-difluorometil-pirazol-1-ilo
120	grupo 3-ciclopropil-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

121	grupo 3-ciclopropil-4-etinil-pirazol-1-ilo
122	grupo 3-ciclopropil-4-propinil-pirazol-1-ilo
123	grupo 3-ciclopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
124	grupo 3-ciclopropil-4-fluoro-5-metil-pirazol-1-ilo
125	grupo 4-cloro-3-ciclopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
126	grupo 4-bromo-3-ciclopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
127	grupo 3-ciclopropil-4,5-dimetilpirazol-1-ilo
128	grupo 3-ciclopropil-4-etil-5-metil-pirazol-1-ilo
129	grupo 3-ciclopropil-4-propil-5-metil-pirazol-1-ilo
130	grupo 3-ciclopropil-4-isopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
131	3,5-diciclopropil-4-metil-pirazol-1-ilo

[Tabla 7]

sustituyentes n.º	Q ⁵
132	grupo 3-ciclopropil-4-difluorometil-5-metil-pirazol-1-ilo
133	grupo 3-ciclopropil-4-trifluorometil-5-metil-pirazol-1-ilo
134	grupo 3-ciclopropil-4-etinil-5-metil-pirazol-1-ilo
135	grupo 3-ciclopropil-4-propinil-5-metil-pirazol-1-ilo
136	grupo 3-difluorometil-pirazol-1-ilo
137	grupo 3-difluorometil-4-metil-pirazol-1-ilo
138	grupo 3-difluorometil-4-etil-pirazol-1-ilo
139	grupo 3-difluorometil-4-propil-pirazol-1-ilo
140	grupo 3-difluorometil-4-isopropil-pirazol-1-ilo
141	grupo 3-difluorometil-4-ciclopropil-pirazol-1-ilo
142	grupo 3-difluorometil-4-etinil-pirazol-1-ilo
143	grupo 3-difluorometil-4-propinil-pirazol-1-ilo
144	grupo 3-difluorometil-4-isopropil-pirazol-1-ilo
145	grupo 3-difluorometil-4-fluoro-pirazol-1-ilo

[Tabla 8]

sustituyentes n.º	Q ⁵
146	grupo 4-cloro-3-difluorometil-pirazol-1-ilo
147	grupo 4-bromo-3-difluorometil-pirazol-1-ilo
148	grupo 3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
149	grupo 4-fluoro-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
150	grupo 4-cloro-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
151	grupo 4-bromo-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
152	grupo 4-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
153	grupo 4-etil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
154	grupo 4-propil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo

155	grupo 4-isopropil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
156	grupo 4-ciclopropil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
157	grupo 4-difluorometil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
158	grupo 3,4-bistrifluorometil-pirazol-1-ilo
159	grupo 4-etinil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo

[Tabla 9]

sustituyentes n.º	Q ⁵
160	grupo 4-propinil-3-trifluorometil-pirazol-1-ilo
161	grupo 3,5-dimetil-4-trifluorometil-pirazol-1-ilo
162	grupo 3-propil-pirazol-1-ilo
163	grupo 3-propil-4-metil-pirazol-1-ilo
164	grupo 3-propil-4,5-dimetil-pirazol-1-ilo
165	grupo 3-isopropil-pirazol-1-ilo
166	grupo 3-isopropil-4-metil-pirazol-1-ilo
167	grupo 3-isopropil-4,5-dimetil-pirazol-1-ilo
168	grupo 3- <i>terc</i> -butil-pirazol-1-ilo
169	grupo 4-metil-3- <i>terc</i> -butil-pirazol-1-ilo
170	grupo 4,5-dimetil-3- <i>terc</i> -butil-pirazol-1-ilo
171	grupo 5-metil-3-propil-pirazol-1-ilo
172	grupo 3-isopropil-5-metil-pirazol-1-ilo
173	grupo 5-metil-3- <i>terc</i> -butil-pirazol-1-ilo
174	grupo 3-etil-4-metoxi-5-metil-pirazol-1-ilo

Tabla 10]

sustituyentes n.º	Q ⁵
175	grupo 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
176	grupo 1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
177	grupo 1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
178	grupo 1-difluoroetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
179	grupo 1-(2-propil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
180	grupo 1-(2-butinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
181	grupo 1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
182	grupo 1-trifluoroetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
183	grupo 1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
184	grupo 1-butil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
185	grupo 1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
186	grupo 1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
187	grupo 1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
188	grupo 1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

189	grupo 1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
-----	--

[Tabla 11]

sustituyentes n.º	Q ⁵
190	grupo 1-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
191	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
192	grupo 1-(2-propinil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
193	grupo 1-(2-butinil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
194	grupo 1-ciclopropilmetil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
195	grupo 1-(2,2,2-trifluoroetil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
196	grupo 4-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
197	grupo 1-butil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
198	grupo 1-isobutil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
199	grupo 1-(3-metilbutil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
200	grupo 1-(4-metil-pentil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
201	grupo 5-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
202	grupo 4-etil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
203	grupo 4-etil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 12]

sustituyentes n.º	Q ⁵
204	grupo 4-etil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
205	grupo 1-(2-butinil)-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
206	grupo 4-etil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
207	grupo 4-etil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
208	grupo 4-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
209	grupo 1-butil-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
210	grupo 4-etil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
211	grupo 4-etil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
212	grupo 4-etil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
213	grupo 4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
214	grupo 1-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
215	grupo 4-fluoro-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
216	grupo 4-fluoro-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
217	grupo 4-fluoro-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
218	grupo 1-(2-butinil)-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 13]

sustituyentes n.º	Q ⁵
219	grupo 1-ciclopropilmetil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

220	grupo 4-fluoro-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
221	grupo 4-fluoro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
222	grupo 1-butil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
223	grupo 4-fluoro-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
224	grupo 4-fluoro-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
225	grupo 4-fluoro-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
226	grupo 4-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
227	grupo 4-cloro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
228	grupo 4-cloro-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
229	grupo 4-cloro-1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
230	grupo 4-cloro-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
231	grupo 4-cloro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
232	grupo 1-butil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 14]

sustituyentes n.º	Q ⁵
233	grupo 4-cloro-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
234	grupo 4-cloro-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
235	grupo 4-cloro-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
236	1,4-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
237	grupo 4-bromo-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
238	grupo 4-bromo-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
239	grupo 4-bromo-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
240	grupo 4-bromo-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
241	grupo 4-bromo-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
242	grupo 4-bromo-1-(2-butinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
243	grupo 4-bromo-1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
244	grupo 4-bromo-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
245	grupo 4-bromo-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
246	grupo 4-bromo-1-butil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
247	grupo 4-bromo-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 15]

sustituyentes n.º	Q ⁵
248	grupo 4-bromo-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
249	grupo 4-bromo-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
250	grupo 1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
251	grupo 1-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
252	grupo 1-isopropil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
253	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

254	grupo 5-metil-1-(2-propinil)-1H-pirazol-3-ilo
255	grupo 1-(2-butinil)-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
256	grupo 1-ciclopropilmetil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
257	grupo 5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-3-ilo
258	grupo 5-metil-1-propil-1H-pirazol-3-ilo
259	grupo 1-butil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
260	grupo 1-isobutil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
261	grupo 1-(3-metilbutil)-5-metil-1H-pirazol-3-ilo

[Tabla 16]

sustituyentes n.º	Q ⁵
262	grupo 1-(4-metil-pentil)-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
263	grupo 1,4,5-trimetil-1H-pirazol-3-ilo
264	grupo 1-etil-4,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo
265	grupo 4,5-dimetil-1-isopropil-1H-pirazol-3-ilo
266	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-4,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo
267	grupo 4,5-dimetil-1-(2-propinil)-1H-pirazol-3-ilo
268	grupo 1-(2-butinil)-4,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo
269	grupo 1-ciclopropilmetil-4,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo
270	grupo 4,5-dimetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-3-ilo
271	grupo 4,5-dimetil-1-propil-1H-pirazol-3-ilo
272	grupo 1-butil-4,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo
273	grupo 4,5-dimetil-1-isobutil-1H-pirazol-3-ilo
274	grupo 4,5-dimetil-1-(3-metilbutil)-1H-pirazol-3-ilo
275	grupo 4,5-dimetil-1-(4-metil-pentil)-1H-pirazol-3-ilo
276	grupo 4-etil-1,5-dimetil-1H-pirazol-3-ilo

[Tabla 17]

sustituyentes n.º	Q ⁵
277	grupo 1,4-dietil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
278	grupo 1-isopropil-4-etil-5-metil-1 H-pirazol-3-ilo
279	grupo 4-etil-1H-(2,2-difluoroetil)-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
280	grupo 4-etil-5-metil-1-(2-propinil)-1H-pirazol-3-ilo
281	grupo 1-(2-butinil)-4-etil-5-metil-1 H-pirazol-3-ilo
282	grupo 1-ciclopropilmetil-4-etil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
283	grupo 4-etil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
284	grupo 4-etil-1-propil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
285	grupo 1-butil-4-etil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
286	grupo 4-etil-1-isobutil-5-metil-1H-pirazol-3-ilo
287	grupo 4-etil-1-(3-metilbutil)-5-metil-1H-pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

288	grupo 4-etil-1-(4-metil-pentil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
289	grupo 4-fluoro-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
290	grupo 1-etil-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 18]

sustituyentes n.º	Q ⁵
291	grupo 4-fluoro-1-isopropil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
292	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
293	grupo 4-fluoro-5-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
294	grupo 1-(2-butilil)-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
295	grupo 1-ciclopropilmetil-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
296	grupo 1-(2,2,2-trifluoroetil)-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
297	grupo 1-propil-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
298	grupo 1-butil-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
299	grupo 1-isobutil-4-fluoro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
300	grupo 4-fluoro-1-(3-metilbutil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
301	grupo 4-fluoro-1-(4-metil-pentil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
302	grupo 4-cloro-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
303	grupo 4-cloro-1-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
304	grupo 4-cloro-1-isopropil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
305	grupo 4-cloro-1-(2,2-difluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 19]

sustituyentes n.º	Q ⁵
306	grupo 4-cloro-5-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
307	grupo 1-(2-butilil)-4-cloro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
308	grupo 4-cloro-1-ciclopropilmetil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
309	grupo 4-cloro-1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
310	grupo 4-cloro-5-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
311	grupo 1-butil-4-cloro-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
312	grupo 4-cloro-1-isobutil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
313	grupo 4-cloro-1-(3-metilbutil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
314	grupo 4-cloro-1-(4-metil-pentil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
315	grupo 4-bromo-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
316	grupo 4-bromo-1-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
317	grupo 4-bromo-1-isopropil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
318	grupo 4-bromo-1-(2,2-difluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
319	grupo 4-bromo-5-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 20]

sustituyentes n.º	Q ⁵
320	grupo 4-bromo-1-(2-butinil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
321	grupo 4-bromo-1-ciclopropilmetil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
322	grupo 4-bromo-5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
323	grupo 4-bromo-5-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
324	grupo 4-bromo-1-butil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
325	grupo 4-bromo-1-isobutil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
326	grupo 4-bromo-1-(3-metilbutil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
327	grupo 4-bromo-1-(4-metil-pentil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
328	grupo 5-etil- 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
329	grupo 1,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
330	grupo 5-etil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
331	grupo 5-etil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
332	grupo 5-etil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
333	grupo 1-(2-butinil)-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
334	grupo 1-ciclopropilmetil-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
335	grupo 1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 21]

sustituyentes n.º	Q ⁵
336	grupo 5-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
337	grupo 1-butil-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
338	grupo 5-etil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
339	grupo 5-etil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
340	grupo 5-etil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
341	grupo 5-etil-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
342	grupo 1,5-dietil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
343	grupo 5-etil-1-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
344	grupo 5-etil-1-(2,2-difluoroetil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
345	grupo 5-etil-1-(2-propinil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
346	grupo 1-(2-butinil)-5-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
347	grupo 1-ciclopropilmetil-5-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
348	grupo 5-etil-4-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 22]

sustituyentes n.º	Q ⁵
349	grupo 5-etil-4-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
350	grupo 1-butil-5-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
351	grupo 5-etil-1-isobutil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
352	grupo 5-etil-1-(3-metilbutil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

353	grupo 5-etil-1-(4-metil-pentil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
354	grupo 4,5-dietil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
355	grupo 1,4,5-trietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
356	grupo 4,5-dietil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
357	grupo 4,5-dietil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
358	grupo 4,5-dietil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
359	grupo 1-(2-butil)-4,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
360	grupo 1-ciclopropilmetil-4,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
361	grupo 4,5-dietil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
362	grupo 4,5-dietil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
363	grupo 1-butil-4,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 23]

sustituyentes n.º	Q ⁵
364	grupo 4,5-dietil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
365	grupo 4,5-dietil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
366	grupo 4,5-dietil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
367	grupo 4,5-dietil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
368	grupo 5-etil-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
369	grupo 1,5-dietil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
370	grupo 5-etil-4-fluoro-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
371	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
372	grupo 5-etil-4-fluoro-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
373	grupo 1-(2-butil)-5-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
374	grupo 1-ciclopropilmetil-5-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
375	grupo 5-etil-4-fluoro-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
376	grupo 5-etil-4-fluoro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
377	grupo 1-butil-5-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 24]

sustituyentes n.º	Q ⁵
378	grupo 5-etil-4-fluoro-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
379	grupo 5-etil-4-fluoro-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
380	grupo 5-etil-4-fluoro-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
381	grupo 5-etil-4-fluoro(4-metil-penti)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
382	grupo 4-bromo-5-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
383	grupo 4-bromo-5-etil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
384	grupo 4-bromo-5-etil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
385	grupo 4-bromo-1-(2,2-difluoroetil)-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
386	grupo 4-bromo-5-etil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

387	grupo 4-bromo-1-(2-butinil)-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
388	grupo 4-bromo-1-ciclopropilmetil-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
389	grupo 4-bromo-1-5-etil-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
390	grupo 4-bromo-5-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
391	grupo 4-bromo-1-butil-5-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
392	grupo 4-bromo-5-etil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 25]

sustituyentes n.º	Q ⁵
393	grupo 4-bromo-5-etil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
394	grupo 4-bromo-5-etil-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
395	grupo 4-bromo-5-etil-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
396	grupo 5-ciclopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
397	grupo 5-ciclopropil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
398	grupo 5-ciclopropil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
399	grupo 5-ciclopropil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
400	grupo 5-ciclopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
401	grupo 1-(2-butinil)-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
402	grupo 1-ciclopropilmetil-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
403	grupo 5-ciclopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
404	grupo 5-ciclopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
405	grupo 1-butil-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
406	grupo 5-ciclopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 26]

sustituyentes n.º	Q ⁵
407	grupo 5-ciclopropil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
408	grupo 5-ciclopropil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
409	grupo 5-ciclopropil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
410	grupo 5-ciclopropil-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
411	grupo 5-ciclopropil-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
412	grupo 5-ciclopropil-1-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
413	grupo 5-ciclopropil-1-(2,2-difluoroetil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
414	grupo 5-ciclopropil-4-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
415	grupo 1-(2-butinil)-5-ciclopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
416	grupo 1-ciclopropilmetil-5-ciclopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
417	grupo 5-ciclopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
418	grupo 5-ciclopropil-4-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
419	grupo 1-butil-5-ciclopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
420	grupo 5-ciclopropil-4-metil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

421	grupo 5-ciclopropil-1-isobutil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
-----	--

[Tabla 27]

sustituyentes n.º	Q ⁵
422	grupo 5-ciclopropil-4-metil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
423	grupo 5-ciclopropil-4-metil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
424	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
425	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
426	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
427	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
428	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
429	grupo 1-(2-butinil)-5-ciclopropil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
430	grupo 5-ciclopropil-1-ciclopropilmetil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
431	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
432	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
433	grupo 1-butil-5-ciclopropil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
434	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
435	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 28]

sustituyentes n.º	Q ⁵
436	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
437	grupo 5-ciclopropil-4-fluoro-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
438	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
439	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
440	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
441	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
442	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
443	grupo 1-(2-butinil)-4-cloro-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
444	grupo 4-cloro-1-ciclopropilmetil-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
445	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
446	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
447	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-butil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
448	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
449	grupo 4-cloro-5-ciclopropil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 29]

sustituyentes n.º	Q ⁵
450	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
451	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
452	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

