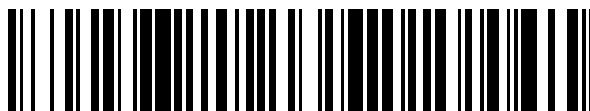


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 631 679**

51 Int. Cl.:

C07D 403/12 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

C07D 257/04 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **27.09.2013** **PCT/JP2013/077009**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.04.2014** **WO14051161**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **27.09.2013** **E 13779397 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.05.2017** **EP 2900654**

54 Título: **Compuestos de tetrazolinona y su uso como pesticidas**

30 Prioridad:

28.09.2012 JP 2012216039

25.12.2012 JP 2012280708

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
04.09.2017

73 Titular/es:

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)

27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku
Tokyo 1048260, JP

72 Inventor/es:

ARIMORI, SADAYUKI y
SHIODA, TAKAYUKI

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 631 679 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 su uso como pesticidas

- 5 Esta solicitud reivindica prioridad y el beneficio de la Solicitud de Patente Japonesa n.º 2012-216039 presentada el 28 de 2012, 2012-280708 presentada el 25 de diciembre de 2012.

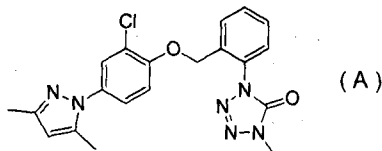
Campo técnico

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

Técnica antecedente

- 15 Hasta ahora, varios fármacos para controlar plagas se han desarrollado ampliamente y proporcionan en la práctica el uso, pero en algunos casos, estos fármacos pueden no ejercer suficiente eficacia.

Además, como compuestos que tienen un anillo de tetrazolinona, 1-{2-[2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona representado por la siguiente fórmula (A):



han sido conocido (véase el Documento de Patente 1).

LISTA DE CITAS

DOCUMENTO DE PATENTE

Documento de Patente 1: folleto WO 1999/46246

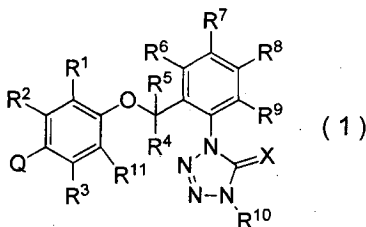
Sumario de la invención

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

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 (1) tiene una excelente eficacia para controlar plagas, que, por lo tanto, ha completado la presente invención.

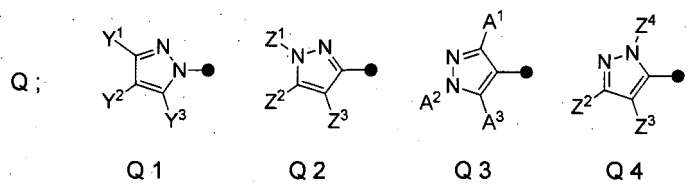
Específicamente, la presente invención incluye los siguientes [1] a [18].

[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 pentafluorosulfonilo, 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquino C2-C4, un grupo haloalquino C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo alquilsulfino C1-C4, un grupo alquilsulfonilo C1-C4, un grupo alquilaminosulfonilo C1-C4, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C4, un grupo haloalquilamino C1-C6, un grupo haloalquilamino C1-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

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 pentafluorosulfonilo, 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 C2-C8, un grupo pentafluorosulfonilo, un grupo trialquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcocarbonilo C2-C6, un grupo aminocarbonilo, 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; 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, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más

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

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, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más 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

Z¹ y Z² pueden combinarse cada una con la otra junto con el átomo de carbono o el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, dicho 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 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, dicho 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 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 alquilio C1-C4 o un grupo haloalquilio 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquinilo C2-C4, un grupo haloalquinilo C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquilio C1-C4, un grupo haloalquilio C1-C4 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

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 cada una con la otra 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 cada uno con el otro para representar -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 seis miembros;

Y² e Y³ se conectan cada uno con el otro para representar -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 seis miembros;

cuando cada uno de Y^1 , Y^2 e Y^3 no forman el anillo saturado de seis miembros,

Y^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo ciclopropilo;

Y^2 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo ciano o un grupo alcoxi C1-C3; y

Y^3 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

Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6;

Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo ciano, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo alquiltio C1-C6; y

Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4.

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

Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3;

Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo metiltio, un grupo ciano, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3; y

Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo metilo.

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

Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3;

Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metoxi, un grupo metiltio, un grupo trifluorometilo, un grupo ciano o un grupo alquilo C1-C3; y

Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo.

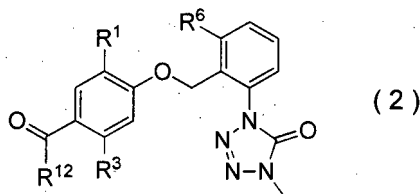
[13] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [12], en el que

R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;

R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; y

R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo etinilo, un grupo difluorometoxi o un grupo metiltio.

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



[en la que

R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo o un grupo ciclopropilo;

R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo difluorometoxi, un grupo etinilo o un grupo metiltio; y

R^{12} representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C1-C6].

[15] El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con [14], en el 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 ciclopropilo; y

R^{12} representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo.

[16] Un agente para controlar plagas que comprende el compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [15].

[17] Un método para controlar plagas que comprende aplicar una cantidad eficaz del compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [15] para planta o suelo.

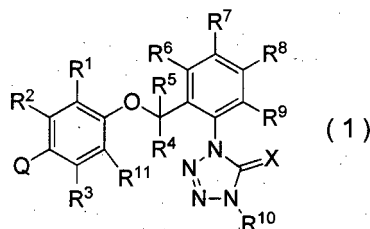
[18] Uso del compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de [1] a [15] para controlar las plagas.

La presente invención puede controlar plagas.

Descripción de las realizaciones

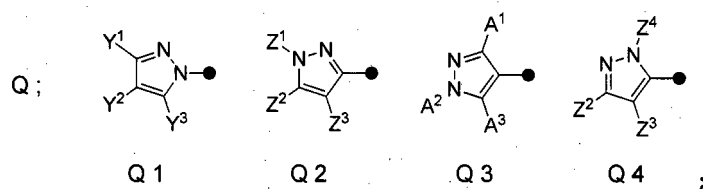
El compuesto de la presente invención (en lo sucesivo en el presente documento, denominado algunas veces como "el presente compuesto") es un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (1):

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 pentafluorosulfonilo, 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquino C2-C4, un grupo haloalquino C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo alquilsulfino C1-C4, un grupo alquilsulfonilo C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4, un grupo haloalquilsulfino C1-C4, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C4, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo haloalquilamino C1-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

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 pentafluorosulfonilo, 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 alcoxycarbonilo 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 representa 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 alquino C3-C6, un grupo haloalquino C3-C6, un grupo alqueno C3-C6, un grupo haloalqueno C3-C6, un grupo alquino C3-C6, un grupo haloalquino C3-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquilsulfinilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfinilo C1-C6, un grupo alquilsulfonilo C1-C6, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C6, un grupo alquilaminosulfonilo C2-C8, un grupo pentafluorosulfonilo, un grupo alquilsililo C3-C9, un grupo alquilcarbonilo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo aminocarbonilo, 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; 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, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más 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

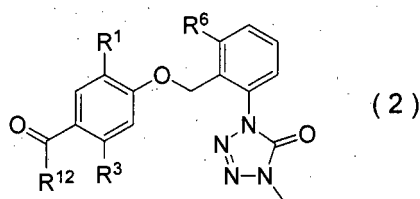
Y² e Y³ pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de nitrógeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹; o

Z¹ y Z² pueden combinarse cada una con la otra junto con el átomo de carbono o el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, dicho 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 sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹; o

Z² y Z³ pueden combinarse cada una con la otra junto con el átomo de carbono o el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, dicho 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 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, 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 ciclopropilo, un grupo difluorometoxi, un grupo etinilo o un grupo metiltio; y

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

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

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.

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.