453	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
454	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
455	grupo 4-bromo-1-(2-butinil)-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
456	grupo 4-bromo-1-ciclopropil-metil-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
457	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
458	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
459	grupo 4-bromo-1-butil-5-ciclopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
460	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
461	grupo 4-bromo-5-ciclopropil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
462	grupo 5-isopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
463	grupo 1-etil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
464	grupo 1,5-diisopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 30]

sustituyentes n.º	Q ⁵
465	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
466	grupo 5-isopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
467	grupo 1-(2-butinil)-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
468	grupo 1-ciclopropilmetil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
469	grupo 5-isopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
470	grupo 5-isopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
471	grupo 1-butil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
472	grupo 5-isopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
473	grupo 1-isobutil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
474	grupo 5-isopropil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
475	grupo 5-isopropil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
476	grupo 1,4-dimetil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
477	grupo 1-etil-5-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
478	grupo 1,5-diisopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
479	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 31]

sustituyentes n.º	Q ⁵
480	grupo 5-isopropil-4-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
481	grupo 1-(2-butinil)-5-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
482	grupo 1-ciclopropilmetil-5-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
483	grupo 5-isopropil-4-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
484	grupo 5-isopropil-1-propil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
485	grupo 1-butil-5-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
486	grupo 5-isopropil-4-metil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

487	grupo 5-isopropil-4-metil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
488	grupo 5-isopropil-1-(3-metilbutil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
489	grupo 5-isopropil-4-metil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
490	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
491	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
492	grupo 4-fluoro-1,5-diisopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
493	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 32]

sustituyentes n.º	Q ⁵
494	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
495	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-(2-butinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
496	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
497	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
498	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
499	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-butil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
500	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
501	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
502	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
503	grupo 4-fluoro-5-isopropil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
504	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
505	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
506	grupo 4-cloro-1,5-diisopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
507	grupo 4-cloro-1-(2,2-difluoroetil)-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
508	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 33]

sustituyentes n.º	Q ⁵
509	grupo 1-(2-butinil)-4-cloro-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
510	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
511	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
512	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
513	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-butil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
514	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
515	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
516	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
517	grupo 4-cloro-5-isopropil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
518	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
519	grupo 4-bromo-1-etil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
520	grupo 4-bromo-1,5-diisopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

521	grupo 4-bromo-1-(2,2-difluoroetil)-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
522	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 34]

sustituyentes n.º	Q ⁵
523	grupo 4-bromo-1-(2-butilil)-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
524	grupo 4-bromo-1-ciclopropilmetil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
525	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
526	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
527	grupo 4-bromo-1-butil-5-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
528	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-pentil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
529	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
530	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
531	grupo 4-bromo-5-isopropil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
532	grupo 5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
533	grupo 1-etil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
534	grupo 5-metoxi-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
535	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
536	grupo 5-metoxi-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
537	grupo 1-(2-butilil)-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 35]

sustituyentes n.º	Q ⁵
538	grupo 1-ciclopropilmetil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
539	grupo 1,4-dimetil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
540	grupo 1-etil-5-metoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
541	grupo 5-metoxi-1-isopropil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
542	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-metoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
543	grupo 5-metoxi-1-(2-propinil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
544	grupo 1-(2,2-butilil)-5-metoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
545	grupo 1-ciclopropilmetil-5-metoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
546	grupo 4-fluoro-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
547	grupo 4-fluoro-5-metoxi-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
548	grupo 4-fluoro-5-metoxi-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
549	grupo 1-2,2-difluoroetil)-4-fluoro-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
550	grupo 4-fluoro-5-metoxi-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
551	grupo 1-(2-butilil)-4-fluoro-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 36]

sustituyentes n.º	Q ⁵
552	grupo 1-ciclopropilmetil-4-fluoro-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
553	grupo 4-cloro-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
554	grupo 4-cloro-5-metoxi-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
555	grupo 4,5-dicloro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
556	grupo 4-cloro-1-etil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
557	grupo 1-etil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
558	grupo 1-etil-4-metil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
559	grupo 5-cloro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
560	grupo 5-cloro-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
561	grupo 4,5-dicloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
562	grupo 4-cloro-1-metil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
563	grupo 1-metil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
564	grupo 1,4-dimetil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 37]

sustituyentes n.º	Q ⁵
565	grupo 5-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
566	grupo 5-cloro-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
567	grupo 5,6-dihidro-4 <i>H</i> -pirolo[1,2- <i>fe</i>]pirazol-2-ilo
568	grupo 4,5,6,7-tetrahidro-pirazolo[1,2- <i>a</i>]piridin-2-ilo
569	grupo 5,6-dihidro-3-metil-4 <i>H</i> -pirolo[1,2- <i>b</i>]pirazol-2-ilo
570	grupo 4,5,6,7-3-metil-tetrahidro-pirazolo[1,2- <i>a</i>]piridin-2-ilo
571	grupo 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
572	grupo 1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
573	grupo 1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
574	grupo 1-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
575	grupo 1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
576	grupo 1,3,5-trimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
577	grupo 1-etil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
578	grupo 3,5-dimetil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
579	grupo 1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
580	grupo 5-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo

[Tabla 38]

sustituyentes n.º	Q ⁵
581	grupo 3-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
582	grupo 3,5-dimetil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
583	grupo 1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
584	grupo 1-ciclopropilmetil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo

ES 2 630 323 T3

585	grupo 1-ciclopropilmetil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
586	grupo 1-ciclopropilmetil-3,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
587	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
588	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
589	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
590	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-3,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-ilo
591	grupo 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
592	grupo 1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
593	grupo 4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
594	grupo 4-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
595	grupo 4-bromo-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
596	grupo 1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
597	grupo 1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
598	grupo 1-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
599	grupo 4-cloro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
600	grupo 4-bromo-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
601	grupo 1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
602	grupo 4-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
603	grupo 4-fluoro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
604	grupo 4-cloro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
605	grupo 4-bromo-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
606	grupo 1-butil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
607	grupo 1-butil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
608	grupo 1-butil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
609	grupo 1-butil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

[Tabla 39]

sustituyentes n.º	Q ⁵
610	grupo 1-butil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
611	grupo 1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
612	grupo 1,3,4-trimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
613	grupo 1,3-dimetil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
614	grupo 4-cloro-1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
615	grupo 4-bromo-1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
616	grupo 1-etil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
617	grupo 3,4-dimetil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
618	grupo 1-etil-4-fluoro-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
619	grupo 4-cloro-1-etil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
620	grupo 4-bromo-1-etil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

ES 2 630 323 T3

621	grupo 3-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
622	grupo 3,4-dimetil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
623	grupo 3-metil-4-fluoro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
624	grupo 4-cloro-3-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

[Tabla 40]

sustituyentes n.º	Q ⁵
625	grupo 4-bromo-3-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
626	grupo 1-butil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
627	grupo 1-butil-3,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
628	grupo 1-butil-4-fluoro-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
629	grupo 1-butil-4-cloro-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
630	grupo 1-butil-4-bromo-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
631	grupo 3-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
632	grupo 1,4-dimetil-3-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
633	grupo 3-etil-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
634	grupo 4-cloro-3-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
635	grupo 4-bromo-3-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
636	grupo 1,3-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
637	grupo 1,3-dietil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
638	grupo 1,3-dietil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

[Tabla 41]

sustituyentes n.º	Q ⁵
639	grupo 4-cloro-1,3-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
640	grupo 4-bromo-1,3-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
641	grupo 4-fluoro-1,3-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
642	grupo 3-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
643	grupo 3-etil-4-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
644	grupo 4-fluoro-3-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
645	grupo 4-cloro-3-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
646	grupo 4-bromo-3-etil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
647	grupo 1-butil-3-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
648	grupo 1-butil-3-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
649	grupo 1-butil-3-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
650	grupo 1-butil-4-cloro-3-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
651	grupo 4-bromo-1-butil-3-etil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
652	grupo 1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
653	grupo 4-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
654	grupo 3-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

655	grupo 3,4-dimetil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
656	grupo 1-ciclopropilmetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
657	grupo 1-ciclopropilmetil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
658	grupo 1-ciclopropilmetil-3-metil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
659	grupo 1-ciclopropilmetil-3,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
660	grupo 1-(2-butilil)-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

[Tabla 42]

sustituyentes n.º	Q ⁵
661	grupo 1,5-dimetil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
662	grupo 4-ciano-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
663	grupo 5-etil-1-metil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
664	grupo 4-ciano-5-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
665	grupo 1,5-dietil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
666	grupo 4-ciano-1,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
667	grupo 1,4-dimetil-5-etoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
668	grupo 4-etil-1-metil-5-etoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
669	grupo 1-etil-4-metil-5-etoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
670	grupo 1,4-dimetil-5-metiltio-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
671	grupo 1,4-dimetil-5-etiltio-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
672	grupo 1,4-dietil-5-metiltio-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
673	grupo 5-ciano-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
674	grupo 5-ciano-1,4-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
675	grupo 5-ciano-4-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
676	grupo 5-ciano-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
677	grupo 5-difluorometoxi-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
678	grupo 1,4-dimetil-5-trifluorometoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
679	grupo 1,4-dimetil-5-(2-propiniloxi)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
680	grupo 1,4-dimetil-5-(2-butiloxi)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 43]

sustituyentes n.º	Q ⁵
681	grupo 5-fluoro- 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
682	grupo 5-bromo-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
683	grupo 5-etoxi- 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
684	grupo 5-ciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
685	grupo 5-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
686	grupo 4,5-difluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
687	grupo 5-cloro-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
688	grupo 5-bromo-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

689	grupo 5-etoxi-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
690	grupo 5-ciano-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
691	grupo 5-difluorometil-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
692	grupo 5-trifluorometil-4-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
693	grupo 4-cloro-5-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
694	grupo 5-bromo-4-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
695	grupo 4-cloro-5-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
696	grupo 4-cloro-5-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
697	grupo 4-cloro-5-ciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
698	grupo 4-cloro-5-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
699	grupo 4-bromo-5-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
700	grupo 4-bromo-5-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
701	grupo 4,5-dibromo-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
702	grupo 4-bromo-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
703	grupo 4-bromo-5-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
704	grupo 4-bromo-5-ciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
705	grupo 4-bromo-5-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
706	grupo 4-bromo-5-trifluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
707	grupo 5-fluoro-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
708	grupo 5-bromo-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
709	grupo 5-etoxi-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 44]

sustituyentes n.º	Q ⁵
710	grupo 5-ciclopropil,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
711	grupo 5-difluorometil-1,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
712	grupo 4-etil-5-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
713	grupo 4-etil-5-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
714	grupo 5-bromo-4-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
715	grupo 4-etil-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
716	grupo 5-ciclopropil-4-etil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
717	grupo 4-etil-5-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
718	grupo 4-etil-5-trifluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
719	grupo 4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
720	grupo 5-fluoro-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
721	grupo 5-cloro-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
722	grupo 5-bromo-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
723	grupo 4-metoxi-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
724	grupo 5-etil-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

725	grupo 4,5-dimetoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
726	grupo 5-etoxi-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
727	grupo 5-ciano-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
728	grupo 5-ciclopropil-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
729	grupo 5-difluorometil-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
730	grupo 5-trifluorometil-4-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
731	grupo 4-etoxi- 1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
732	grupo 5-fluoro-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
733	grupo 5-cloro-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
734	grupo 5-bromo-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
735	grupo 4-etoxi-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
736	grupo 5-etil-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
737	grupo 4-etoxi-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
738	grupo 4,5-dietoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 45]

sustituyentes n.º	Q ⁵
739	grupo 5-ciano-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
740	grupo 5-ciclopropil-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
741	grupo 5-difluorometil-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
742	grupo 5-trifluorometil-4-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
743	grupo 4-ciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
744	grupo 4-ciano-5-fluoro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
745	grupo 4-ciano-5-cloro-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
746	grupo 5-bromo-4-ciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
747	grupo 4-ciano-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
748	grupo 4-ciano-5-etoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
749	grupo 4,5-diciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
750	grupo 4-ciano-5-ciclopropil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
751	grupo 4-ciano-5-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
752	grupo 4-ciano-1-metil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
753	grupo 4-difluorometil-1 metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
754	grupo 5-fluoro-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
755	grupo 5-cloro-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
756	grupo 5-bromo-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
757	grupo 4-difluorometil-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
758	grupo 5-etil-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
759	grupo 4-difluorometil-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
760	grupo 5-etoxi-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

761	grupo 5-ciano-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
762	grupo 5-ciclopropil-4-difluorometil-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
763	grupo 4,5-bis(difluorometil)-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
764	grupo 4-difluorometil-1-metil-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
765	grupo 1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
766	grupo 5-fluoro-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
767	grupo 5-cloro-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 46]

sustituyentes n.º	Q ⁵
768	grupo 5-bromo-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
769	grupo 1,5-dimetil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
770	grupo 5-etil-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
771	grupo 5-metoxi-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
772	grupo 5-etoxi-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
773	grupo 5-ciano-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
774	grupo 5-ciclopropil-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
775	grupo 5-difluorometil-1-metil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
776	grupo 1-metil-4,5-bis(trifluorometil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
777	grupo 1-etil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
778	grupo 5-bromo-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
779	grupo 5-ciano-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
780	grupo 1-etil-5-difluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
781	grupo 1-etil-4,5-difluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
782	grupo 1-etil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
783	grupo 1-etil-5-bromo-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
784	grupo 1-etil-5-ciano-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
785	grupo 1-etil-5-difluorometil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
786	grupo 1-etil-5-trifluorometile-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
787	grupo 4-cloro-1-etil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
788	grupo 5-bromo-4-cloro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
789	grupo 4-cloro-1,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
790	grupo 1-etil-5-ciano-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
791	grupo 1-etil-4-cloro-5-difluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
792	grupo 4-bromo-1-etil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
793	grupo 4-bromo-1-etil-5-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
794	grupo 4-bromo-1-etil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
795	grupo 4-bromo-5-ciano-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
796	grupo 5-fluoro-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 47]

sustituyentes n.º	Q ⁵
797	grupo 5-bromo-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
798	grupo 5-ciclopropil-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
799	grupo 1-etil-5-difluorometil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
800	grupo 1,4-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
801	grupo 1,4-dietil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
802	grupo 1,4-dietil-5-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
803	grupo 1,4-dietil-5-metoxi-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
804	grupo 4-metoxi-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
805	grupo 5-fluoro-1-etil-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
806	grupo 5-cloro-1-etil-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
807	grupo 5-bromo-1-etil-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
808	grupo 1-etil-5-metoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
809	grupo 1,5-dietil-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
810	grupo 1-etil-4,5-dimetoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
811	grupo 1-etil-5-ciano-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
812	grupo 5-ciclopropil-1-etil-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
813	grupo 1-etil-5-difluorometil-4-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
814	grupo 1-etil-4-metoxi-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
815	grupo 4-ciano-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
816	grupo 4-ciano-5-fluoro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
817	grupo 4-ciano-5 cloro-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
818	grupo 5-bromo-4-ciano-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
819	grupo 4-ciano-1-etil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
820	grupo 4,5-diciano-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
821	grupo 4-ciano-5-ciclopropil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
822	grupo 4-ciano-5-difluorometil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
823	grupo 4-ciano-1-etilpirazol-5-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
824	grupo 4-difluorometil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
825	grupo 5-fluoro-4-difluorometil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 48]

sustituyentes n.º	Q ⁵
826	grupo 5-cloro-4-difluorometil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
827	grupo 4-difluorometil-1-etil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
828	grupo 4-difluorometil-1-etil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
829	grupo 5-ciano-4-difluorometil-1-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
830	grupo 1-etil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
831	grupo 5-fluoro-1-etil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

832	grupo 5-cloro-1-etil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
833	grupo 1-etil-4-trifluorometil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
834	grupo 1-etil-4-trifluorometil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
835	grupo 5-ciano-1-etil-4-trifluorometil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
836	grupo 4-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
837	grupo 4-etoxi-5-metilpirazol-1-ilo
838	grupo 4-ciclopropil-5-metilpirazol-1-ilo
839	grupo 4-trifluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
840	grupo 4-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
841	grupo 4-etil-3-metilpirazol-1-ilo
842	grupo 4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
843	grupo 4-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
844	grupo 4-ciclopropil-3-metilpirazol-1-ilo
845	grupo 5-fluoro-3-metil pirazol- 1-ilo
846	grupo 4,5-difluoro-3-metilpirazol-1-ilo
847	grupo 4-cloro-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
848	grupo 4-bromo-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
849	grupo 5-fluoro-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
850	grupo 4-etil-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
851	grupo 5-fluoro-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
852	grupo 4-etoxi-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
853	grupo 4-ciano-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
854	grupo 4-ciclopropil-5-fluoro-3-metil pirazol- 1-ilo

[Tabla 49]

sustituyentes n.º	Q ⁵
855	grupo 4-difluorometil-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
856	grupo 4-trifluorometil-5-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
857	grupo 5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
858	grupo 5-cloro-4-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
859	grupo 4,5-dicloro-3-metilpirazol-1-ilo
860	grupo 4-bromo-5-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
861	grupo 5-cloro-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
862	grupo 5-cloro-4-etil-3-metilpirazol-1-ilo
863	grupo 5-cloro-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
864	grupo 5-cloro-4-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
865	grupo 5-cloro-4-ciano-3-metilpirazol-1-ilo
866	grupo 5-cloro-4-ciclopropil-3-metilpirazol-1-ilo
867	grupo 5-cloro-4-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

868	grupo 5-cloro-4-trifluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
869	grupo 5-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
870	grupo 5-bromo-4-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
871	grupo 5-bromo-4-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
872	grupo 4,5-dibromo-3-metilpirazol-1-ilo
873	grupo 5-bromo-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
874	grupo 5-bromo-4-etil-3-metilpirazol-1-ilo
875	grupo 5-bromo-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
876	grupo 5-bromo-4-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
877	grupo 5-bromo-4-ciano-3-metilpirazol-1-ilo
878	grupo 5-bromo-4-ciclopropil-3-metilpirazol-1-ilo
879	grupo 5-bromo-4-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
880	grupo 5-bromo-4-trifluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
881	grupo 3,5-dimetilpirazoM-ilo
882	grupo 5-etil-4-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
883	grupo 5-etil-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo

[Tabla 50]

sustituyentes n.º	Q ⁵
884	grupo 4-etoxi-5-etil-3-metilpirazol-1-ilo
885	grupo 5-trifluorometil-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
886	grupo 5 metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
887	grupo 4-fluoro-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
888	grupo 4-cloro-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
889	grupo 4-bromo-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
890	grupo 4-etil-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
891	grupo 4,5-dimetoxi-3-metilpirazol-1-ilo
892	grupo 4-etil-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
893	grupo 4-etoxi-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
894	grupo 4-ciano-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
895	grupo 4-ciclopropil-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
896	grupo 4-difluorometil-5-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
897	grupo 5-metoxi-3-metil-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
898	grupo 5-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
899	grupo 5-etoxi-4-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
900	grupo 5-etoxi-4-cloro-3-metilpirazol-1-ilo
901	grupo 5 etoxi-4-bromo3-metilpirazol-1-ilo
902	grupo 5-etoxi-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
903	grupo 5-etoxi-4-etil-3-metilpirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

904	grupo 5-etoxi-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
905	grupo 4,5-dietoxi-3-metilpirazol-1-ilo
906	grupo 4-ciano-5-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
907	grupo 4-ciclopropil-5-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
908	grupo 4-difluorometil-5-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
909	grupo 5-etoxi-4-trifluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
910	grupo 5-ciano-3-metilpirazol-1-ilo
911	grupo 5-ciano-4-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
912	grupo 5-ciano-4-cloro-3-metilpirazol-1-ilo

[Tabla 51]

sustituyentes n.º	Q ⁵
913	grupo 5-ciano-4-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
914	grupo 5-ciano-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
915	grupo 5-ciano-4-etil-3-metilpirazol-1-ilo
916	grupo 5-ciano-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
917	grupo 5-ciano-4-etoxi-3-metilpirazol-1-ilo
918	grupo 4,5-diciano-3-metilpirazol-1-ilo
919	grupo 5-ciano-4-ciclopropil-3-metilpirazol-1-ilo
920	grupo 5-ciano-4-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
921	grupo 5-ciano-4-trifluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
922	grupo 5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
923	grupo 5-difluorometil-4-fluoro-3-metilpirazol-1-ilo
924	grupo 4-cloro-5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
925	grupo 4-bromo-5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
926	grupo 5-difluorometil-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
927	grupo 4-etil-5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
928	grupo 5-difluorometil-4-metoxi-3-metilpirazol-1-ilo
929	grupo 4-etoxi-5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
930	grupo 4-ciano-5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
931	grupo 4-ciclopropil-5-difluorometil-3-metilpirazol-1-ilo
932	grupo 4,5-bis(difluorometil)-3-metilpirazol-1-ilo
933	grupo 5-difluorometil-3-metil-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
934	grupo 3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
935	grupo 4-fluoro-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
936	grupo 4-cloro-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
937	grupo 4-bromo-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
938	grupo 3,4-dimetil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
939	grupo 4-etil-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

940	grupo 4-metoxi-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
941	grupo 4-etoxi-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo

[Tabla 52]

sustituyentes n.º	Q ⁵
942	grupo 4-ciano-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
943	grupo 4-ciclopropil-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
944	grupo 4-difluorometil-3-metil-5-trifluorometilpirazol-1-ilo
945	grupo 4,5-bis(trifluorometil)-3-metilpirazol-1-ilo
946	grupo 3-etil-4-etoxi-5-metilpirazol-1-ilo
947	grupo 3-etil-4-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
948	grupo 3-etil-4-ciclopropil-5-metilpirazol-1-ilo
949	grupo 3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
950	grupo 3,4-difluoro-5-metil pirazol- 1-ilo
951	grupo 4-cloro-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
952	grupo 4-bromo-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
953	grupo 3-fluoro-4,5-dimetilpirazol-1-ilo
954	grupo 4-etil-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
955	grupo 3-fluoro-4-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
956	grupo 4-etoxi-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
957	grupo 4-ciano-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
958	grupo 4-ciclopropil-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
959	grupo 4-difluorometil-3-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
960	grupo 3-fluoro-5-metil-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
961	grupo 3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
962	grupo 3-cloro-4-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
963	grupo 3,4-dicloro-5-metilpirazol-1-ilo
964	grupo 4-bromo-3-cloro-5-metilpirazol-1-ilo
965	grupo 3-cloro-4,5-dimetilpirazol-1-ilo
966	grupo 3-cloro-4-etil-5-metilpirazol-1-ilo
967	grupo 3-cloro-4- metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
968	grupo 3-cloro-4-etoxi-5-metil pirazol- 1-ilo
969	grupo 3-cloro-4-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
970	grupo 3-cloro-4-ciclopropil-5-metilpirazol-1-ilo

[Tabla 53]

sustituyentes n.º	Q ⁵
971	grupo 3-cloro-4-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
972	grupo 3-cloro-5-metil-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
973	grupo 3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo

ES 2 630 323 T3

974	grupo 4-fluoro-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
975	grupo 4-cloro-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
976	grupo 4-bromo-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
977	grupo 3-metoxi-4,5-dimetilpirazol-1-ilo
978	grupo 4-etil-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
979	grupo 3,4-dimetoxi-5-metilpirazol-1-ilo
980	grupo 4-etoxi-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
981	grupo 4-ciano-3 metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
982	grupo 4-ciclopropil-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
983	grupo 4-difluorometil-3-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
984	grupo 5-metil-3-metoxi-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
985	grupo 3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
986	grupo 3-ciano-4-fluoro-5-metilpirazol-1-ilo
987	grupo 4-cloro-3-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
988	grupo 4-bromo-3 - ciano-5-metilpirazol-1-ilo
989	grupo 3-ciano-4,5-dimetilpirazol-1-ilo
990	grupo 3-ciano-4-etil-5-metilpirazol-1-ilo
991	grupo 3-ciano-4-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
992	grupo 3-ciano-4-etoxi-5-metilpirazol-1-ilo
993	grupo 3,4-diciano-5-metilpirazol-1-ilo
994	grupo 3-ciano-4-ciclopropil-5-metilpirazol-1-ilo
995	grupo 3-ciano-4-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
996	grupo 3-ciano-5-metil-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
997	grupo 3-ciclopropil-4-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
998	grupo 3-ciclopropil-4-etoxi-5-metilpirazol-1-ilo
999	grupo 3-ciclopropil-4-ciano-5-metilpirazol-1-ilo

[Tabla 54]

sustituyentes n.º	Q ⁵
1000	grupo 3-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
1001	grupo 4-fluorometil-3-difluoro-5-metilpirazol-1-ilo
1002	grupo 4-cloro-3-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
1003	grupo 4-bromo-3-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
1004	grupo 3-difluorometil-4,5-dimetilpirazol-1-ilo
1005	grupo 3-difluorometil-4-etil-5-metilpirazol-1-ilo
1006	grupo 3-difluorometil-4-metoxi-5-metilpirazol-1-ilo
1007	grupo 3-difluorometil-4-etoxi-5-metilpirazol-1-ilo
1008	grupo 3-difluorometil-4-ciano-5-metilpirazol-1-ilo
1009	grupo 3-difluorometil-4-ciclopropil-5-metilpirazol-1-ilo

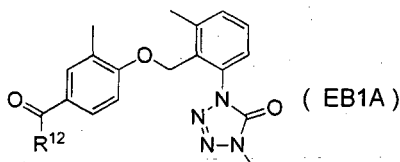
1010	grupo 4-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
1011	grupo 5-metil-4-trifluorometilpirazol-1-ilo
1012	grupo 5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1013	grupo 4-fluoro-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1014	grupo 4-cloro-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1015	grupo 4-bromo-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1016	grupo 4,5-dimetil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1017	grupo 4-etil-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1018	grupo 4-metoxi-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1019	grupo 4-etoxi-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1020	grupo 4-ciano-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1021	grupo 4-ciclopropil-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1022	grupo 4-difluoro-5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-ilo
1023	grupo 5-metil-3,4-bis(trifluorometil)pirazol-1-ilo

De acuerdo con los procesos mencionados anteriormente, pueden prepararse los siguientes compuestos:

5 Los Compuestos EB1A-001~EB1A-20, EB1B-001~EB1B-20, EB1C-001~EB1C-20, EB1D-001~EB1D-20, EB1E-001~EB1E-20, EB2A-001~EB2A-20, EB2B-001~EB2B-20, EB2C-001~EB2C-20, EB3A-001~EB3A-20, EB3B-001~EB3B-20, EB3C-001~EB3C-20, EB4A-001~EB4A-20, EB4B-001~EB4B-20, EB5A-001~EB5A-20, EB5B-001~EB5B-20, EB5C-001~EB5C-20, EB6A-001~EB6A-20 y EB6B-001~EB6B-20.

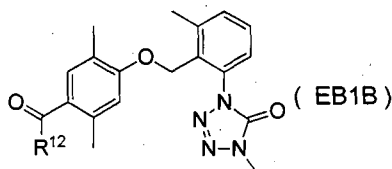
Los Compuestos EB1A-001~EB1A-20 represent Compounds represented by a formula:

10



[en la fórmula (EB1A), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

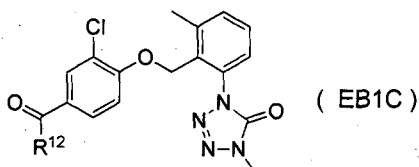
15 Los Compuestos EB1B-001~EB1B-20 representan los Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB1B), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

20

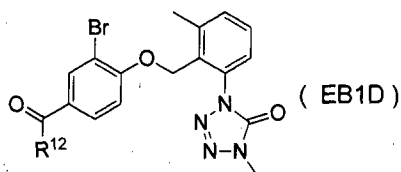
Los Compuestos EB1C-001~EB1C-20 representan los Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB1C), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB1D-001~EB1D-20 representan compuestos representados por una fórmula:

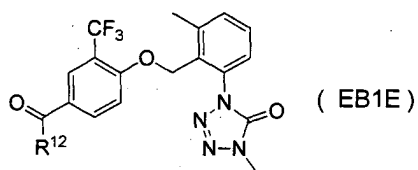
5



[en la fórmula (EB1D), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

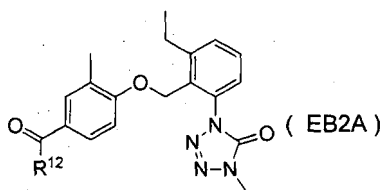
Los Compuestos EB1E-001~EB1E-20 representan compuestos representados por una fórmula:

10



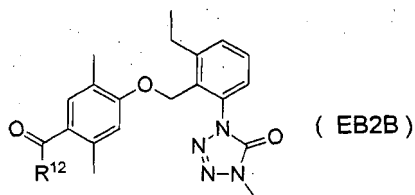
[en la fórmula (EB1E), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EB2A-001~EB2A-20 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB2A), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

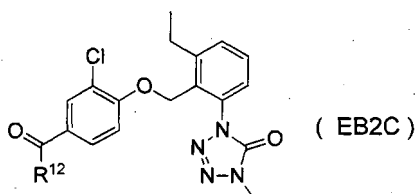
20 Los Compuestos EB2B-001~EB2B-20 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB2B), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

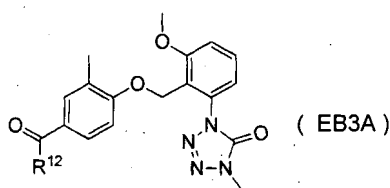
Los Compuestos EB2C-001~EB2C-20 representan compuestos representados por una fórmula:

30



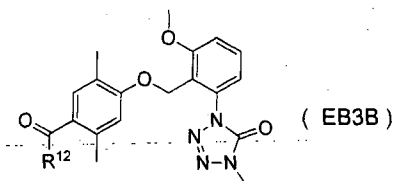
[en la fórmula (EB2C), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB3A-001~EB3A-20 representan compuestos representados por una fórmula:



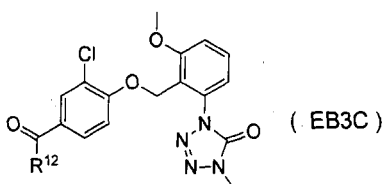
[en la fórmula (EB3A), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EB3B-001~EB3B-20 representan compuestos representados por una fórmula:



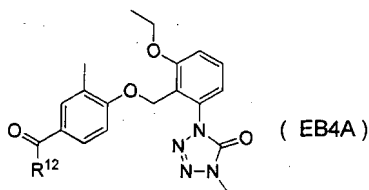
[en la fórmula (EB3B), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EB3C-001~EB3C-20 representan compuestos representados por una fórmula:



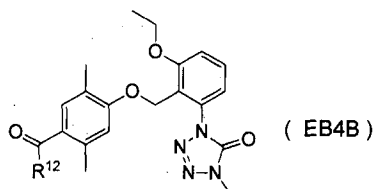
[en la fórmula (EB3C), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EB4A-001~EB4A-20 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB4A), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

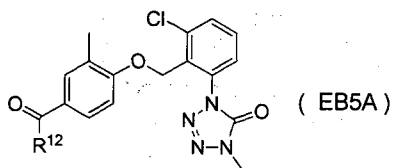
20 Los Compuestos EB4B-001~EB4B-20 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB4B), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

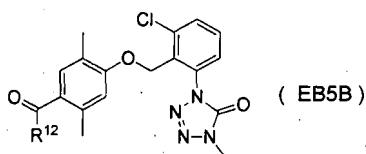
25 Los Compuestos EB5A-001~EB5A-20 representan compuestos representados por una fórmula:

30



[en la fórmula (EB5A), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

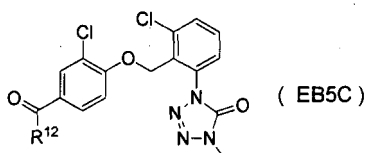
5 Los Compuestos EB5B-001~EB5B-20 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB5B), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

10

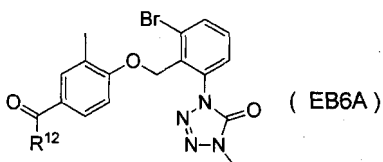
Los Compuestos EB5C-001~EB5C-20 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB5C), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

15

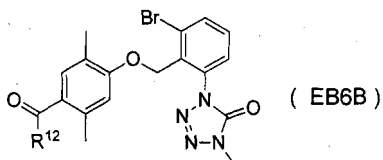
Los Compuestos EB6A-001~EB6A-20 representan compuestos representados por una fórmula:



20

[en la fórmula (EB6A), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación]; y

Los Compuestos EB6B-001~EB6B-20 representan compuestos representados por una fórmula:



25

[en la fórmula (EB6B), R¹² representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicado en la Tabla 55 como se menciona a continuación];

[Tabla 55]

sustituyentes n.º	R ¹²
1	grupo metilo
2	grupo etilo
3	grupo propilo
4	grupo butilo
5	grupo pentilo
6	grupo hexilo
7	grupo isopropilo
8	grupo <i>tert</i> -butilo
9	grupo isobutilo
10	grupo trifluorometilo
11	grupo triclorometilo
12	grupo 2,2-difluoroetilo
13	grupo ciclopropilo
14	grupo ciclobutilo
15	grupo ciclohexilo
16	grupo 1-fluoro-ciclopropilo
17	grupo 1-cloro-ciclopropilo
18	grupo 2,2-difluoro-ciclopropilo
19	grupo 2,2,3,3-tetrafluoro-ciclopropilo
20	grupo 1,2,2,3,3-pentafluoro-ciclopropilo

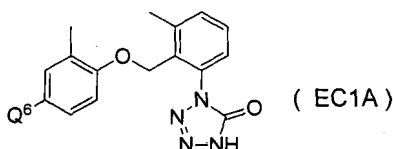
De acuerdo con los procesos mencionados anteriormente, pueden prepararse los siguientes compuestos:

5

Los Compuestos EC1A-001~EC1A-103, EC1B-001~EC1B-103, EC1C-001~EC1C-103, EC1D-001~EC1D-103, EC1E-001~EC1E-103, EC2A-001~EC2A-103, EC2B-001~EC2B-103, EC2C-001~EC2C-103, EC3A-001~EC3A-103, EC3B-001~EC3B-103, EC3C-001~EC3C-103, EC4A-001~EC4A-103, EC4B-001~EC4B-103, EC5A-001~EC5A-103, EC5B-001~EC5B-103, EC5C-001~EC5C-103, EC6A-001~EC6A-103 y EC6B-001~EC6B-103.