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.

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.

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 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.

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.

La expresión "grupo haloalquilo C1-C3" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilo C1-C3 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e 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.

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.

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.

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.

La expresión "grupo cicloalquilmetilo C4-C7" representa un grupo metilo que tiene un alquilo cíclico de cuatro a siete átomos de carbono, y el grupo alquilo cíclico además, puede contener opcionalmente un grupo o grupos alquilo y el número de átomos de carbono del grupo cicloalquilmetilo 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.

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.

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.

La expresión "grupo halocicloalquilo C3-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo cicloalquilo C3-C4 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo un grupo 2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilo, 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 y un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclobutilo. 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 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-propenilo, un grupo isopropenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 1-metil-1-propenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-metil-1-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1,3-butadienilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 1-etil-2-propenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 1-metil-1-butenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-3-butenilo, un grupo 3-metil-1-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-2-propenilo, un grupo 1,1-dimetil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, un grupo 3-metil-2-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-1-propenilo, un grupo 2-metil-3-butenilo, un grupo 3-metil-3-butenilo, un grupo 1,3-pentadienilo, un grupo 1-vinil-2-propenilo, un grupo 1-hexenilo y un grupo 5-hexenilo.

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-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 1-clorometilvinilo, un grupo 2-bromo-1-metilvinilo, un grupo 1-trifluorometilvinilo, un grupo 3,3,3-tricloro-1-propenilo, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propenilo, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propenilo, un grupo 1-trifluorometil-2,2-difluorovinilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propenilo, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-butenilo, un grupo 1-bromometil-2-propenilo, 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-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propenilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-2-metil-1-propenilo, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-metil-1-propenilo, un grupo 3,4,4-trifluoro-1,3-butadienilo, un grupo 3,4-dibromo-1-pentenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-butenilo, un grupo 3,3,4,4,5,5-heptafluoro-1-pentenilo, un grupo 5,5-difluoro-4-pentenilo, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-pentenilo, 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-pentadienilo, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexenilo, un grupo 3,4,4,5,5,5-hexafluoro-3-trifluorometil-1-pentenilo, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo. 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 alqueno C3-C6" representa un grupo alqueno, lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-etil-2-propenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-3-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-2-propenilo, un grupo 1,1-dimetil-2-propenilo, 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-propenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo y un grupo 5-hexenilo.

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-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propenilo, un grupo 1-bromometil-2-propenilo, 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-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propenilo, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 3,4-dibromo-1-pentenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-butenilo, un grupo 5,5-difluoro-4-pentenilo, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-pentenilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-3-metil-2-butenilo, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadienilo, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexenilo, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo. 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 alqueno C2-C3" incluye, por ejemplo, un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo isopropenilo y un grupo 2-propenilo.

Una expresión "grupo haloalqueno C2-C3" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alqueno C2-C3 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-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 1-clorometilvinilo, un grupo 2-bromo-1-metilvinilo, un grupo 1-trifluorometilvinilo, un grupo 3,3,3-tricloro-1-propenilo, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propenilo, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propenilo, un grupo 1-trifluorometil-2,2-difluorovinilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo y un grupo 2,3,3-tricloro-2-propenilo.

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 etinilo, un grupo propargilo, un grupo 1-butina-3-ilo, un grupo 3-etil-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.

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 fluoroetinilo, un grupo 3-fluoro-2-propinilo, un grupo 3-cloro-2-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo, un grupo 3-cloro-1-propinilo, un grupo 5-cloro-4-pentinilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-1-propinilo, un grupo 3,3-difluoro-1-propinilo, 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.

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-propinilo, 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. 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 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-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo, 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.

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

La expresión "grupo alquino C2-C3" incluye, por ejemplo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo y un grupo 2-propinilo.

La expresión "grupo alquino C2-C4" incluye, por ejemplo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo y un grupo 2-butinilo.

La expresión "grupo haloalquino C2-C4" incluye, por ejemplo, un grupo 3,3,3-trifluoropropinilo, un grupo 3,3-difluoropropinilo, un grupo 3,3,3-trifluorobutinilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinilo y un grupo 3,3-difluoro-butinilo.

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

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.

5 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.

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

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

15 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, un grupo nonayodobutoxi 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 haloalcoxi C1-C2" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alcoxi C1-C2 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 y un grupo 2-cloro-2,2-difluoroetoxi. 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-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 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 hexiltio, un grupo isohexiltio y un grupo sec-hexiltio.

10 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 nonaclorobutiltio, 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.

25 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.

30 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 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 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.

40 La expresión "grupo alqueniilo C3-C6" representa un grupo alqueniilo lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propeniilo, un grupo 2-buteniilo, un grupo 1-metil-2-propeniilo, un grupo 3-buteniilo, un grupo 2-metil-2-propeniilo, un grupo 2-penteniilo, un grupo 3-penteniilo, un grupo 4-penteniilo, un grupo 1-metil-3-buteniilo, un grupo 1,2-dimetil-2-propeniilo, un grupo 1,1-dimetil-2-propeniilo, un grupo 2-metil-2-buteniilo, un grupo 3-metil-2-buteniilo, un grupo 2-metil-3-buteniilo, un grupo 3-metil-3-buteniilo, un grupo 1-vinil-2-propeniilo y un grupo 5-hexeniilo.

45 La expresión "grupo haloalqueniilo C3-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alqueniilo C3-C6 lineal o ramificado está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo 3-cloro-2-propeniilo, un grupo 3-bromo-2-propeniilo, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propeniilo, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propeniilo, un grupo 2-cloro-2-propeniilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propeniilo, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propeniilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propeniilo, un grupo 3,3-dibromo-2-propeniilo, un grupo 3-fluoro-3-cloro-2-propeniilo, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-buteniilo, un grupo 1-bromometil-2-propeniilo, un grupo 3-cloro-2-buteniilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-buteniilo, un grupo 4-bromo-4,4-difluoro-2-buteniilo, un grupo 3-bromo-3-buteniilo, un grupo 3,4,4-trifluoro-3-buteniilo, un grupo 3,4,4-tribromo-3-buteniilo, un grupo 3-bromo-2-metil-2-propeniilo, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propeniilo, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-buteniilo, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-buteniilo, un grupo 5,5-difluoro-4-penteniilo, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-penteniilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-3-metil-2-buteniilo, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadieniilo, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexeniilo, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-penteniilo y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-penteniilo. 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.

60 La expresión "grupo alquiniilo C3-C6" representa un grupo alquiniilo lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo 2-propiniilo, un grupo 1-butina-3-ilo, un grupo 3-metil-1-butina-3-ilo, un grupo 2-butiniilo, un grupo 3-butiniilo, un grupo 2-pentiniilo, un grupo 3-pentiniilo, un grupo 4-pentiniilo y un grupo 5-hexiniilo.

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

3-cloro-2-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo, un grupo 5-cloro-4-pentinilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-3-butinilo, un grupo perfluoro-2-pentinilo, un grupo perfluoro-3-pentinilo, un grupo perfluoro-4-pentinilo y un grupo perfluoro-5-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.

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-propenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-metil-3-butenilo, un grupo 1,2-dimetil-2-propenilo, un grupo 1,1-dimetil-2-propenilo, 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-propenilo y un grupo 5-hexenilo.