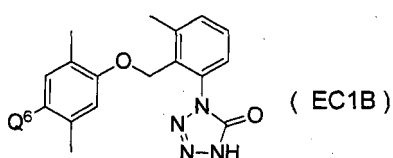
10

Los Compuestos EC1A-001~EC1A-103 representan compuestos representados por una fórmula:



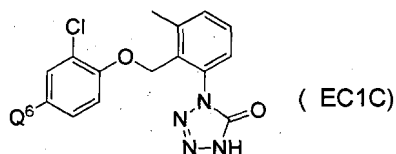
15 [en la fórmula (EC1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EC1B-001~EC1B-103 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EC1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

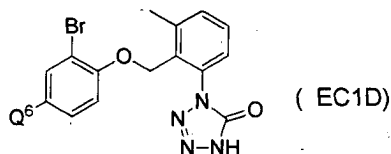
Los Compuestos EC1C-001~EC1C-103 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EC1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

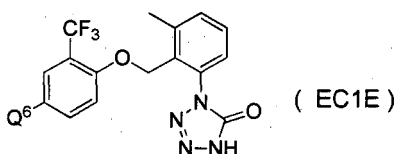
Los Compuestos EC1D-001~EC1D-103 representan compuestos representados por una fórmula:

10



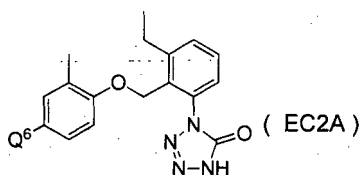
[en la fórmula (EC1D), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EC1E-001~EC1E-103 representan compuestos representados por una fórmula:



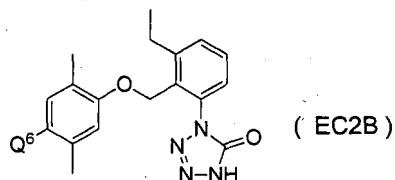
[en la fórmula (EC1E), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EC2A-001~EC2A-103 representan compuestos representados por una fórmula:



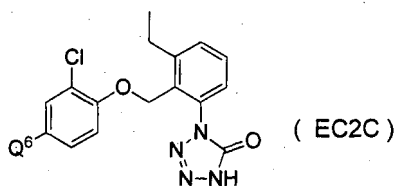
25 [en la fórmula (EC2A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EC2B-001~EC2B-103 representan compuestos representados por una fórmula:



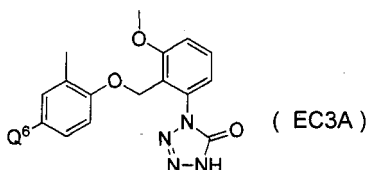
30 [en la fórmula (EC2B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EC2C-001~EC2C-103 representan compuestos representados por una fórmula:



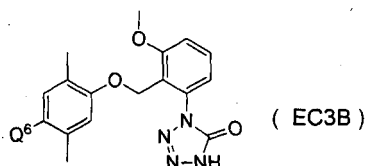
[en la fórmula (EC2C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

5 Los Compuestos EC3A-001~EC3A-103 representan compuestos representados por una fórmula:



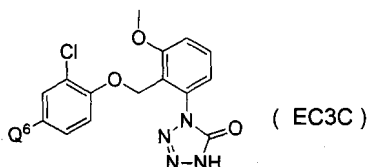
[en la fórmula (EC3A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EC3B-001~EC3B-103 representan compuestos representados por una fórmula:



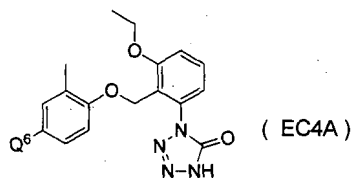
15 [en la fórmula (EC3B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EC3C-001~EC3C-103 representan compuestos representados por una fórmula:



20 [en la fórmula (EC3C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

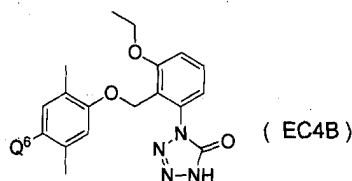
Los Compuestos EC4A-001~EC4A-103 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EC4A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

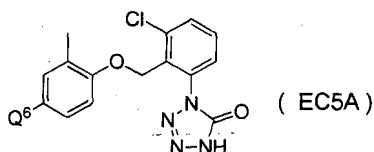
Los Compuestos EC4B-001~EC4B-103 representan compuestos representados por una fórmula:

30



[en la fórmula (EC4B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

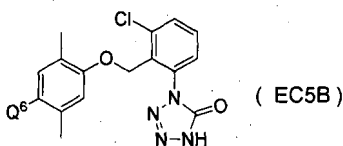
Los Compuestos EC5A-001~EC5A-103 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EC5A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

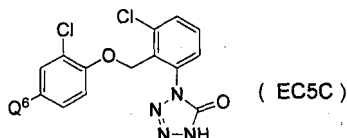
Los Compuestos EC5B-001~EC5B-103 representan compuestos representados por una fórmula:

10



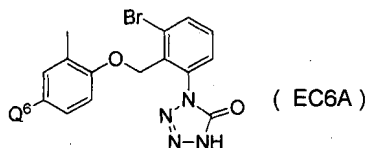
[en la fórmula (EC5B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

15 Los Compuestos EC5C-001~EC5C-103 representan compuestos representados por una fórmula:



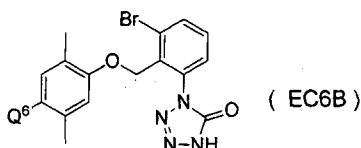
[en la fórmula (EC5C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EC6A-001~EC6A-103 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EC6A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación]; y

Los Compuestos EC6B-001~EC6B-103 representan compuestos representados por una fórmula:



30 [en la fórmula (EC6B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se menciona a continuación];

[Tabla 56]

sustituyentes n.º	Q ⁶
1	grupo 1,4,5-trimetil-1 H-pirazol-3-ilo

2	grupo 1,5-dimetil-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
3	grupo 1,5-dimetil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
4	grupo 1,5-dimetil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
5	grupo 1,5-dimetil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
6	grupo 1,5-dimetil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
7	grupo 1,5-dimetil-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
8	grupo 1-metil-4,5-dietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
9	grupo 1-metil-5-etil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
10	grupo 1-metil-5-etil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
11	grupo 1-metil-5-etil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
12	grupo 1-metil-5-etil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
13	grupo 1-metil-5-etil-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
14	grupo 1,4-dimetil-5-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
15	grupo 1-metil-5-propil-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
16	grupo 1-metil-5-propil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
17	grupo 1-metil-5-propil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
18	grupo 1-metil-5-propil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
19	grupo 1-metil-5-propil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
20	grupo 1-metil-5-propil-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
21	grupo 1,4-dimetil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
22	grupo 1-metil-5-metoxi-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 57]

sustituyentes n.º	Q ⁶
23	grupo 1-metil-5-metoxi-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
24	grupo 1-metil-5-metoxi-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
25	grupo 1-metil-5-metoxi-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
26	grupo 1-metil-5-metoxi-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
27	grupo 1-metil-5-metoxi-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
28	grupo 1,4-dimetil-5-etoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
29	grupo 1-metil-5-etoxi-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
30	grupo 1-metil-5-etoxi-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
31	grupo 1-metil-5-etoxi-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
32	grupo 1-metil-5-etoxi-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
33	grupo 1-metil-5-etoxi-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
34	grupo 1-metil-5-etoxi-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
35	grupo 1,4-dimetil-5-metiltio-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
36	grupo 1-metil-5-metiltio-4-etil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
37	grupo 1-metil-5-metiltio-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

ES 2 630 323 T3

38	grupo 1-metil-5-metiltio-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
39	grupo 1-metil-5-metiltio-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
40	grupo 1-metil-5-metiltio-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
41	grupo 1-metil-5-metiltio-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
42	grupo 1,4-dimetil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
43	grupo 1-metil-4-etil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
44	grupo 1,4-dimetil-5-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 58]

sustituyentes n.º	Q ⁶
45	grupo 1-metil-4-etil-5-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
46	grupo 1,4-dimetil-5-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
47	grupo 1-metil-4-etil-5-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
48	grupo 1,4-dimetil-5-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
49	grupo 1-metil-4-etil-5-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
50	grupo 1,4-dimetil-5-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
51	grupo 1-metil-4-etil-5-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
52	grupo 1-etil-4,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
53	grupo 1,4-dietil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
54	grupo 1-etil-5-metil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
55	grupo 1-etil-5-metil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
56	grupo 1-etil-5-metil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
57	grupo 1-etil-5-metil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
58	grupo 1-etil-5-metil-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
59	grupo 1,5-dietil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
60	grupo 1,4,5-trietil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
61	grupo 1,5-dietil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
62	grupo 1,5-dietil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
63	grupo 1,5-dietil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
64	grupo 1,5-dietil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
65	grupo 1,5-dietil-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
66	grupo 1-etil-5-propil-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 59]

sustituyentes n.º	Q ⁶
67	grupo 1,4-dietil-5-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
68	grupo 1-etil-5-propil-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
69	grupo 1-etil-5-propil-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
70	grupo 1-etil-5-propil-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
71	grupo 1-etil-5-propil-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
72	grupo 1-etil-5-propil-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
73	grupo 1-etil-5-metoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
74	grupo 1,4-dietil-5-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
75	grupo 1-etil-5-metoxi-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
76	grupo 1-etil-5-metoxi-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
77	grupo 1-etil-5-metoxi-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
78	grupo 1-etil-5-metoxi-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
79	grupo 1-etil-5-metoxi-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
80	grupo 1-etil-5-etoxi-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
81	grupo 1,4-dietil-5-etoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
82	grupo 1-etil-5-etoxi-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
83	grupo 1-etil-5-etoxi-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
84	grupo 1-etil-5-etoxi-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
85	grupo 1-etil-5-etoxi-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
86	grupo 1-etil-5-etoxi-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
87	grupo 1-etil-5-metiltio-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
88	grupo 1,4-dietil-5-metiltio-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 60]

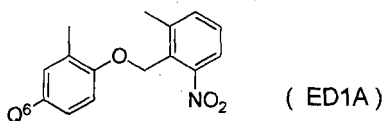
sustituyentes n.º	Q ⁶
89	grupo 1-etil-5-metiltio-4-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
90	grupo 1-etil-5-metiltio-4-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
91	grupo 1-etil-5-metiltio-4-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
92	grupo 1-etil-5-metiltio-4-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
93	grupo 1-etil-5-metiltio-4-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
94	grupo 1-etil-5-fluoro-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
95	grupo 1,4-dietil-5-fluoro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
96	grupo 1-etil-5-cloro-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
97	grupo 1,4-dietil-5-cloro-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
98	grupo 1-etil-5-bromo-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
99	grupo 1,4-dietil-5-bromo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
100	grupo 1-etil-5-yodo-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
101	grupo 1,4-dietil-5-yodo-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

102	grupo 1-etil-5-ciano-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
103	grupo 1,4-dietil-5-ciano-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

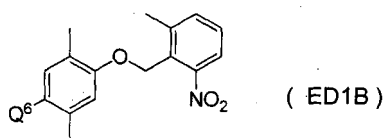
5 Compuestos ED1A-001~ED1A-103, ED1B-001~ED1B-103, ED1C-001~ED1C-103, ED1D-001~ED1D-103, ED1E-001~ED1E-103, ED2A-001~ED2A-103, ED2B-001~ED2B-103, ED2C-001~ED2C-103, ED3A-001~ED3A-103, ED3B-001~ED3B-103, ED4A-001~ED4A-103, ED4B-001~ED4B-103, ED5A-001~ED5A-103, ED5B-001~ED5B-103, ED5C-001~ED5C-103, ED6A-001~ED6A-103 y ED6B-001~ED6B-103.

10 Los Compuestos ED1A-001~ED1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



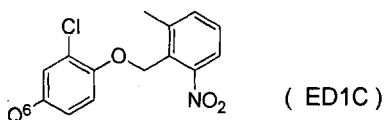
[en la fórmula (ED1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15 Los Compuestos ED1B-001~ED1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



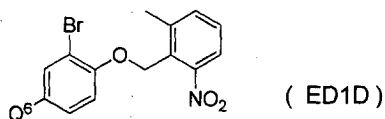
20 [en la fórmula (ED1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos ED1C-001~ED1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



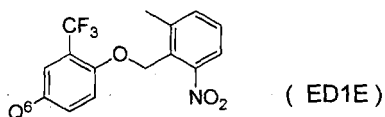
25 [en la fórmula (ED1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos ED1D-001~ED1D-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



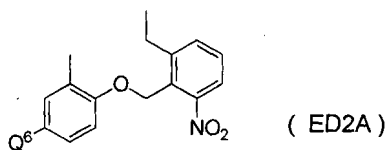
30 [en la fórmula (ED1D), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos ED1E-001~ED1E-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



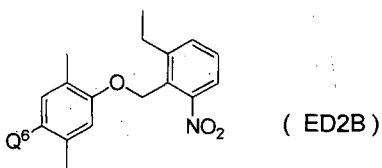
35 [en la fórmula (ED1E), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

40 Los Compuestos ED2A-001~ED2A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



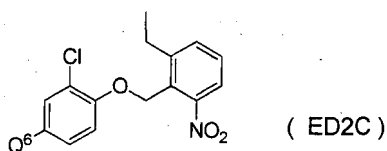
[en la fórmula (ED2A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos ED2B-001~ED2B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



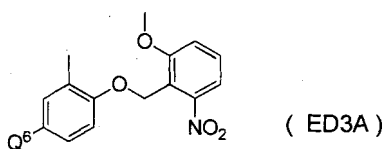
[en la fórmula (ED2B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10 Los Compuestos ED2C-001~ED2C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



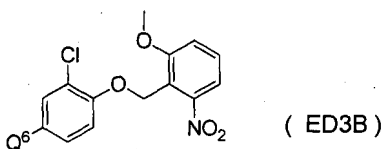
[en la fórmula (ED2C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15 Los Compuestos ED3A-001~ED3A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (ED3A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

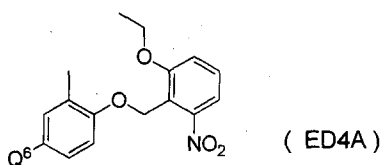
20 Los Compuestos ED3B-001~ED3B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (ED3B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

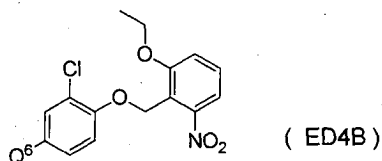
25 Los Compuestos ED4A-001~ED4A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

30

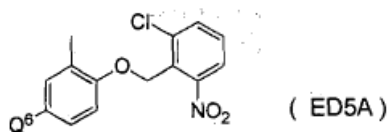


[en la fórmula (ED4A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

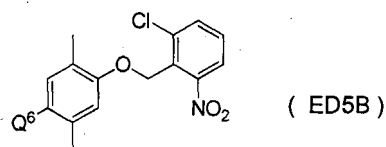
Los Compuestos ED4B-001~ED4B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



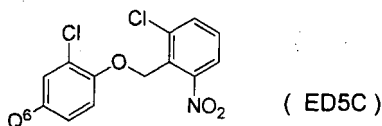
- 5 [en la fórmula (ED4B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
Los Compuestos ED5A-001~ED5A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



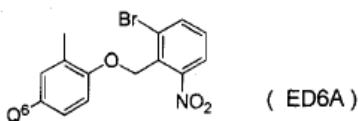
- 10 [en la fórmula (ED5A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
Los Compuestos ED5B-001~ED5B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



- 15 [en la fórmula (ED5B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
Los Compuestos ED5C-001~ED5C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

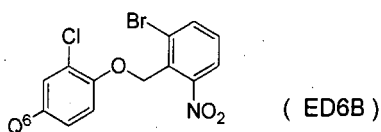


- 20 [en la fórmula (ED5C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
Los Compuestos ED6A-001~ED6A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



- 25 [en la fórmula (ED6A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

Los Compuestos ED6B-001~ED6B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



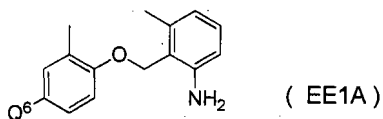
- 35 [en la fórmula (ED6B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

Compuestos EE1A-001~EE1A-103, EE1B-001~EE1B-103, EE1C-001~EE1C-103, EE1D-001~EE1D-103, EE1E-001~EE1E-103, EE2A-001~EE2A-103, EE2B-001~EE2B-103, EE2C-001~EE2C-103, EE3A-001~EE3A-103, EE3B-001~EE3B-103, EE4A-001~EE4A-103, EE4B-001~EE4B-103, EE5A-001~EE5A-103, EE5B-001~EE5B-103, EE5C-001~EE5C-103, EE6A-001~EE6A-103 y EE6B-001~EE6B-103.

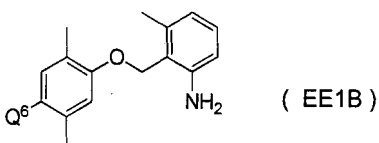
5

Los Compuestos EE1A-001~EE1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



10 [en la fórmula (EE1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

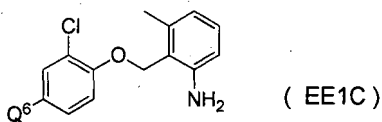
Los Compuestos EE1B-001~EE1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



15

[en la fórmula (EE1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EE1C-001~EE1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

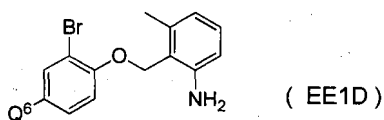


20

[en la fórmula (EE1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

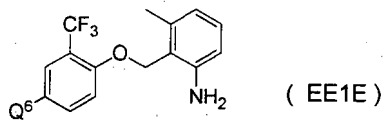
Los Compuestos EE1D-001~EE1D-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

25



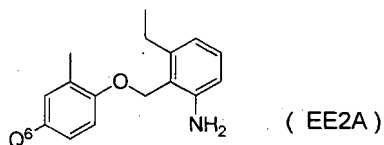
[en la fórmula (EE1D), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

30 Los Compuestos EE1E-001~EE1E-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



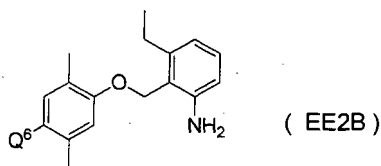
35 [en la fórmula (EE1E), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EE2A-001~EE2A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



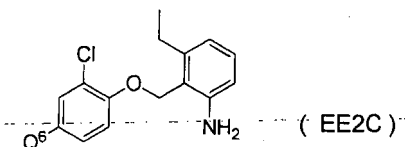
40 [en la fórmula (EE2A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EE2B-001~EE2B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



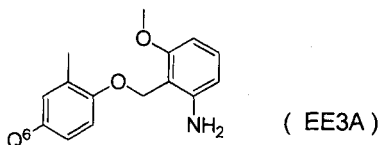
[en la fórmula (EE2B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos EE2C-001~EE2C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



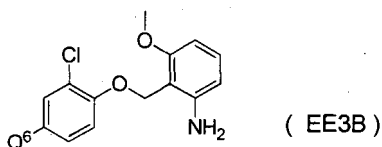
[en la fórmula (EE2C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10 Los Compuestos EE3A-001~EE3A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



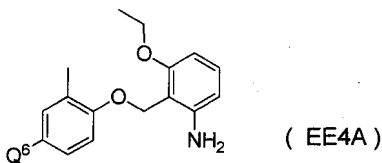
[en la fórmula (EE3A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15 Los Compuestos EE3B-001~EE3B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



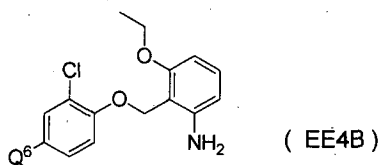
[en la fórmula (EE3B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

20 Los Compuestos EE4A-001~EE4A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



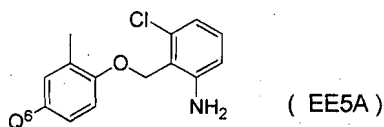
[en la fórmula (EE4A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

25 Los Compuestos EE4B-001~EE4B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



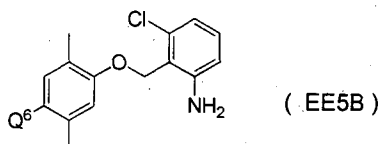
[en la fórmula (EE4B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

30 Los Compuestos EE5A-001~EE5A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EE5A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

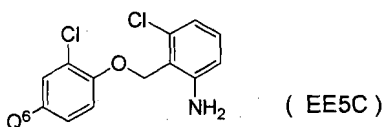
5 Los Compuestos EE5B-001~EE5B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EE5B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10

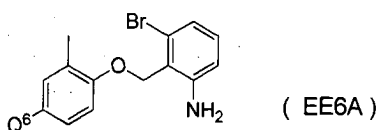
Los Compuestos EE5C-001~EE5C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EE5C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15

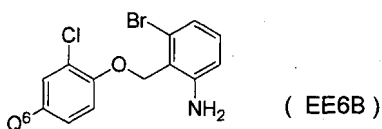
Los Compuestos EE6A-001~EE6A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



20

[en la fórmula (EE6A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

Los Compuestos EE6B-001~EE6B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



25

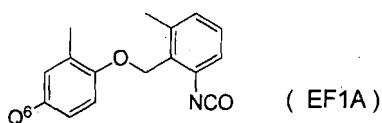
[en la fórmula (EE6B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

30 De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

Compuestos EF1A-001~EF1A-103, EF1B-001~EF1B-103, EF1C-001~EF1C-103, EF1D-001~EF1D-103, EF1E-001~EF1E-103, EF2A-001~EF2A-103, EF2B-001~EF2B-103, EF2C-001~EF2C-103, EF3A-001~EF3A-103, EF3B-001~EF3B-103, EF4A-001~EF4A-103, EF4B-001~EF4B-103, EF5A-001~EF5A-103, EF5B-001~EF5B-103, EF5C-001~EF5C-103, EF6A-001~EF6A-103 y EF6B-001~EF6B-103.

35

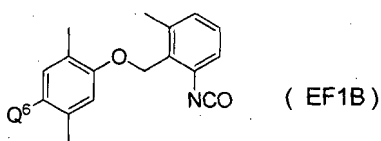
Los Compuestos EF1A-001~EF1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

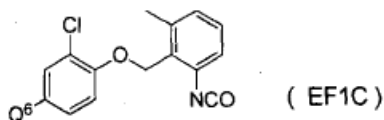
40

Los Compuestos EF1B-001~EF1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



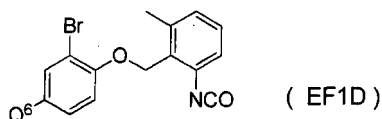
[en la fórmula (EF1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos EF1C-001~EF1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



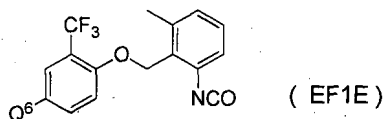
[en la fórmula (EF1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10 Los Compuestos EF1D-001~EF1D-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



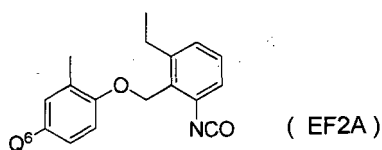
[en la fórmula (EF1D), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15 Los Compuestos EF1E-001~EF1E-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF1E), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

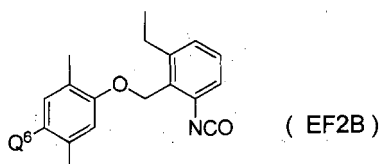
20 Los Compuestos EF2A-001~EF2A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF2A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

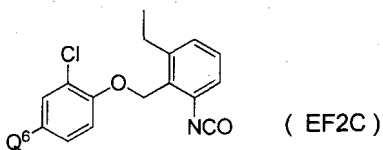
25 Los Compuestos EF2B-001~EF2B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

30



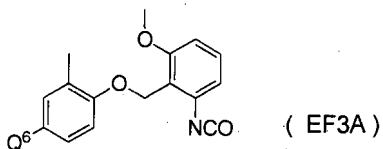
[en la fórmula (EF2B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

35 Los Compuestos EF2C-001~EF2C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF2C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

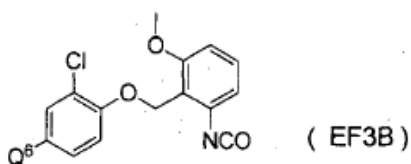
5 Los Compuestos EF3A-001~EF3A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF3A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10

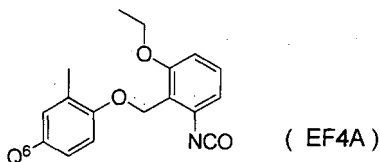
Los Compuestos EF3B-001~EF3B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF3B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15

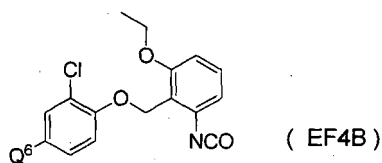
Los Compuestos EF4A-001~EF4A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EF4A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

20

Los Compuestos EF4B-001~EF4B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

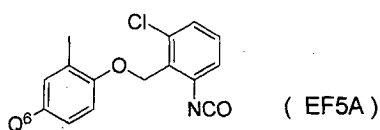


[en la fórmula (EF4B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

25

Los Compuestos EF5A-001~EF5A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

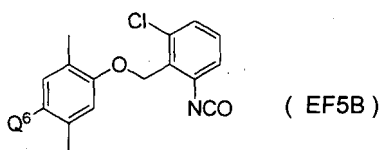
30



[en la fórmula (EF5A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

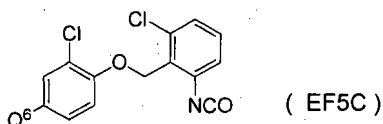
35

Los Compuestos EF5B-001~EF5B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



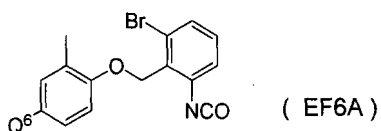
[en la fórmula (EF5B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos EF5c-001~EF5c-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



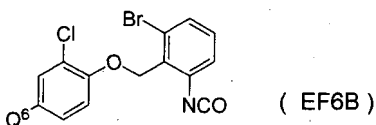
[en la fórmula (EF5c), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10 Los Compuestos EF6A-001~EF6A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



15 [en la fórmula (EF6A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

Los Compuestos EF6B-001~EF6B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

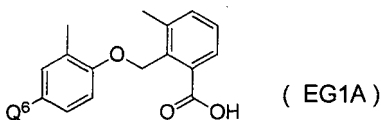


20 [en la fórmula (EF6B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

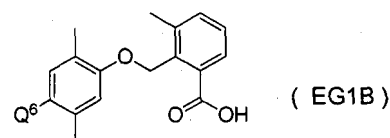
25 Compuestos EG1A-001~EG1A-103, EG1B-001~EG1B-103, EG1C-001~EG1C-103, EG1D-001~EG1D-103, EG1E-001~EG1E-103, EG2A-001~EG2A-103, EG2B-001~EG2B-103, EG2C-001~EG2C-103, EG3A-001~EG3A-103, EG3B-001~EG3B-103, EG4A-001~EG4A-103, EG4B-001~EG4B-103, EG5A-001~EG5A-103, EG5B-001~EG5B-103, EG5C-001~EG5C-103, EG6A-001~EG6A-103 y EG6B-001~EG6B-103.

30 Los Compuestos EG1A-001~EG1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



35 [en la fórmula (EG1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

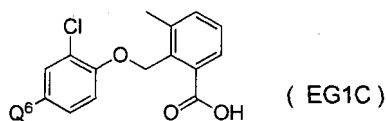
Los Compuestos EG1B-001~EG1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



40 [en la fórmula (EG1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103

indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

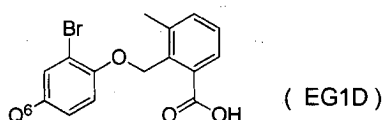
Los Compuestos EG1C-001~EG1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



5

[en la fórmula (EG1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

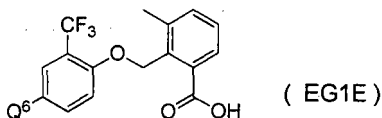
Los Compuestos EG1D-001~EG1D-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



10

[en la fórmula (EG1D), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

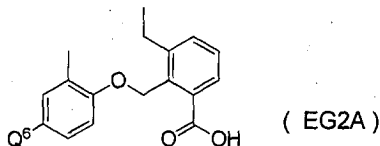
Los Compuestos EG1E-001~EG1E-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



15

[en la fórmula (EG1E), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

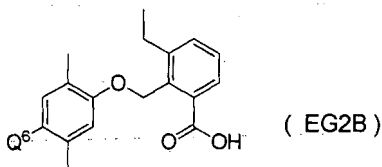
20 Los Compuestos EG2A-00~EG2A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



25

[en la fórmula (EG2A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

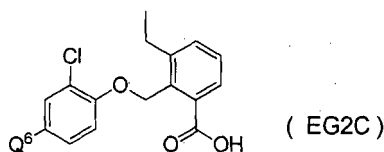
Los Compuestos EG2B-001~EG2B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



30

[en la fórmula (EG2B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

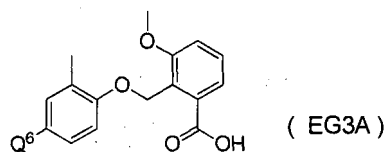
Los Compuestos EG2C-001~EG2C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



35

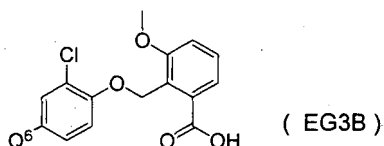
[en la fórmula (EG2C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EG3A-001~EG3A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



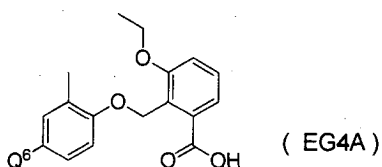
[en la fórmula (EG3A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos EG3B-001~EG3B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



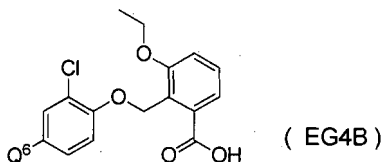
[en la fórmula (EG3B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10 Los Compuestos EG4A-001~EG4A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



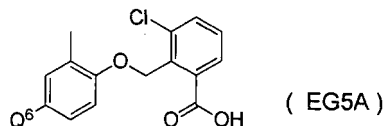
[en la fórmula (EG4A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

15 Los Compuestos EG4B-001~EG4B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EG4B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

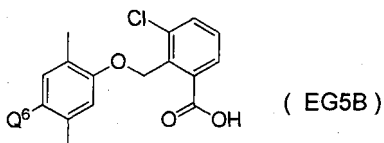
20 Los Compuestos EG5A-001~EG5A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EG5A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

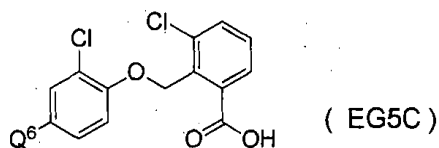
25 Los Compuestos EG5B-001~EG5B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

30



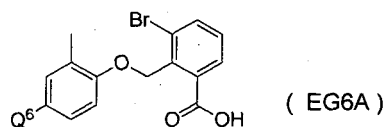
[en la fórmula (EG5B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

35 Los Compuestos EG5C-001~EG5C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



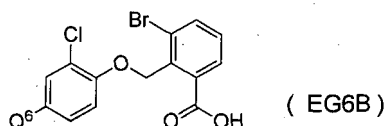
[en la fórmula (EG5C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos EG6A-001~EG6A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EG6A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

10 Los Compuestos EG6B-001~EG6B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

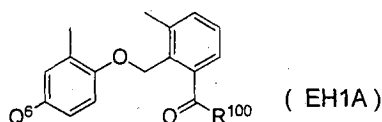


15 [en la fórmula (EG6B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

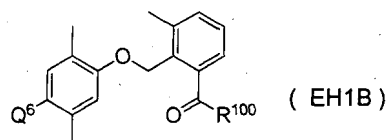
20 Compuestos EH1A-001~EH1A-103, EH1B-001~EH1B-103, EH1C-001~EH1C-103, EH1D-001~EH1D-103, EH1E-001~EH1E-103, EH1A-001~EH2A-103, EH2B-001~EH2B-103, EH2C-001~EH2C-103, EH3A-001~EH3A-103, EH3B-001~EH3B-103, EH4A-001~EH4A-103, EH4B-001~EH4B-103, EH5A-001~EH5A-103, EH5B-001~EH5B-103, EH5C-001~EH5C-103, EH6A-001~EH6A-103 y EH6B-001~EH6B-103.