La 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-propenilo, un grupo 3-bromo-2-propenilo, un grupo 3-bromo-3,3-difluoro-1-propenilo, un grupo 2,3,3,3-tetracloro-1-propenilo, un grupo 2-cloro-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 2,3,3-tricloro-2-propenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 3,3-dibromo-2-propenilo, un grupo 3-fluoro-3-cloro-2-propenilo, un grupo 4-bromo-3-cloro-3,4,4-trifluoro-1-butenilo, un grupo 1-bromometil-2-propenilo, 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-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-metil-2-propenilo, un grupo 3-cloro-4,4,4-trifluoro-2-butenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-metil-3-butenilo, un grupo 5,5-difluoro-4-pentenilo, un grupo 4,5,5-trifluoro-4-pentenilo, un grupo 4,4,4-trifluorometil-3-metil-2-butenilo, un grupo 3,5,5-trifluoro-2,4-pentadienilo, un grupo 4,4,5,5,6,6,6-heptafluoro-2-hexenilo, un grupo 4,5,5,5-tetrafluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo y un grupo 5-bromo-4,5,5-trifluoro-4-trifluorometil-2-pentenilo. 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 alquino C3-C6" representa un grupo alquino lineal o ramificado de tres a seis átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo propargilo, un grupo 1-butina-3-ilo, un grupo 3-metil-1-butina-3-ilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo y un grupo 5-hexinilo.

La expresión de "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-propinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo, un grupo 5-cloro-4-pentinilo, un grupo 4,4,4-trifluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-2-butinilo, un grupo perfluoro-3-butinilo, un grupo perfluoro-2-pentinilo, un grupo perfluoro-3-pentinilo, un grupo perfluoro-4-pentinilo y un grupo perfluoro-5-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.

La expresión "grupo alquilamino C1-C8" representa un grupo amino que tiene el grupo alquilo C1-C8 lineal o ramificado, en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno del grupo alquilo, están sustituidos con el grupo alquilo C1-C4 lineal y/o ramificado, que pueden ser el mismo o diferente entre sí, e incluye, por ejemplo, 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 alquilamino C1-C6" representa un grupo amino que contiene un grupo alquilo C1-C6 lineal o ramificado e incluye, por ejemplo, un grupo N-metilamino, un grupo N-etilamino, un grupo N-propilamino, un grupo N-isopropilamino, un grupo N,N-dimetilamino, un grupo N,N-dietilamino, un grupo N-etil-N-metilamino, un grupo N-butilamino, un grupo N-pentilamino, un grupo N-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 N-trifluoroetilamino, un grupo N,N-di-trifluoroetilamino, un grupo N,N-di-tricloroetilamino y un grupo N-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 haloalquilamino C1-C6" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilamino C1-C6 está sustituido con un átomo de halógeno, e incluye, por ejemplo, un grupo N-trifluoroetilamino, un grupo N,N-di-trifluoroetilamino, un grupo N,N-di-tricloroetilamino y un grupo N-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 alcoxicarbonilo C2-C6" representa un grupo alcoxicarbonilo 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 que tiene el grupo alquilamino C1-C7 lineal o ramificado, en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno del grupo alquilo, están sustituidos con el grupo alquilo C1-C4 lineal y/o ramificado, que pueden ser el mismo o diferente entre sí, e incluye, por ejemplo, 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 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 alquilsulfonilo C1-C4" representa un grupo alquilsulfonilo que tiene un grupo alquilo C1-C4 lineal o ramificado, e incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo propilsulfonilo y un grupo isopropilsulfonilo.

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 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 haloalquilsulfonilo C1-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilsulfonilo C1-C4 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 y un grupo 3,3,3-triyodopropilsulfonilo. 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 C2-C8" representa un grupo aminosulfonilo que tiene el grupo alquilamino C2-C8 lineal o ramificado, en el que uno o dos átomos de hidrógeno en el átomo de nitrógeno del grupo alquilo, están sustituidos con el grupo alquilo C1-C4 lineal y/o ramificado, que pueden ser el mismo o diferente entre sí, e incluye, por ejemplo, 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 haloalquilamino sulfonilo C2-C8" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilaminosulfonilo C1-C8 lineal o ramificado 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 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 alquilsulfonilo C1-C4" representa un grupo alquilsulfonilo lineal o ramificado de uno a cuatro átomos de carbono, e incluye, por ejemplo, un grupo metilsulfonilo, un grupo etilsulfonilo, un grupo propilsulfonilo, un grupo isopropilsulfonilo, un grupo butilsulfonilo, un grupo isobutilsulfonilo y un grupo sec-butilsulfonilo.

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 haloalquilsulfonilo C1-C4" representa un grupo en el que al menos un átomo de hidrógeno del grupo alquilsulfonilo C1-C4 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 y un grupo nonayodobutilsulfonilo. 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 alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P^{1a}" 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.

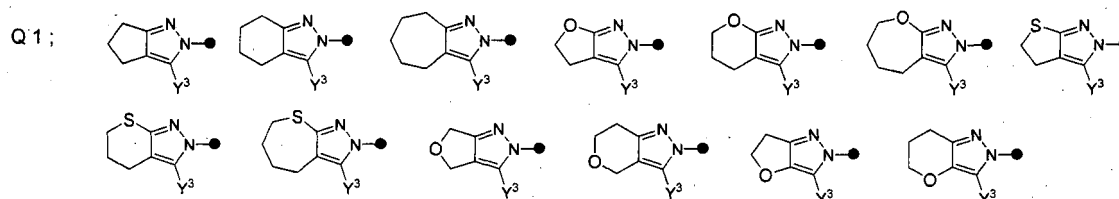
Ejemplos del grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ incluyen un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo difluorometilo, 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 *terc*-butoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 2-*terc*-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 etiltiometilo, un grupo 2-etiltioetilo, un grupo 3-etiltiopropilo, un grupo *terc*-butiltiometilo, un grupo 2-(*terc*-butiltio)-etilo, un grupo 3-(*terc*-butiltio)-propilo, un grupo trifluorometiltiometilo, 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.

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 seleccionados entre el Grupo P¹ pueden ser los mismos o diferentes entre sí.

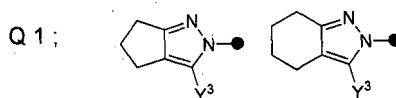
Ejemplos del grupo cicloalquilo C3-C6 que tiene opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P¹ incluyen un grupo 1-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilo, un grupo 1-cloro-2-fluorociclopropilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilo, un grupo 2,2-dibromociclopropilo, un grupo 2,2-difluoro-1-metilciclopropilo, un grupo 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-tetrafluorociclobutilo, 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, un grupo 4,4-difluorociclohexilo, a 1-ciclopropilciclopropilo, a 2-ciclopropilciclopropilo, un grupo 2,2-bis-ciclopropilciclopropilo, un grupo 2,3-bis-ciclopropilciclopropilo, un grupo 1-ciclopropilciclobutilo, un grupo 1-ciclobutilciclobutilo, un grupo 2-ciclopropilciclobutilo, un grupo 1-ciclopropilciclopentilo, un grupo 2-ciclopropilciclopentilo, 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-metoxiciclopentilo, un grupo 1-metoxiciclohexilo, un grupo 2-metoxiciclopropilo, un grupo 2-metoxiciclobutilo, un grupo 2-metoxiciclopentilo, un grupo 2-metoxiciclohexilo, un grupo 2-etoxiciclopropilo, un grupo 2-etoxiciclobutilo, un grupo 2-etoxiciclopentilo, un grupo 2-etoxiciclohexilo, un grupo 1-etoxiciclopropilo, un grupo 1-etoxiciclobutilo, un grupo 1-etoxiciclopentilo, un grupo 1-etoxiciclohexilo, un

grupo 1-isopropoxyciclopentilo, un grupo 1-isopropoxyciclobutilo, un grupo 1-isopropoxyciclopentilo, un grupo 1-isopropoxyciclohexilo, un grupo 1-trifluorometoxyciclopentilo, un grupo 2-trifluorometoxyciclopentilo, un grupo 1-difluorometoxyciclopentilo, un grupo 2-difluorometoxyciclopentilo, un grupo 1-(2,2-difluoroetoxi)-ciclopentilo, un grupo 2-(2,2-difluoroetoxi)-ciclopentilo, un grupo 1-metiltiociclopentilo, un grupo 1-etiltiociclopentilo, un grupo 2-metiltiociclopentilo, un grupo 2-etiltiociclopentilo, un grupo 1-trifluorometiltiociclopentilo, un grupo 2-trifluorometiltiociclopentilo, un grupo 1-cianociclopentilo, un grupo 2-cianociclopentilo y un grupo 2,2-dicianociclopentilo y similares.