25 Los Compuestos EH1A-001~EH1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



30 [en la fórmula (EH1A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

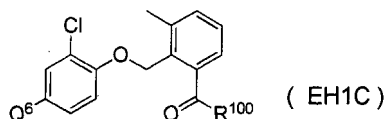
Los Compuestos EH1B-001~EH1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



35 [en la fórmula (EH1B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH1C-001~EH1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

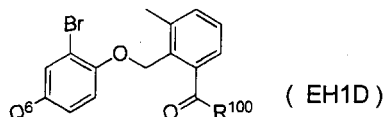
40



[en la fórmula (EH1C), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH1D-001~EH1D-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

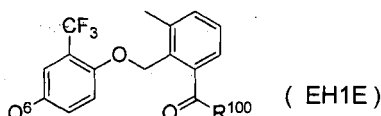
5



[en la fórmula (EH1D), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

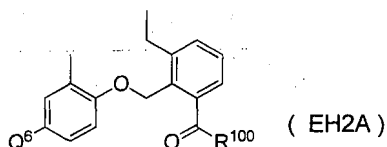
10

Los Compuestos EH1E-001~EH1E-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



15 [en la fórmula (EH1E), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

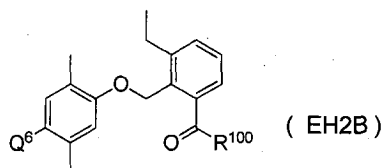
Los Compuestos EH2A-001~EH2A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



20

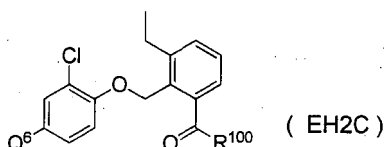
[en la fórmula (EH2A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

25 Los Compuestos EH2B-001~EH2B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



30 [en la fórmula (EH2B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH2C-001~EH2C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

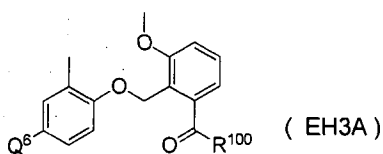


35

[en la fórmula (EH2C), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

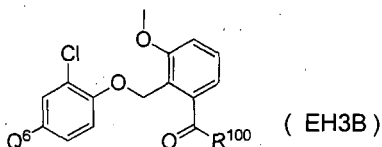
Los Compuestos EH3A-001~EH3A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

40



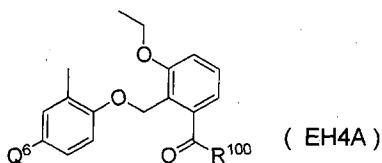
5 [en la fórmula (EH3A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH3B-001~EH3B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



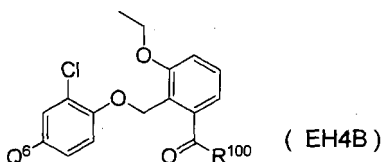
10 [en la fórmula (EH3B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH4A-001-EH4A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



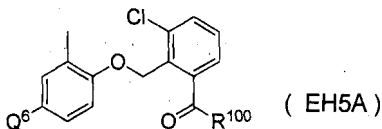
15 [en la fórmula (EH4A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

20 Los Compuestos EH4B-001~EH4B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EH4B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

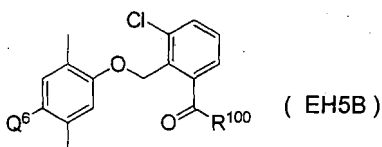
Los Compuestos EH5A-001~EH5A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



30 [en la fórmula (EH5A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH5B-001~EH5B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

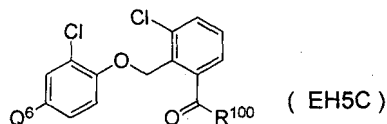
35



[en la fórmula (EH5B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EH5C-001~EH5C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

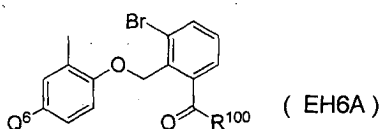
5



[en la fórmula (EH5C), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

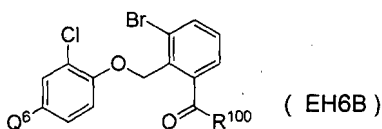
10

Los Compuestos EH6A-001-EH6A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EH6A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y los Compuestos EH6B-001~EH6B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

15



20

[en la fórmula (EH6B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

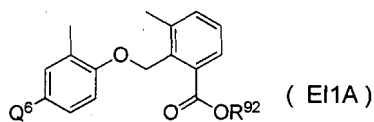
De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

25

Los Compuestos E11 A-001~E11 A-103, E11B-001~E11 B-103, EMC-001~E11C-103, E11D-001~E11 D-103, E11E-001~E11E-103, E11A-001~E12A-103, E12B-001~E12B-103, E12C-001~E12C-103, E13A-001~E13A-103, E13B-001~E13B-103, E14A-001~E14A-103, E14B-001~E14B-103, E15A-001~E15A-103, E15B-001~E15B-103, E15C-001~E15C-103, E16A-001~E16A-103 y E16B-001~E16B-103.

Los Compuestos E11A-001~E11A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

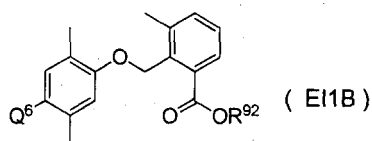
30



[en la fórmula (E11A), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos E11B-001~E11B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

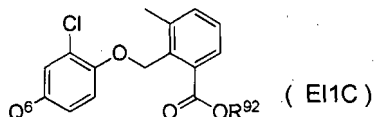
35



[en la fórmula (E11B), R^{92} son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q^6 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos E11C-001 ~E1 1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

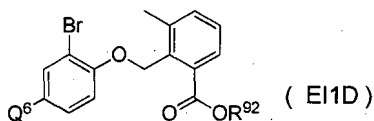
5



[en la fórmula (E11C), R^{92} son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q^6 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

10

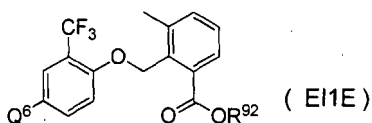
Los Compuestos E11D-001 ~E1 1D-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (E11D), R^{92} son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q^6 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos E11E-001~EME-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

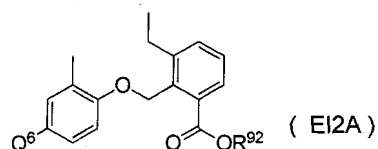
20



[en la fórmula (E11E), R^{92} son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q^6 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos E12A-001~E12A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

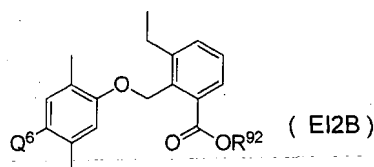
25



[en la fórmula (E12A), R^{92} son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q^6 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

30

Los Compuestos E12B-001~E12B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

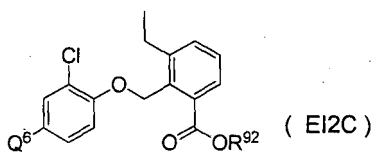


35

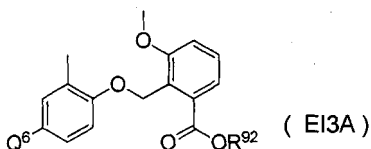
[en la fórmula (E12B), R^{92} son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q^6 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos E12C-001~E12C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

40

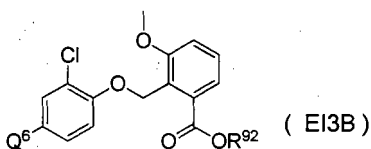


- 5 [en la fórmula (E12C), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
 Los Compuestos E13A-001-E13A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

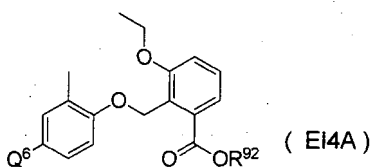


- 10 [en la fórmula (E13A), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
 Los Compuestos E13B-001~E13B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

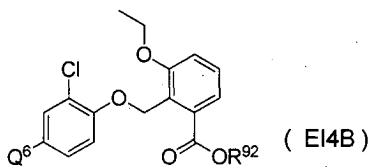
15



- 20 [en la fórmula (E13B), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
 Los Compuestos E14A-001~E14A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



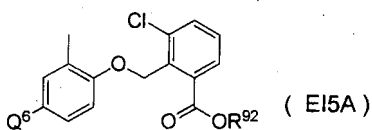
- 25 [en la fórmula (E14A), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];
 Los Compuestos E14B-001~E14B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



30

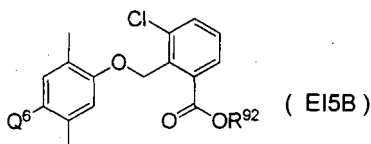
[en la fórmula (E14B), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

- 35 Los Compuestos E15A-001~E15A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



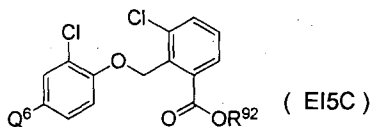
5 [en la fórmula (EI5A), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EI5B-001~EI5B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



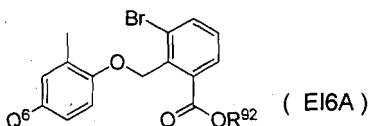
10 [en la fórmula (EI5B), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EI5C-001~EI5C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

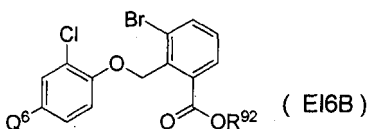


15 [en la fórmula (EI5C), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

20 Los Compuestos EI6A-001~EI6A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EI6A), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y los Compuestos EI6B-001~EI6B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

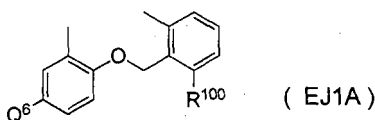


30 [en la fórmula (EI6B), R⁹² son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

35 De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

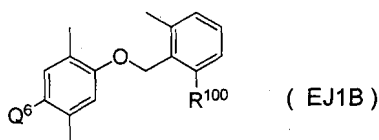
Compuestos EJ1A-001~EJ1A-103, EJ1B-001~EJ1B-103 y EJ1C-001~EJ1C-103.

40 Los Compuestos EJ1A-001~EJ1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

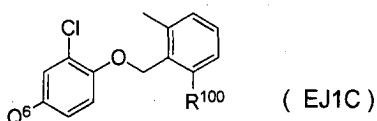


[en la fórmula (EJ1A), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

5 Los Compuestos EJ1B-001~EJ1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



10 [en la fórmula (EJ1B), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y los Compuestos EJ1C-001~EJ1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

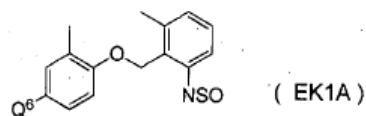


15 [en la fórmula (EJ1C), R¹⁰⁰ son las mismas como se ha descrito anteriormente, y Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicados en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

20 De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

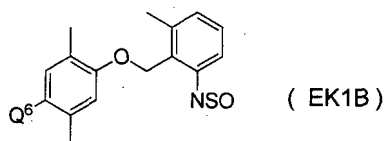
Compuestos EK1A-001~EK1A-103, EK1B-001~EK1B-103 y EK1C-001~EK1C-103.

25 Los Compuestos EK1A-001~EK1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

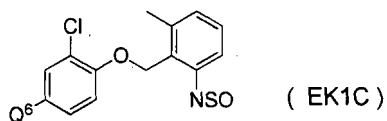


[en la fórmula (EK1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

30 Los Compuestos EK1B-001~EK1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



35 [en la fórmula (EK1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y Los Compuestos EK1C-001~EK1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

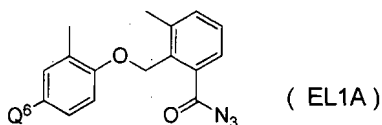


40 [en la fórmula (EK1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

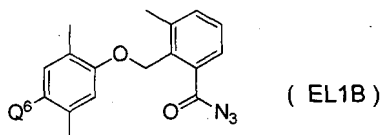
45 Compuestos EL1A-001~EL1A-103, EL1B-001~EL1B-103 y EL1C-001~EL1C-103.

Los Compuestos EL1A-001~EL1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



5 [en la fórmula (EL1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EL1B-001~EL1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



10 [en la fórmula (EL1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

Los Compuestos EL1C-001~EL1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

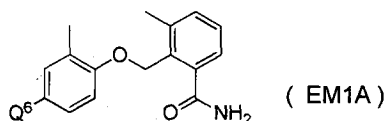


15 [en la fórmula (EL1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

20 De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

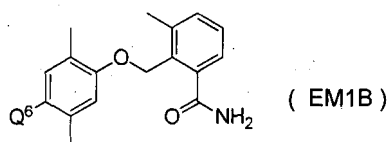
Compuestos EM1A-001~EM1A-103, EM1B-001~EM1B-103 y EM1C-001~EM1C-103.

25 Los Compuestos EM1A-001~EM1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



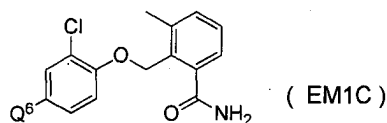
30 [en la fórmula (EM1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EM1B-001~EM1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



35 [en la fórmula (EM1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

Los Compuestos EM1C-001~EM1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

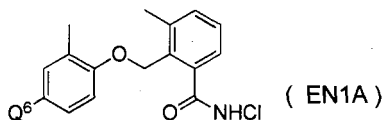


40 [en la fórmula (EM1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

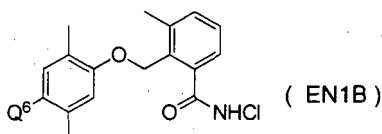
Compuestos EN1A-001~EN1A-103, EN1B-001~EN1B-103 y EN1C-001~EN1C-103.

5 Los Compuestos EN1A-001~EN1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



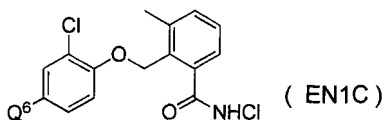
10 [en la fórmula (EN1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EN1B-001~EN1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



15 [en la fórmula (EN1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

Los Compuestos EN1C-001~EN1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

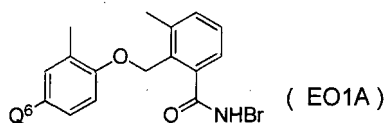


20 [en la fórmula (EN1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

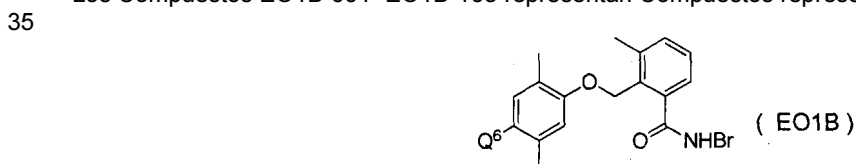
25 Compuestos EO1A-001~EO1A-103, EO1B-001~EO1B-103 y EO1C-001~EO1C-103.

Los Compuestos EO1A-001~EO1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



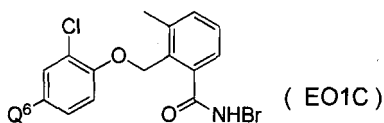
30 [en la fórmula (EO1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

Los Compuestos EO1B-001~EO1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



35 [en la fórmula (EO1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

40 Los Compuestos EO1C-001~EO1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



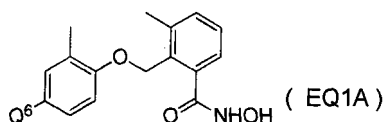
[en la fórmula (EO1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

5 De acuerdo con los procesos anteriormente mencionados, pueden prepararse los siguientes compuestos:

Compuestos EQ1A-001~EQ1A-103, EQ1B-001~EQ1B-103 y EQ1C-001~EQ1C-103.

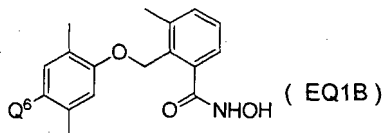
Los Compuestos EQ1A-001~EQ1A-103 representan Compuestos representados por una fórmula:

10



[en la fórmula (EQ1A), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente];

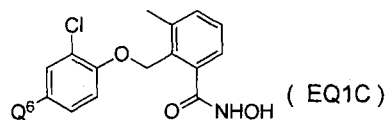
15 Los Compuestos EQ1B-001~EQ1B-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EQ1B), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente]; y

20

Los Compuestos EQ1C-001~EQ1C-103 representan Compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EQ1C), Q⁶ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 103 indicado en la Tabla 56 a Tabla 60 como se ha mencionado anteriormente].

A continuación, los Ejemplos de formulación se muestran a continuación. En los Ejemplos, la expresión "parte o partes" significa parte o partes por peso a menos que se indique otra cosa.

30

Ejemplo de formulación 1

Cincuenta (50) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 306, 3 partes de lignosulfonato de calcio, 2 partes de lauril sulfato de magnesio y 45 partes de dióxido de silicio hidratado sintético se mezclan bien al moler para obtener una formulación.

35

Ejemplo de formulación 2

Veinte (20) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 306, 1,5 partes de trioleato de sorbitano se mezclan con 28,5 partes de unas soluciones acuosas que contienen 2 partes de alcohol polivinílico, y después, la mezcla se muele finamente por un método de molienda en húmedo. A esta mezcla, después se le añaden 40 partes de unas soluciones acuosas que contenían 0,05 partes de goma xantano y 0,1 partes de aluminio magnesio, silicato, y se añaden a la misma 10 partes de propilenglicol. La mezcla se agita para obtener una formulación.

40

45 Ejemplo de formulación 3

Dos (2) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 306, 88 partes de arcilla de caolina y 10 partes de talco se muelen en mezcla para obtener una formulación.

50

Ejemplo de formulación 4

Cinco (5) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 306, 14 partes de polioxietileno estiril fenil éter, 6

partes de dodecilmecano sulfonato de calcio y 75 partes de xileno se muelen en mezcla para obtener una formulación.

Ejemplo de formulación 5

5 Dos (2) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 306, una parte de dióxido de silicio hidratado sintético, 2 partes de lignosulfonato de calcio, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla de caolinita se muelen en mezcla y se añade agua a la misma y la mezcla se amasa bien y después se granula y se seca para obtener una formulación.

10 Ejemplo de formulación 6

Diez (10) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 306, 35 partes de carbono blanco que contenía 50 partes de sulfato de alquil éter de polioxietileno y amonio, y 55 partes de agua se mezclan, y la mezcla después, se muele finamente por un método de molienda en húmedo para obtener una formulación.

A continuación, Los ejemplos de prueba se usan para mostrar una eficacia de los presentes compuestos en el control de enfermedades de plantas.

20 En el presente documento se evaluaron los efectos de control observando visualmente un área de lesión en las plantas ensayadas y seguidamente se comparó el área de lesión de las plantas tratadas con los presentes compuestos con una zona de lesión de las plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 1

25 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de arroz (cv; Nipponbare) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante veinte días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 2, 3, 4, 5, 6, 7, 13, 15, 17, 30, 34, 36, 40, 41,44, 47, 48, 50, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 64, 65, 66, 72, 75, 76, 78, 84, 85, 86, 87, 89, 90, 91, 104, 105, 106, 107, 108, 117, 118, 119, 121, 122, 124, 129, 130, 30 141, 143, 146, 148, 150, 156, 157, 159, 160, 181,224,225, 292, 295, 298, 299 y 300 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del arroz mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, Las plantas se secaron al aire y se colocaron a 24 °C durante el día ya 20 ° C durante la noche en una alta humedad 35 durante 6 días mientras que el arroz tratado con pulverización anteriormente mencionado se ponía en contacto con las plántulas de arroz (cv;Nipponbare) infectadas por hongos blastos del arroz (*Magnaporthe grisea*), y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos, 3, 4, 5, 6, 7, 13, 15, 17, 30, 34, 36, 40, 41, 44, 47, 48, 50, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 64, 65, 40 66, 72, 75, 76, 78, 84, 85, 86, 87, 89, 90, 91, 104, 105, 106, 107, 108, 117, 118, 119, 121, 122, 124, 129, 130, 141, 143, 146, 148, 150, 156, 157, 159, 160, 181,224, 225, 292, 295, 298, 299 y 300 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 2

45 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de trigo (cv; Shirogane) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 9 días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 4, 5, 6, 7, 13, 15, 22, 30, 39, 41, 44, 46, 47, 48, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 62, 63, 72, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 94, 127, 130, 131, 140, 142, 143, 144, 145, 146, 152, 156, 157, 158, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 190, 191, 192, 194 y 292 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de 50 formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del trigo mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y se colocaron a 20 °C en iluminación durante 5 días. Las esporas de los hongos de la rustina del trigo (*Puccinia recondita*) se inoculó por rocío. Después de la inoculación, las plantas se colocaron en un estado oscuro y húmedo a 23 °C durante 1 día 55 y después se cultivaron a 20°C en bajo iluminación durante 8 días y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 4, 5, 6, 7, 13, 15, 22, 30, 39, 41,44, 46, 47, 48, 50, 51,52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 62, 63, 72, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 94, 127, 130, 131, 140, 142, 143, 144, 145, 146, 152, 156, 157, 158, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 190, 191, 192, 194 y 292 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no 60 tratadas.

Ejemplo de prueba 3

65 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de cebada (cv; Mikamo Golden) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 7 días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 1,4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31,32, 33, 34,

35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 90, 91, 92, 93, 94, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 124, 125, 126, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 158, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 178, 179, 181, 182, 185, 190, 191, 192, 194, 223, 224, 225, 226, 227, 292, 293, 295, 297, 299 y 300 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas de la cebada anteriormente mencionada. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 2 días, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de las esporas de hongos blotch netos de cebada (*Pyrenophora teres*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron a 23 °C durante el día y a 20 °C durante la noche en bajo una alta humedad durante 3 días y después se cultivaron en el invernadero durante 7 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 1, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 90, 91, 92, 93, 94, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 124, 125, 126, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 158, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 178, 179, 181, 182, 185, 190, 191, 192, 194, 223, 224, 225, 226, 227, 292, 293, 295, 297, 299 y 300 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 4

Se llenó una maceta de plástico con tierra y al mismo tiempo las semillas de frijol (cv; Nagauzurasaitou) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 8 días. Cualquiera de los presentes Compuestos 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 39, 40, 41, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 100, 102, 109, 110, 111, 116, 117, 120, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 132, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 175, 178, 179, 181, 182, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 292, 295, 297, 298, 299 y 300 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas de la judía mencionada anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y se colocó un medio PDA que contenía hifas de hongos de podredumbre de frijol sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*) sobre las hojas del frijol. Después de la inoculación, todos los frijoles se colocaron en una alta humedad durante solo la noche y después de cuatro días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 39, 40, 41, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 100, 102, 109, 110, 111, 116, 117, 120, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 132, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 175, 178, 179, 181, 182, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 292, 295, 297, 298, 299 y 300 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 5

Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de trigo (cv; Apogee) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 10 días. Cada uno de los presentes Compuestos 1, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 44, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 104, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 140, 142, 143, 144, 145, 146, 153, 154, 155, 156, 157, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 179, 181, 182, 190, 191, 192, 194, 292, 293, 299 y 300 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del trigo mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 4 días, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de las esporas de hongos blotch de hojas de trigo (*Septoria tritici*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron a 18 °C bajo una alta humedad durante 3 días y después en bajo iluminación durante 14 a 18 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 1, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 17, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 30, 32, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 44, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 104, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 140, 142, 143, 144, 145, 146, 153, 154, 155, 156, 157, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 179, 181, 182, 190, 191, 192, 194, 292, 293, 299 y 300 mostraron un 30 % o menos en comparación con

el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 6

5 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de pepino (cv; Sagamihanjiro) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 12 días. Cada uno de los presentes Compuestos 1, 4, 5, 6, 7, 9, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 19, 20, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 94, 126, 182, 219, 292, 295, 297, 298, 299 y 300 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del pepino anteriormente mencionado. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y las esporas del hongo del oídio (*Sphaerotheca fuliginea*) se inocularon por rocío. Las plantas se colocaron en un invernadero de 24 °C durante el día y 20 °C durante la noche durante 8 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 1, 4, 5, 6, 7, 9, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 19, 20, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 94, 126, 182, 219, 292, 295, 297, 298, 299 y 300 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

20 Ejemplo de prueba 7

Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de arroz (cv; Nipponbare) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante veinte días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 2, 3, 9, 10, 11, 14, 18, 24, 27, 37, 46, 49, 54, 74, 88, 92, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 109, 110, 115, 118, 119, 120, 121, 123, 124, 128, 131, 142, 144, 145, 149, 152, 153, 154, 155, 169, 182, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 244, 246, 247, 256, 257, 258, 259, 260, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del arroz mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y se colocaron a 24 °C durante el día y 20 °C durante la noche en una alta humedad durante 6 días mientras que el arroz tratado con pulverización anteriormente mencionada se ponía en contacto con las plántulas de arroz (cv; Nipponbare) infectadas por hongos blastos del arroz (*Magnaporthe grisea*), y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 3, 9, 10, 11, 14, 18, 24, 27, 37, 46, 49, 54, 74, 88, 92, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 109, 110, 115, 118, 119, 120, 121, 123, 124, 128, 131, 142, 144, 145, 149, 152, 153, 154, 155, 169, 182, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 244, 246, 247, 256, 257, 258, 259, 260, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 8

45 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de trigo (cv; Shirogane) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 9 días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 1, 2, 3, 8, 17, 19, 24, 29, 35, 37, 38, 40, 43, 49, 60, 61, 65, 66, 70, 71, 73, 74, 75, 76, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 87, 90, 91, 92, 95, 96, 98, 99, 101, 102, 103, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 114, 115, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 128, 129, 132, 141, 147, 148, 149, 150, 153, 154, 155, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 179, 181, 182, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 235, 236, 238, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 250, 256, 257, 258, 259, 260, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del trigo mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y se colocaron a 20 °C en iluminación durante 5 días. Las esporas de los hongos de la rustina del trigo (*Puccinia recondita*) se inoculó por rocío. Después de la inoculación, las plantas se colocaron en un estado oscuro y húmedo a 23 °C durante 1 día y después se cultivaron a 20°C en bajo iluminación durante 8 días y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 1, 2, 3, 8, 17, 19, 24, 29, 35, 37, 38, 40, 43, 49, 60, 61, 65, 66, 70, 71, 73, 74, 75, 76, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 87, 90, 91, 92, 95, 96, 98, 99, 101, 102, 103, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 114, 115, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 128, 129, 132, 141, 147, 148, 149, 150, 153, 154, 155, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 179, 181, 182, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 235, 236, 238, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 250, 256, 257, 258, 259, 260, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 9

Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de cebada (cv; Mikamo Golden) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 7 días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 2, 3, 18, 30, 31, 89, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 112, 118, 119, 120, 121, 149, 150, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 235, 236, 238, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 250, 256, 257, 258, 259, 260, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas de la cebada anteriormente mencionada. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 2 días, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de las esporas de hongos blotch netos de cebada (*Pyrenophora teres*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron a 23 °C durante el día y a 20 ° durante la noche en bajo una alta humedad durante 3 días y después se cultivaron en el invernadero durante 7 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 3, 18, 30, 31, 89, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 112, 118, 119, 120, 121, 149, 150, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 235, 236, 238, 241, 242, 243, 244, 245, 246, 247, 250, 256, 257, 258, 259, 260, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 10

Se llenó una maceta de plástico con tierra y al mismo tiempo las semillas de frijol (cv; Nagauzurasaitou) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 8 días. Cualquiera de los presentes Compuestos 12, 13, 21, 22, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 40, 41, 43, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 73, 79, 80, 81, 82, 85, 104, 105, 106, 107, 108, 112, 113, 114, 115, 118, 119, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 221, 223, 228, 229, 231, 244, 245, 246, 247, 248, 250, 255, 256, 259, 260, 263, 265, 267, 274, 275, 276, 277 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas de la judía mencionada anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y se colocó un medio PDA que contenía hifas de hongos de podredumbre de frijol (*Sclerotinia sclerotiorum*) sobre las hojas del frijol. Después de la inoculación, todos los frijoles se colocaron en una alta humedad durante solo la noche y después de cuatro días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en las plantas se trataron con cualquiera de los presentes Compuestos 12, 13, 21, 22, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 37, 38, 40, 41, 43, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 73, 79, 80, 81, 82, 85, 104, 105, 106, 107, 108, 112, 113, 114, 115, 118, 119, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 221, 223, 228, 229, 231, 244, 245, 246, 247, 248, 250, 255, 256, 259, 260, 263, 265, 267, 274, 275, 276, 277 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 11

Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de trigo (cv; Apogee) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 10 días. Cada de los presentes Compuestos 2, 3, 20, 31, 41, 43, 57, 56, 58, 66, 68, 69, 79, 80, 81, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 141, 147, 148, 149, 150, 152, 158, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 178, 179, 181, 182, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 241, 244, 245, 246, 247, 250, 253, 254, 256, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del trigo mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 4 días, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de las esporas de hongos blotch de hojas de trigo (*Septoria tritici*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron a 18 ° C bajo una alta humedad durante 3 días y después en bajo iluminación durante 14 a 18 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 3, 20, 31, 41, 43, 57, 56, 58, 66, 68, 69, 79, 80, 81, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 141, 147, 148, 149, 150, 152, 158, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 178, 179, 181, 182, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 241, 244, 245, 246, 247, 250, 253, 254, 256, 263, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285

mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 12

5 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de pepino (cv; Sagamihanjiro) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 12 días. Cada de los presentes Compuestos 2, 3, 56, 79, 80, 86, 87, 95, 96, 97, 98, 100, 102, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 129, 130, 131, 132, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 149, 150, 152, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 160, 181, 186, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 10 215, 216, 217, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 227, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 244, 245, 246, 247, 250, 255, 256, 258, 259, 260, 261, 263, 264, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del pepino anteriormente mencionado. Después de pulverizar las diluciones, las 15 plantas se secaron al aire y las esporas del hongo del oidio (*Sphaerotheca fuliginea*) se inocularon por rocío. Las plantas se colocaron en un invernadero de 24 °C durante el día y 20 °C durante la noche durante 8 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 3, 56, 79, 80, 86, 87, 95, 96, 97, 98, 100, 102, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 112, 113, 114, 115, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 129, 130, 131, 132, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 149, 150, 152, 154, 155, 20 156, 157, 158, 159, 160, 181, 186, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 204, 205, 206, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 227, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 244, 245, 246, 247, 250, 255, 256, 258, 259, 260, 261, 263, 264, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 281, 284 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

25 Ejemplo de prueba 13

Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de habas de soja (cv; Kurosengoku) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 13 días. Cada de los presentes Compuestos 2, 4, 5, 7, 13, 17, 20, 22, 24, 26, 29, 30, 35, 39, 40, 41, 44, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 30 64, 65, 66, 70, 71, 72, 73, 75, 76, 80, 81, 82, 84, 85, 86, 87, 89, 90, 91, 92, 94, 96, 98, 99, 100, 101, 102, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 114, 115, 118, 119, 122, 123, 124, 127, 130, 131, 141, 143, 147, 148, 150, 153, 154, 160, 181, 188, 190, 191, 192, 193, 194, 196, 204, 205, 206, 207, 208, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 218, 219, 220, 222, 223, 225, 229, 230, 231, 232, 233, 236, 238, 244, 245, 250, 263, 272, 275, 276 y 284 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una 35 concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del pepino anteriormente mencionado. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 2 días, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de las esporas de hongos de la russtina de la soja (*phakopsora pachyrhizi*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron en un invernadero a 23 °C durante el día y a 20 ° durante la noche en bajo una alta humedad durante 3 días y después 40 se cultivaron en el invernadero durante 14 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 4, 5, 7, 13, 17, 20, 22, 24, 26, 29, 30, 35, 39, 40, 41, 44, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 64, 65, 66, 70, 71, 72, 73, 75, 76, 80, 81, 82, 84, 85, 86, 87, 89, 90, 91, 92, 94, 96, 98, 99, 100, 101, 102, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 114, 115, 118, 119, 122, 123, 124, 127, 130, 131, 141, 143, 147, 148, 150, 153, 154, 160, 181, 188, 190, 191, 192, 193, 194, 196, 204, 45 205, 206, 207, 208, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 218, 219, 220, 222, 223, 225, 229, 230, 231, 232, 233, 236, 238, 244, 245, 250, 263, 272, 275, 276 y 284 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 14

50 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de cebada (cv; Mikamo Golden) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 7 días. Cada de los presentes Compuestos 1, 2, 3, 6, 7, 8, 9, 11, 13, 14, 15, 17, 18, 20, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 35, 36, 38, 39, 40, 43, 44, 45, 46, 47, 49, 52, 53, 54, 56, 57, 59, 61, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 72, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 87, 88, 90, 92, 95, 96, 55 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 124, 125, 129, 130, 131, 132, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 178, 179, 181, 181, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 238, 244, 245, 246, 248, 250, 253, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 263, 264, 265, 60 267, 272, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas de la cebada anteriormente mencionada. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 2 días, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de esporas de hongos de manchas de hoja de cebada 65 (*Rhynchosporium secalis*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron en un invernadero a 23 °C durante el día y a 20 ° durante la noche en bajo una alta humedad durante 3 días y después se cultivaron en el invernadero