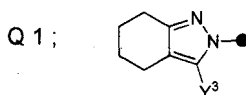
Y^1 e Y^2 pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P^1 como sustituyente. Ejemplos de Q1 incluyen las siguientes estructuras:



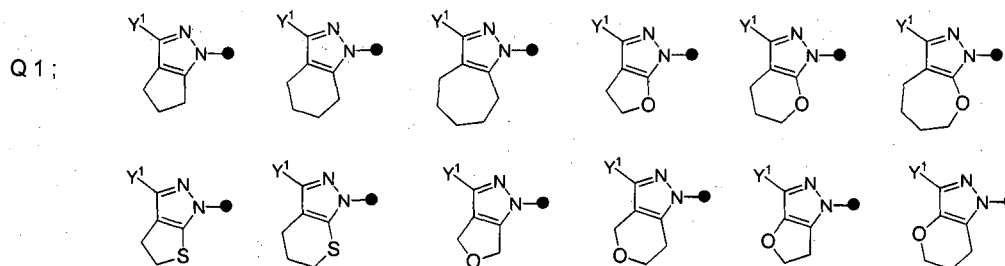
En términos de una conveniencia de producción, el Q1 preferido incluye las siguientes estructuras:



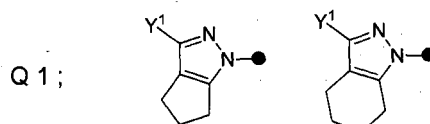
El Q1 más preferido incluye la siguiente estructura:



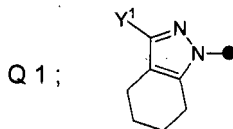
Y^2 e Y^3 pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P^1 como sustituyente. Ejemplos de Q1 incluyen las siguientes estructuras:



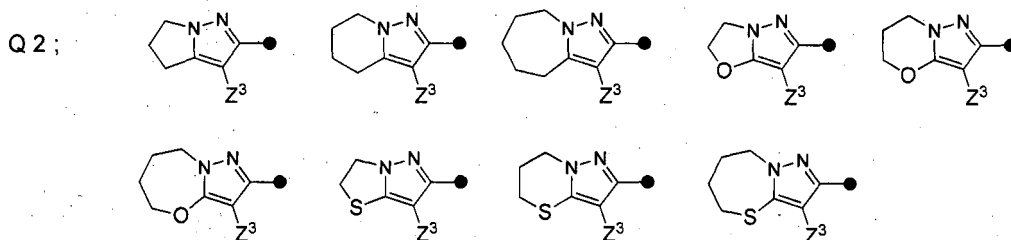
En términos de una conveniencia de producción, el Q1 preferido incluye las siguientes estructuras:



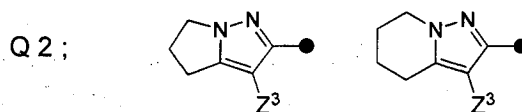
El Q1 más preferido incluye la siguiente estructura:



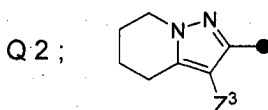
5 Z^1 y Z^2 pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco, seis o siete miembros, y el anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más átomos de oxígeno o átomos de azufre como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más grupos seleccionados entre el Grupo P^1 como sustituyente. Ejemplos de Q2 incluyen las siguientes



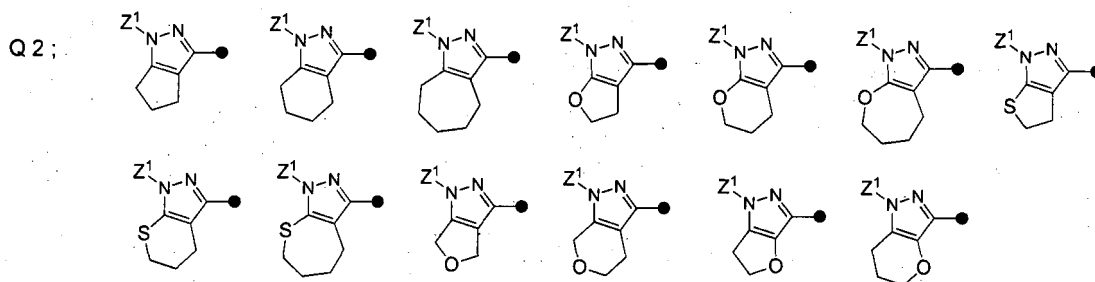
En términos de una conveniencia de producción, el Q2 preferido incluye las siguientes estructuras:



El Q2 más preferido incluye las siguientes estructuras:



25 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, átomos de azufre o átomos de nitrógeno como el átomo constituyente del anillo, y el anillo saturado puede tener opcionalmente uno o más sustituyentes seleccionados entre el Grupo P^1 como sustituyente. Ejemplos de Q2 incluyen las siguientes estructuras:



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

- 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-butinilo o un grupo 2-butinilo;
- 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;
- 5 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;
- 10 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;
- 15 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^4 representa un átomo de hidrógeno;
- 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;
- 20 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^{11} representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo etinilo o un grupo 1-propinilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo 3-fluoropropionilo, un grupo 3-cloropropionilo, un grupo 3-bromopropionilo, un grupo 3-yodopropionilo, un grupo 3,3-difluoropropionilo o un grupo 3,3,3-trifluoropropionilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo 2,2-difluoroetoxi, un grupo 2,2,2-trifluoroetoxi o un grupo pentafluoroetoxi;
- 25 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo metiltio o un grupo etiltio;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo trifluorometiltio, un grupo 2,2,2-trifluoroetiltio, un grupo 2,2,2-triclorometiltio o un grupo pentafluoroetiltio;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo o un grupo ciclopentilo;
- 30 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo 1-fluorociclopropilo, un grupo 1-clorociclopropilo, un grupo 1-bromociclopropilo, un grupo 2-fluorociclopropilo, un grupo 2-clorociclopropilo, un grupo 2-bromociclopropilo, un grupo 2,2-difluorociclopropilo, un grupo 2,2-diclorociclopropilo, un grupo 2,2-dibromociclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetrafluorociclopropilo, un grupo 2,2,3,3-tetraclorociclopropilo o un grupo 2,2,3,3-tetrabromociclopropilo;
- 35 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;
- 40 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;
- 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 R^6 representa un grupo ciano;
- 45 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 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 R^{10} representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo o un grupo 2,2-difluoroetilo;
- 50 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^{10} 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;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que A^1 y A^3 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;
- 55 un compuesto de la fórmula (1) en la que A^1 y A^3 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 A^1 y A^3 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 A^2 y Z^4 pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo alquilo C1-C6;
- 60 un compuesto de la fórmula (1) en la que A^2 y Z^4 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 A^2 y Z^4 pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo alquínilo C1-C6;
- 65 un compuesto de la fórmula (1) en la que A^2 y Z^4 pueden ser el mismo o diferente entre sí, y representan independientemente entre sí un grupo haloalquínilo C1-C6;

- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6 que puede sustituirse opcionalmente con un grupo seleccionado entre el Grupo P^1 ;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo alquilo C1-C6 que puede sustituirse opcionalmente con un grupo seleccionado entre el Grupo P^1 ;
- 5 un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno y X representa un átomo de oxígeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno y R^{10} representa un grupo metilo;
- 10 un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q1 o Q2;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q1, Q2 o Q4;
- 15 un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q1;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q2;
- 20 un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno y Q representa Q4;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un átomo de halógeno;
- 25 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo alquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo haloalquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo alquinilo C2-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo haloalquinilo C2-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo cicloalquilo C3-C5;
- 30 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo halocicloalquilo C3-C5;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo alcoxi C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un grupo haloalcoxi C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo cicloalquilo C3-C5;
- 35 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^1 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 R^3 representa un átomo de hidrógeno;
- 40 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un átomo de halógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un grupo alquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un grupo haloalquilo C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3;
- 45 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo etinilo o un grupo 1-propinilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo alquinilo C2-C3;
- 50 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo haloalquinilo C2-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo haloalcoxi C1-C4;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo alquiltio C1-C4;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo haloalquiltio C1-C4;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo cicloalquilo C3-C6;
- 55 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo halocicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4 o un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo haloalcoxi C1-C2, un grupo alquiltio C1-C2 o un grupo cicloalquilo C3-C4;
- 60 un compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R^1 representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo cicloalquilo C3-C5, $R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3, R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R^{10} representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 65