5 durante 7 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 1, 2, 3, 6, 7, 8, 9, 11, 13, 14, 15, 17, 18, 20, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 35, 36, 38, 39, 40, 43, 44, 45, 46, 47, 49, 52, 53, 54, 56, 57, 59, 61, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 72, 74, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 87, 88, 90, 92, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 124, 125, 129, 130, 131, 132, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 159, 160, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 178, 179, 181, 181, 190, 191, 192, 194, 195, 196, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 227, 230, 231, 232, 233, 234, 235, 238, 244, 245, 246, 248, 250, 253, 256, 257, 258, 259, 260, 261, 263, 264, 265, 267, 272, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 15

15 Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de tomate (cv; Patio) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 20 días. Los presentes compuestos 24, 44, 47, 48, 52, 53, 57, 59, 65, 84, 85, 87, 90, 93 y 100 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (500 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del tomate anteriormente mencionado. Después de que las plantas se secaron al aire hasta tal punto que las diluciones se secaron, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de las esporas de hongos del tizón tardío del tomate (*Phytophthora infestans*). Después de la inoculación, las plantas se colocaron primero a 23 °C en una alta humedad durante 1 día y después se cultivaron en el invernadero durante 4 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes compuestos 24, 44, 47, 48, 52, 53, 57, 59, 65, 84, 85, 87, 90, 93 y 100 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 16

30 Una maceta de plástico se llebó con tierra y al mismo tiempo las semillas de pepino (cv; Sagamihanjiro) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 19 días. Cada de los presentes Compuestos 2, 3, 6, 47, 48, 54, 56 a 59, 90, 91, 93 a 96, 98, 100, 102, 104 a 110, 112 a 115, 118 a 121, 123, 130 a 132, 141 a 152, 154 a 174, 188 a 196, 204 a 208, 210 a 221, 223, 225, 227, 228, 229, 231, 232, 233, 235, 236, 261, 263, 295, 297, 298, 299 y 300 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del pepino anteriormente mencionado. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 1 día, se inoculó una suspensión acuosa de las esporas de hongos puntuales del pepino (*Corynespora cassiicola*). Después de una inoculación, las plantas se colocaron a 24 °C durante el día y a 20 °C durante la noche en una alta humedad durante 7 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 3, 6, 47, 48, 54, 56 a 59, 90, 91, 93 a 96, 98, 100, 102, 104 a 110, 112 a 115, 118 a 121, 123, 130 a 132, 141 a 152, 154 a 174, 188 a 196, 204 a 208, 210 a 221, 223, 225, 227, 228, 229, 231, 232, 233, 235, 236, 261, 263, 295, 297, 298, 299 y 300 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 17

45 Una maceta de plástico se llebó con tierra y al mismo tiempo las semillas de pepino (cv; Sagamihanjiro) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 19 días. Cada de los presentes Compuestos 2, 3, 47, 48, 56 a 59, 90, 91, 93 a 96, 98, 100, 102, 104 a 110, 112 a 115, 118 a 121, 130, 131, 142 a 146, 148 a 152, 154 a 157, 159, 160, 162 a 174, 188 a 196, 204 a 206, 208 a 218, 220, 221, 223 a 225, 227 a 229, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 241, 244, 245, 246, 247, 248, 250, 255, 256, 259, 260, 261, 263, 264, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del pepino anteriormente mencionado. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 1 día, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de esporas de hongos de antracnosis de pepino (*Colletotrichum lagenarium*). Después de una inoculación, las plantas se colocaron en primer lugar a 23 °C en una alta humedad durante 1 día y después se cultivaron en un invernadero de 24 °C durante el día y 20 °C durante la noche durante 6 días, y se observó un área de lesión. Como resultado, cada una de las áreas de lesión en plantas tratadas con los presentes Compuestos 2, 3, 47, 48, 56 a 59, 90, 91, 93 a 96, 98, 100, 102, 104 a 110, 112 a 115, 118 a 121, 130, 131, 142 a 146, 148 a 152, 154 a 157, 159, 160, 162 a 174, 188 a 196, 204 a 206, 208 a 218, 220, 221, 223 a 225, 227 a 229, 231, 232, 233, 234, 235, 236, 238, 241, 244, 245, 246, 247, 248, 250, 255, 256, 259, 260, 261, 263, 264, 265, 267, 272, 274, 275, 276, 277, 281, 284 y 285 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 18

65 Las diluciones del fármaco de ensayo a usarse en este Ejemplo de prueba se prepararon como sigue a continuación: cada uno de los presentes compuestos 9, 11, 22, 50, 53, 59, 68, 77, 87, 112, 129, 154, 206, 209 y 210 se prepararon

para una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación mencionados anteriormente y las formulaciones se diluyeron con un agua de intercambio iónico de modo que la concentración del principio activo se fijó en 500 ppm.

5 El pepino (*Sagami-hanjiro-fushinari*) se cultivó en una copa de polietileno hasta que se desarrolló la primera hoja verdadera. Treinta (30) cabezas de áfido de algodón (*Aphis gossypii*) (incluyendo los adultos y las larvas) se liberaron sobre las hojas de la col y al día siguiente, se pulverizaron 120 ml de las diluciones de fármaco de ensayo anteriormente mencionadas. Después de 6 días, se contó el número de insectos supervivientes y se calculó el valor de control mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Valor de Control (\%)} = \{1 - (\text{CbXTai}) / (\text{CaixTb})\} \times 100$$

10

en la que los símbolos en la fórmula, representan las siguientes descripciones.

15 Cb: Número de insectos antes del tratamiento en el área no tratada;
 Cai: Número de insectos en el momento de la observación en el área no tratada;
 Tb: Número de insectos antes del tratamiento en el área tratada;
 Tai: Número de insectos en el momento de la observación en el área tratada;
 Como resultado, los presentes Compuestos 9, 11, 22, 50, 53, 59, 68, 77, 87, 112, 129, 154, 206, 209 y 210 mostraron el 90 % o más como el valor de control.

20

Ejemplo de prueba 19

25 Las diluciones del fármaco de ensayo que se usaron en este Ejemplo de prueba ensayo se prepararon como sigue a continuación: cada uno de los presentes compuestos 9, 146 y 209 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y las formulaciones se diluyeron con un agua de intercambio iónico de modo que la concentración del principio activo se fijó en 500 ppm. Se añadieron las soluciones de fármaco anteriormente mencionadas, 0,7 ml a un agua de intercambio iónico de 100 ml de modo que la concentración del principio activo se fijó en 3,5 ppm. Veinte (20) larvas del último instar del mosquito de la casa común (*Culex pipiens pallens*) se liberaron en las diluciones y después de 8 días, se contó el número de insectos muertos.

30

La mortalidad de los insectos se calculó mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{Número de muertes de insectos} / \text{Número de insectos de prueba}) \times 100$$

35 Como resultado, los presentes Compuestos 9, 146 y 209 mostraron el 100 % como la mortalidad de los insectos.

Ejemplo de prueba 20

40 Las diluciones del fármaco de ensayo a usarse en este Ejemplo de prueba se prepararon como sigue a continuación: cada uno de los presentes compuestos 9, 13, 16, 31, 44, 50, 90, 143 y 210 se prepararon para una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación mencionados anteriormente y las formulaciones se diluyeron con un agua de intercambio iónico de modo que la concentración del principio activo se fijó en 500 ppm. La col (bola verde) se plantó en una copa de polietileno y se cultivó hasta que se desarrolló la tercera hoja verdadera o la cuarta hoja verdadera. A la col se extendió las diluciones de ensayo antes mencionadas en una relación de 20 ml/copa.
 45 Después de que se secan las diluciones de fármaco, a una copa de polietileno (diámetro 5,5 cm) cubierta con un papel de filtro en el fondo, se colocó el repollo cortado de la raíz y cinco cabezas de polilla de la col (*Plutella xylostella*) en los tres estadios larvales se liberaron en la copa y la copa se cubrió con la tapa. La copa se mantuvo a 25 °C y después de 5 días, se contó el número de insectos supervivientes y se calculó la mortalidad de insectos mediante la siguiente ecuación.

50

$$\text{Mortalidad de los insectos (\%)} = (\text{Número de muertes de insectos} / \text{Número de insectos de prueba}) \times 100$$

Como resultado, los experimentos tratados con los presentes compuestos 9, 13, 16, 31, 44, 50, 90, 143 y 210 mostraron un 80 % como mortalidad de insectos.

55

Ejemplo de Prueba Comparativo

Una maceta de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo las semillas de trigo (cv; Shirogane) se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante 9 días. Un compuesto de control, 1-{2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración predeterminada (50 ppm). Las diluciones se pulverizaron sobre las partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del trigo mencionado anteriormente. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después, se cultivaron a 20 °C en iluminación durante 5 días. Las esporas de los hongos de la rustina del trigo (*Puccinia*

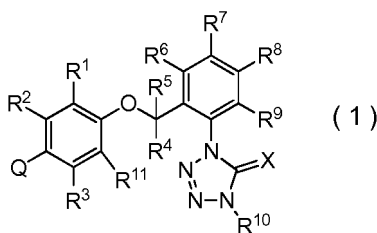
60

recondita) se inoculó por rocío. Después de la inoculación, las plantas se colocaron en un estado oscuro y húmedo a 23 °C durante 1 día y después se cultivaron a 20 °C en bajo iluminación durante 8 días y se observó un área de lesión. Como resultado, el área de lesión en plantas tratadas con el compuesto de control, 1-{2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona mostró un 70 % o más en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

5

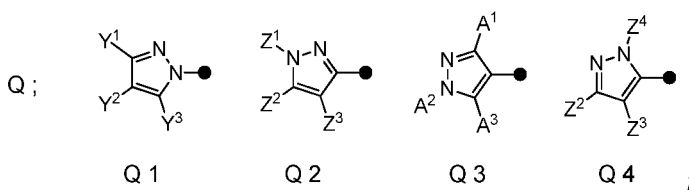
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (1):



[en la que

Q representa un grupo seleccionado entre el siguiente grupo: Q1, Q2, Q3 o Q4:



R¹, R², R³ y R¹¹ representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6, un grupo haloalquino C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo alquilo C1-C6, que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;

R⁴ y R⁵ representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3; R⁶ representa un grupo alquilo C1-C4, un átomo de halógeno, un grupo alcoxi C1-C4, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo haloalquilo C1-C4, un grupo alqueno C2-C4 o un grupo haloalqueno C2-C4;

R⁷, R⁸ y R⁹ representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3 o un grupo alcoxi C1-C3;

R¹⁰ representa un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3, un grupo haloalqueno C2-C3, un grupo alquino C2-C3, un grupo haloalquino C2-C3, un grupo cicloalquilo C3-C5 o un grupo halocicloalquilo C3-C5;

X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

A¹ y A³ representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo alqueno C2-C6, un grupo haloalqueno C2-C6, un grupo alquino C2-C6, un grupo haloalquino C2-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquiltio C1-C6, un grupo haloalquiltio C1-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo pentafluorosulfanilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo alquilo C1-C6, que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;

A², Z¹ y Z⁴ representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un grupo amino, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquino C3-C6, un grupo haloalquino C3-C6, un grupo alquilsulfino C1-C6, un grupo haloalquilsulfino C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo cicloalquilsulfonilo C3-C6, un grupo halocicloalquilsulfonilo C3-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo haloalquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo alquilaminocarbonilo C2-C8, un grupo cicloalquilmetilo C4-C7, un grupo alquilo C1-C6, que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ o un grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹;

Y¹, Y², Y³, Z² y Z³ representan independientemente entre sí un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo amino, un grupo hidroxilo, un grupo tiol, un grupo aldehído, un grupo

un grupo halocicloalquilo C3-C6;

Y³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4.

8. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3 o 6,

5

en el que

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquilo C3-C6, un grupo haloalquilo C3-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo haloalquilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7;

10

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo haloalcoxi C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6; como alternativa,

Z¹ y Z² pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono o el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco o seis miembros; y

15

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4.

9. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6 o 7,

en el que

20

Y¹ e Y² se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y¹ e Y² están unidos para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros;

Y² e Y³ se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y² e Y³ están unidos para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros; cuando cada uno de Y¹, Y² e Y³ no forman el anillo saturado de cinco o seis miembros,

25

Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo ciclopropilo;

Y² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo alcoxi C1-C3; e

30

Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

10. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3 o 6,

en el que

35

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un grupo alquinoxilo C3-C6, un grupo alquiltio C1-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C6; y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C4 o un grupo haloalquilo C1-C4.

40

11. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3 o 6,

en el que

45

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo ciano, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo 2-propinilo, un grupo metiltio, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo metilo.

12. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 6 u 8,

50

en el que

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3; y

55

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo.

13. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 6 o 7,

en el que

60

Y¹ e Y² se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combina junto con los átomos de carbono a los que están unidos para formar un anillo de seis miembros;

Y² e Y³ se conectan entre sí para representar -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, que se combina junto con los átomos de carbono a los que están unidos para formar un anillo de seis miembros;

cuando cada uno de Y¹, Y² e Y³ no forman el anillo saturado de seis miembros,

65

Y¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3; Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo alcoxi C1-C3; y

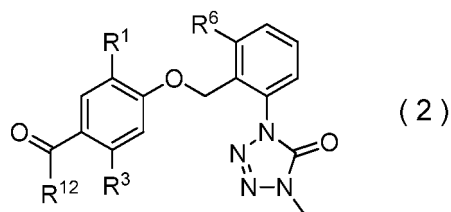
Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

14. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13,

en el que

- 5 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;
 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; y
 R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi o un grupo etoxi.

10 15. Un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (2):



[en la que

- 15 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo o un grupo ciclopropilo;
 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;
 R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metoxi o un grupo etoxi; y
 20 R¹² representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C1-C6].

16. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 15,

en el que

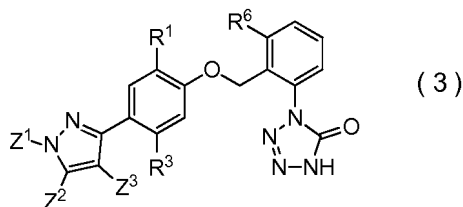
- 25 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro o un átomo de bromo;
 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;
 R⁶ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo metoxi; y
 30 R¹² representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo.

17. Un agente para controlar plagas que comprende el compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16.

35 18. Un método para controlar plagas que comprende aplicar a una planta o al suelo una cantidad eficaz del compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16.

19. Uso del compuesto de tetrazolinona según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 para controlar plagas en plantas o en el suelo.

40 20. Un compuesto de tetrazolinona representado por una fórmula (3):



[en la que

- 45 R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;
 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;
 50 R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2;
 Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;
 Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C2, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2, un átomo de halógeno o un grupo ciano; y

Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano].

21. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 20,

5 en el que

R¹ representa un grupo metilo;

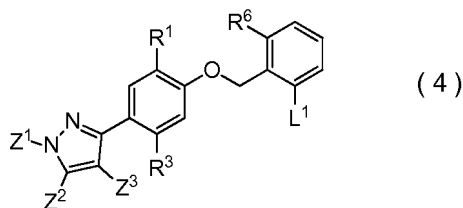
R³ representa un átomo de hidrógeno;

R⁶ representa un grupo alquilo C1-C2;

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;

10 Z² representa un grupo alcoxi C1-C2 o un átomo de halógeno; Z³ representa un grupo alquilo C1-C3.

22. Un compuesto de pirazol representada por una fórmula (4):



15

[en la que

R¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;

20 R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R⁶ representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo alcoxi C1-C2;

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;

Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alcoxi C1-C2, un grupo alquilo C1-C3, un grupo alquiltio C1-C2, un átomo de halógeno o un grupo ciano;

25 Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un átomo de halógeno o un grupo ciano; y

L¹ representa un grupo nitro, un grupo amino, un grupo isocianato, un grupo carboxilo, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un átomo de halógeno, un grupo halocarbonilo, NSO, C(O)N₃, C(O)NH₂, C(O)NHCl, C(O)NHBr o C(O)NHOH].

30 23. El compuesto de pirazol de acuerdo con la reivindicación 22,

en el que

R¹ representa un grupo metilo;

R³ representa un átomo de hidrógeno;

35 R⁶ representa un grupo alquilo C1-C2;

Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3;

Z² representa un grupo alcoxi C1-C2 o un átomo de halógeno;

Z³ representa un grupo alquilo C1-C3; y

L¹ representa un grupo nitro, un grupo amino o un grupo isocianato.

40