- [illegible]

grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo, R^{10} representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;

- [illegible]

- propinilo, un grupo haloalcoxi C1-C2, un grupo alquiltio C1-C2 o un grupo cicloalquilo C3-C4, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 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 grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, y X representa un átomo de oxígeno;
- 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;
- 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;
- 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;
- 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 C1-C3;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Y² representa un grupo alcoxi C1-C6;
- 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;
- 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 C1-C3, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6;
- 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 C1-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 isopropilo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo ciclopropilo;
- 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;
- 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;
- 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-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 Q representa Q1, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo cicloalquilo C3-C5, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3, R⁶ representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4 o un grupo cicloalquilo C3-C6, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo 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-C3, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, 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 Q representa Q1, R¹ representa un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo cicloalquilo C3-C5, R², R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo

[illegible]

[illegible]

[illegible]

[illegible]

- propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Y^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, Y^2 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 isopropilo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo ciclopropilo, e Y^3 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 Q representa Q1, R^1 representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Y^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, Y^2 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 isopropilo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo ciclopropilo, e Y^3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo, como alternativa Y^1 e Y^2 se conectan entre sí para representar $-CH_2-CH_2-CH_2-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y^1 e Y^2 se unen para formar un anillo de cinco o seis miembros, o Y^2 e Y^3 se conectan entre sí para representar $-CH_2-CH_2-CH_2-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y^2 e Y^3 se unen para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R^1 representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Y^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo trifluorometilo, Y^2 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 isopropilo, un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un grupo ciclopropilo, e Y^3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo haloalquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo alquinilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo haloalquinilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo cicloalquilmetilo C4-C7;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alquinilo C3-C6 o un grupo cicloalquilmetilo C4-C7;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo alquilo C1-C4, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alquinilo C3-C4 o un grupo ciclopropilmetilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butinilo o un grupo ciclopropilmetilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un átomo de halógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo haloalquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo alcoxi C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo haloalcoxi C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo alquinilo C2-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un grupo haloalquinilo C2-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 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 Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo ciclopropilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo o un grupo ciclopropilo;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un átomo de hidrógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un átomo de halógeno;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo alquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo haloalquilo C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo cicloalquilo C3-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo alcoxi C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo haloalcoxi C1-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo alquinilo C2-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un grupo haloalquinilo C2-C6;
- un compuesto de la fórmula (1) en la que Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo

hidrógeno, R³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R⁶ representa un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo difluorometoxi, un grupo trifluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo ciclopropilo, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo, un grupo isopropilo, un grupo difluorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 2-butilino un grupo ciclopropilmetilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo isopropilo o un grupo ciclopropilo, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo etilo;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, 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 cicloalquilo C3-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6, Y² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo alcoxi C1-C6, Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcoxi C1-C6, 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 halógeno o un grupo alquilo C1-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 cicloalquilo C3-C6, un grupo haloalcoxi C1-C4 o un grupo alquilo C2-6, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo cicloalquilo C3-C6, Y² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6, e Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alcoxi C1-C6, 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 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 cicloalquilo C3-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-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 o un grupo alquilo C1-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 cicloalquilo C3-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un grupo alquilo C1-C6 que tiene opcionalmente un átomo de halógeno o un átomo de halógeno, y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C6;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, 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 cicloalquilo C3-C6 o un grupo haloalcoxi C1-C4, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C6, Z² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3;

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 cicloalquilo C3-C6, X representa un átomo de oxígeno, A¹ representa un átomo de hidrógeno, A² representa un grupo alquilo C1-C6, y A³ representa 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 cicloalquilo C3-C6, X representa un átomo de oxígeno, Z² representa un grupo alquilo C1-C6, Z³ representa un átomo de hidrógeno, y Z⁴ representa un grupo alquilo C1-C6;

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R¹ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo, 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 ciclopropilo, un grupo difluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo etinilo, X representa un átomo de oxígeno o un átomo de azufre, Y¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo metilo, un grupo etilo 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 o un grupo ciclopropilo, 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 ciclopropilo, un grupo difluorometoxi, un grupo metiltio o un grupo etinilo, 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 o un grupo trifluorometilo, 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 cloro o un grupo metilo, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo ciclopropilo o un grupo difluorometoxi, X representa un átomo de oxígeno, Y¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, Y² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo o un grupo metoxi, e 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

[illegible]

Z¹ representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo isopropilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metiltio, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo;

ciano, y Z² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro 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, R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo ciclopropilo, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo trifluorometilo, un grupo metiltilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo;

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

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R¹ representa un grupo alquilo C1-C3, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹¹ representan un átomo de hidrógeno, R¹⁰ representa un grupo metilo, R⁶ representa un grupo difluorometoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo alquilo C1-C3, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6, un átomo de halógeno o un grupo ciano, 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 grupo metilo, 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 difluorometoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo metilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi o un átomo de cloro, y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo:

El compuesto en la fórmula (1) representa un grupo metilo, Q² representa un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q², R¹ representa un grupo metilo, 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 difluorometoxi, X representa un átomo de oxígeno, Z¹ representa un grupo metilo, Z² representa un átomo de hidrógeno, un grupo metilo, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un átomo de cloro o un grupo ciano, y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

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

átomo de halógeno, y Z^1 representa un grupo alquilo C_1-C_6 , un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q_2 , R^1 representa un grupo metilo, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^{10} representa un grupo metilo, R^6 representa un grupo metiltio, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo metilo, Z^2 representa un grupo etoxi o un átomo de cloro, y Z^3 representa un grupo metilo.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquinilo C2-C4, un grupo haloalquinilo C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4 o un grupo halocicloalquilo C3-C6, R¹⁰ representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, 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, 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, Y³ representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquinilo C2-C4, un grupo haloalquinilo C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4 o un grupo halocicloalquilo C3-C6, R¹⁰ 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 halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo alquiltio C1-C6, Z³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquinilo C2-C4, un

grupo haloalquinilo C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4 o un grupo halocicloalquilo C3-C6, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 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, Z^3 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, R^1 representa un grupo alquilo C1-C3, un átomo de hidrógeno, 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, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3, R^6 representa un grupo cicloalquilo C3-C6, un grupo alquinilo C2-C4, un grupo haloalquinilo C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4 o un grupo halocicloalquilo C3-C6, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6, Z^2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Z^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1, R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo etinilo, un grupo difluorometoxi o un grupo metiltio, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Y^1 e Y^2 se conectan entre sí para representar $-CH_2-CH_2-CH_2-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y^1 e Y^2 están unidos para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros, Y^2 e Y^3 se conectan entre sí para representar $-CH_2-CH_2-CH_2-$ o $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$, que se combinan junto con los átomos de carbono a los que Y^2 e Y^3 están unidos para formar un anillo de cinco miembros o seis miembros, cuando cada uno de Y^1 , Y^2 e Y^3 no forman el anillo saturado de cinco o seis miembros, Y^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo ciclopropilo, Y^2 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo alcoxi C1-C3, Y^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo etinilo, un grupo difluorometoxi o un grupo metiltio, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6, Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo alquiltio C1-C6, Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo etinilo, un grupo difluorometoxi o un grupo metiltio, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3, Z^2 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, Z^3 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, R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo etinilo, un grupo difluorometoxi o un grupo metiltio, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6 o un grupo haloalquilo C1-C6, Z^2 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Z^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo ciclopropilo, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6, Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo ciano, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo alquiltio C1-C6, Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4.

un compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo, R^2 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{11} representan un átomo de hidrógeno, R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo, R^6 representa un grupo ciclopropilo, R^{10} representa un grupo metilo, X representa un átomo de oxígeno, Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6, Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo ciano, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo alquiltio C1-C6, Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4, un grupo alcoxi C1-C6 y un grupo ciano.

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 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 ciclopropilo, 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 grupo ciclopropilo, 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 difluorometoxi, 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 grupo difluorometoxi, y R^{12} representa un grupo metilo o un grupo etilo.

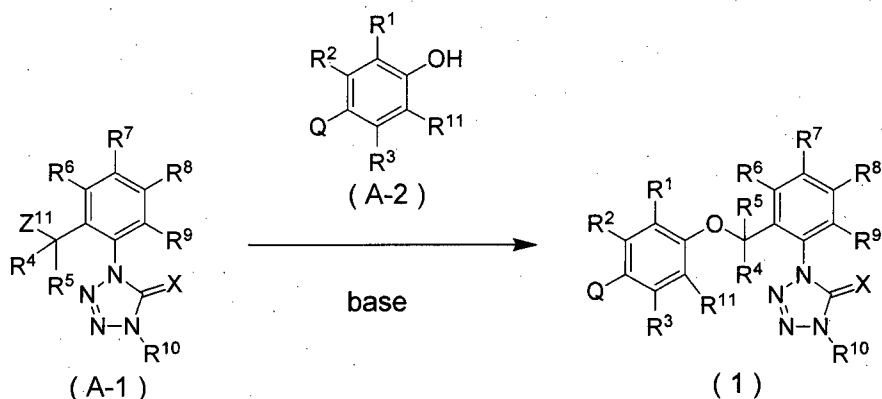
En el presente documento, cuando en una fórmula (1), R^4 y R^5 son diferentes entre sí, el presente compuesto de la fórmula (1) puede tener un átomo de carbono asimétrico en el mismo, y por lo tanto, puede incluir sustancias ópticamente activas y racematos, sin limitarse a los mismos.

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.

(Proceso A)

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



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X$ 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 metanosulfonilo, un grupo trifluorometanosulfonilo o un grupo p-toluenosulfonilo]

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, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 (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).

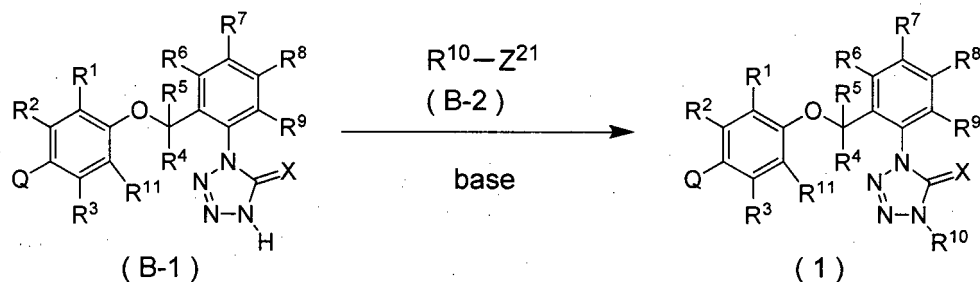
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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 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

$\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{Z}^{11}, \text{X}$ 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]

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.

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 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.

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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

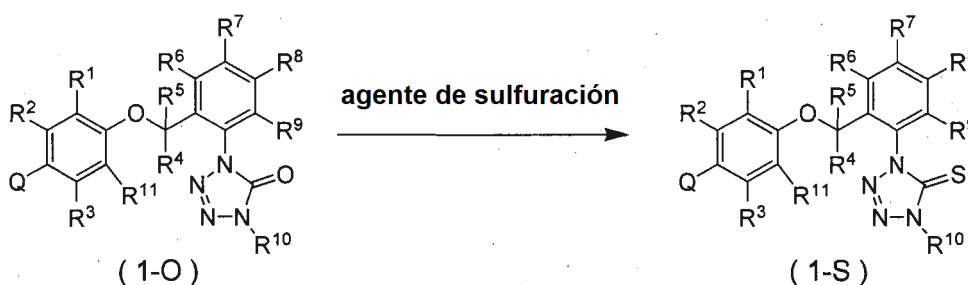
se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (B-1).

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.



[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.

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.

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).

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).

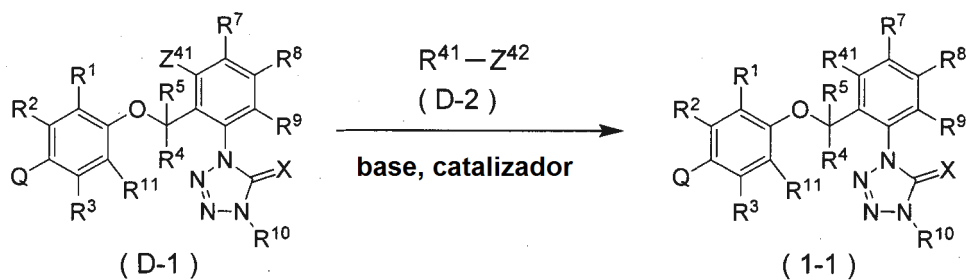
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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).

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.

(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.



[en la que

- 5 $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{X}$ y Q son los mismos como se han definido anteriormente, Z^{41} representa un átomo de cloro, un átomo de bromo, un átomo de yodo o un grupo trifluorometanosulfonilo, R^{41} representa un grupo cicloalquilo C3-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6, y Z^{42} representa un $\text{B}(\text{OH})_2$, un grupo alcoxiborilo o unas sales de trifluoroborato (BF_3K^+).

- 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; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

- 20 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 ($\text{R}^{41}-\text{I}$) o un compuesto de bromo ($\text{R}^{41}-\text{Br}$) 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_3K^+).

- 35 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'-triisopropilbifenil-2-il)fosfina y tris(dibencilidenoacetona)dipaladio y similares.

- 40 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 alcalinos, tales como fosfato de tripotasio; y alcóxidos de metal alcalinos, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

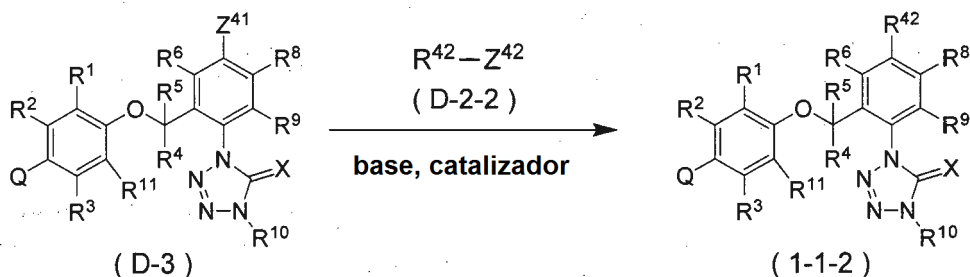
- 50 En la reacción, el Compuesto (D-2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares y el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,0001 a 1 relaciones molares, frente a 1 mol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

- 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 presente

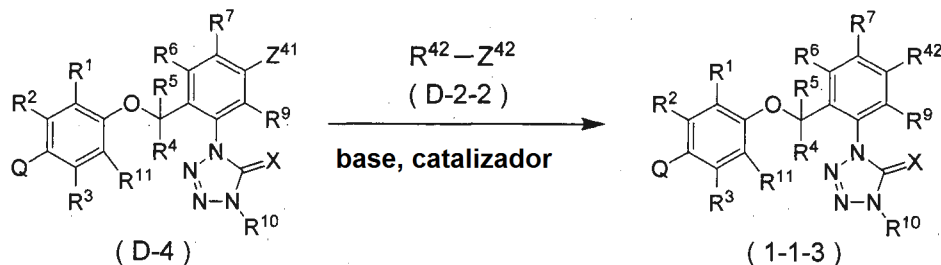
compuesto de la fórmula (1-1). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-1) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^7 representa R^{42} , 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 fórmula (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.



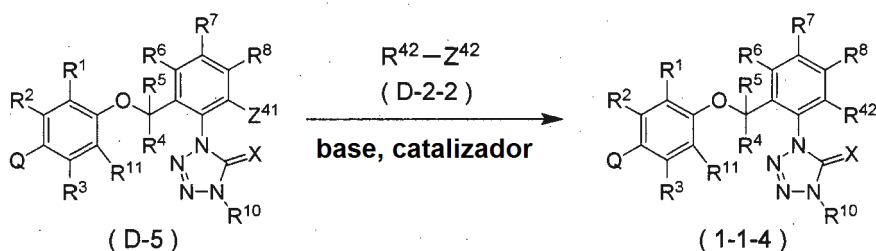
[en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, Q, Z^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han definido anteriormente, R^{42} representa un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alqueno C2-C3 o un grupo haloalqueno C2-C3]

De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-1) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^8 representa R^{42} , 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 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, R^{10}, R^{11}, X, Q, Z^{41}$ y Z^{42} 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 R^9 representa R^{42} , 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.



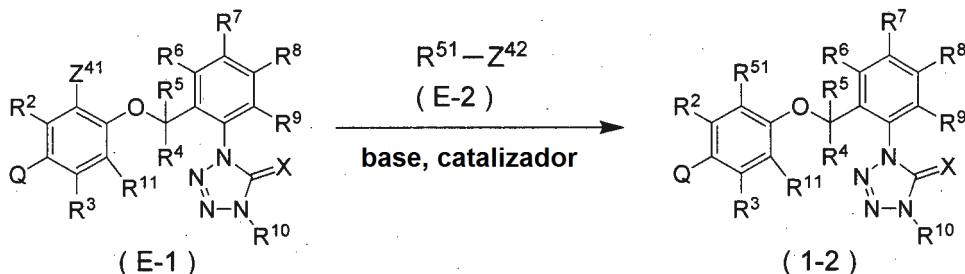
[en la que $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{R}^{42}, \text{X}, \text{Q}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han definido anteriormente]

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^6 representa R^{41} , y uno o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en R^7, R^8 y R^9 es R^{42} 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)

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 formula (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 $\text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{Z}^{41}, \text{Z}^{42}, \text{X}$ 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 alquenoilo C2-C6, un grupo haloalquenoilo 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.

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.

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 ($\text{R}^{51}\text{-I}$) o un compuesto de bromo ($\text{R}^{51}\text{-Br}$) 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 ($\text{BF}_3^- \text{K}^+$).

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)/díciclohexil(2',4',6'-triisopropilbifenil-2-il)fosfina y tris(dibencilidenoacetona)dipaladio y similares.

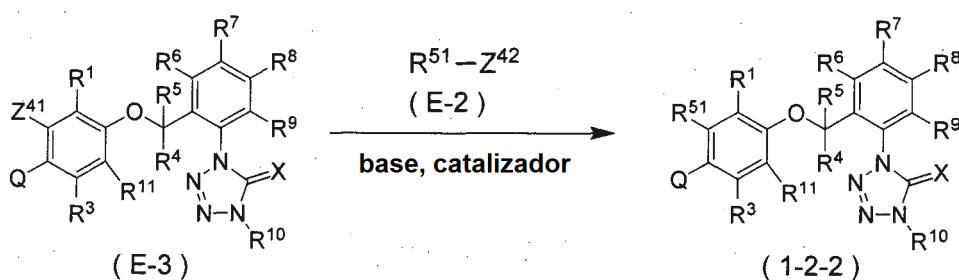
Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato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

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).

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.

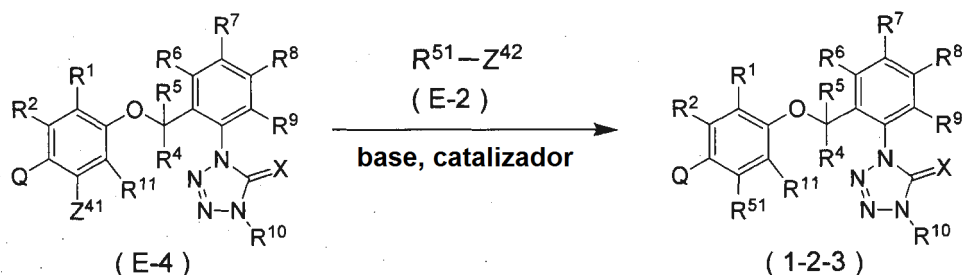
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-2). Además, el presente compuesto aislado puede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

De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-2) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^2 representa R^{51} , 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.



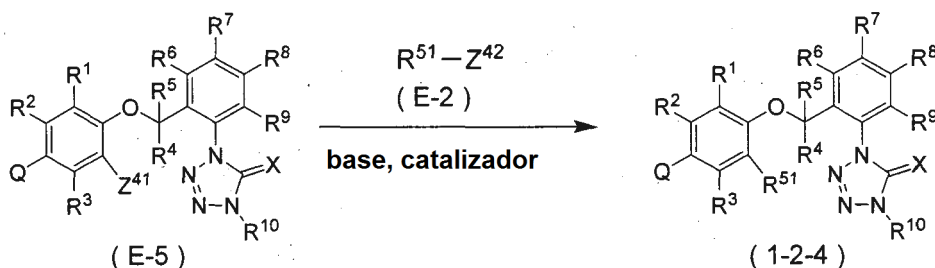
[en la que $\text{R}^1, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{R}^{51}, \text{X}, \text{Q}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han definido anteriormente]

De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-2) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^3 representa R^{51} , 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.



[en la que
 $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{R}^{51}, \text{X}, \text{Q}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han definido anteriormente]

De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-2) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que R^{11} representa R^{51} , 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.



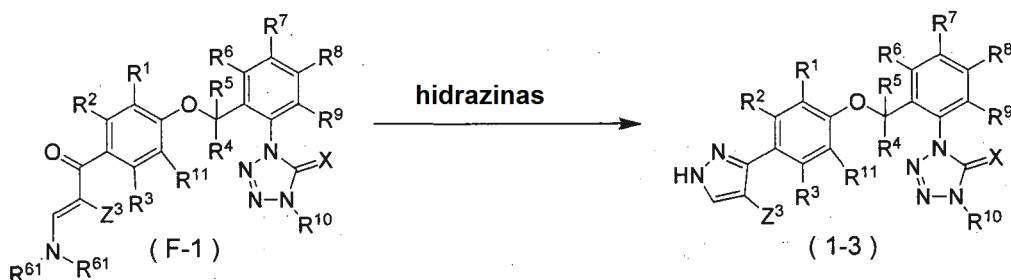
[en la que
 $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{51}, \text{X}, \text{Q}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han definido anteriormente]

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que dos o más sustituyentes seleccionados entre el grupo que consiste en $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3$ y R^{11} es R^{51} puede prepararse de acuerdo con el Proceso E anteriormente mencionado.

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)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q_2 , y Z^1 y Z^2 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.



[en la que
 $\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{X}$ y Z^3 son los mismos como se han definido anteriormente, y R^{61} representa un grupo metilo o un grupo etilo]

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; 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 hidrozina, hidrazina anhidro y similares.

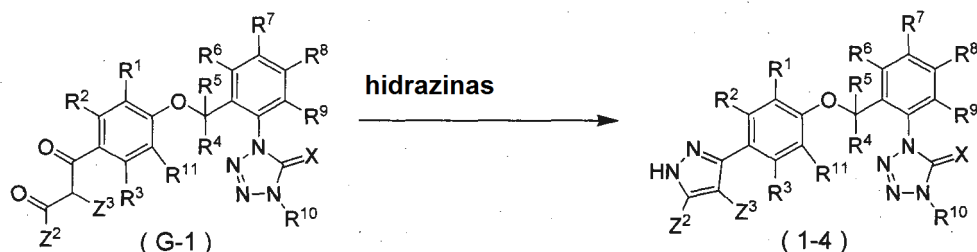
En la reacción, normalmente se usan hidrazinas dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (F-1).

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.

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 destilación, cromatografía y recristalización.

(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.



[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.

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 hidrozina, hidrazina anhidro y similares.

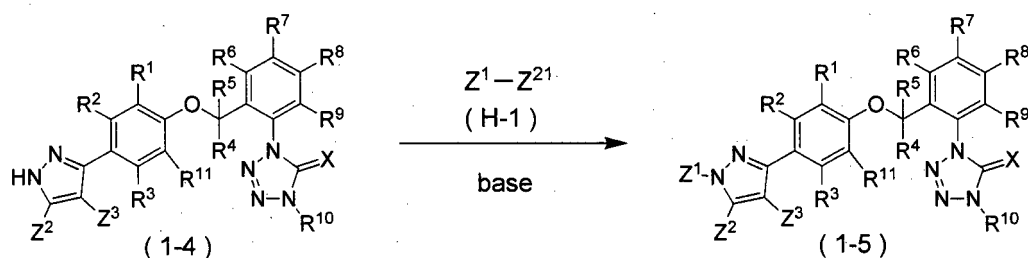
En la reacción, normalmente se usan hidrazinas dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (G-1).

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 (1-4). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso H)

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 formula (H-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (H-1)) en presencia de una base.



[en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Z^1, Z^2, Z^3, Z^{21}$ y X 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; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

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.

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 alcalinos, tales como *tert*-butóxido de sodio y *tert*-butóxido de potasio.

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).

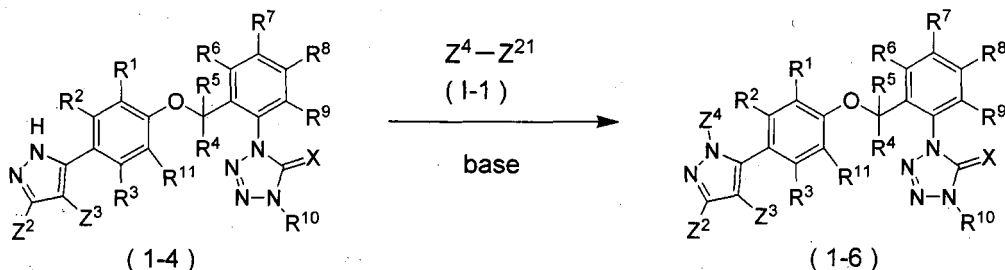
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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.

5 (Proceso I)

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.



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

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.

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.

40 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 alcalinos, tales como *tert*-butóxido de sodio y *tert*-butóxido de potasio.

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).

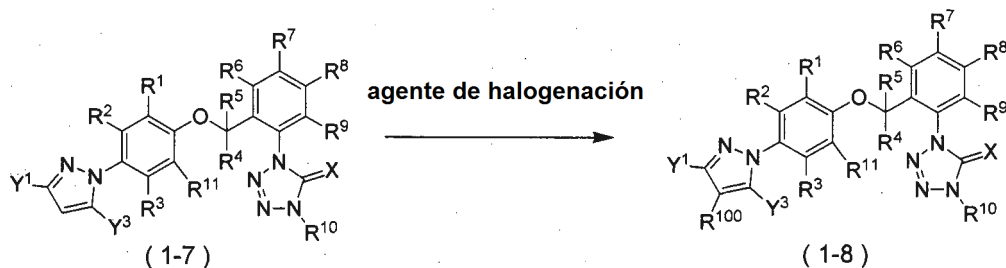
50 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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 presente compuesto de la fórmula (1-6). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por

cromatografía y recristalización.

(Proceso J)

- 5 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1 e Y^2 representa R^{100} , 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.



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

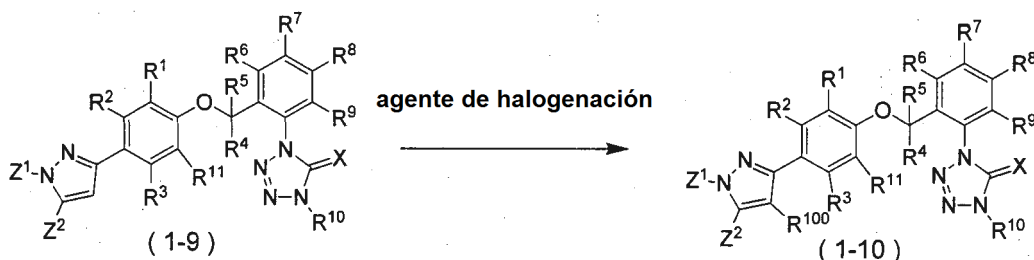
Ejemplos del agente de halogenación a usarse en la reacción incluyen N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, N-yodosuccinimida, cloro, bromo, yodo y cloruro de sulfurilo.

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.

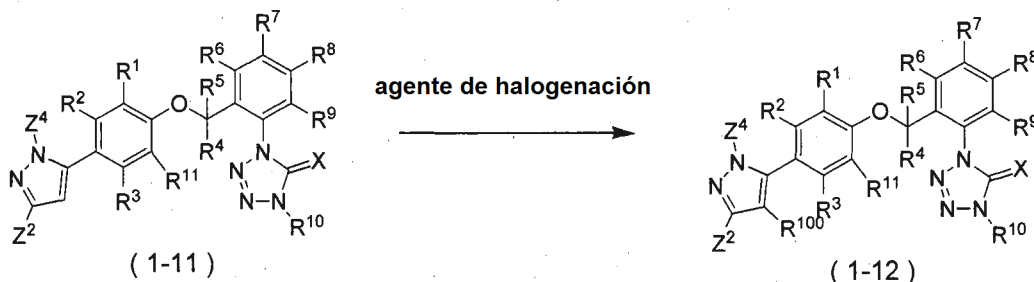
De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-8), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z^3 representa un R^{100} , es decir, el compuesto de una fórmula (1-10) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-10)), 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

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

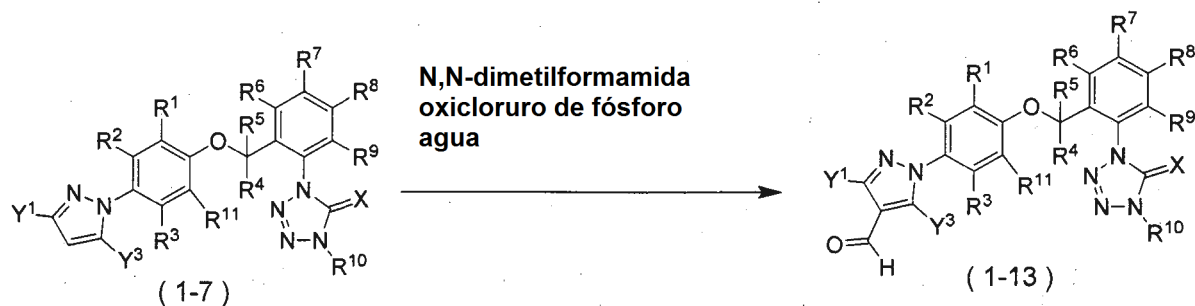
De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-8), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4 y Z^3 representa un R 100, es decir, el compuesto de una fórmula (1-12) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-12)), 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 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Z^2, Z^4, R^{100}$ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

(Proceso K)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q1 e Y^2 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)), 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 oxocloruro de fósforo, seguido de hacer reaccionar las mezclas resultantes con agua.



[en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Y^1, Y^3$ y X 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; 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-imidazolinona, 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.

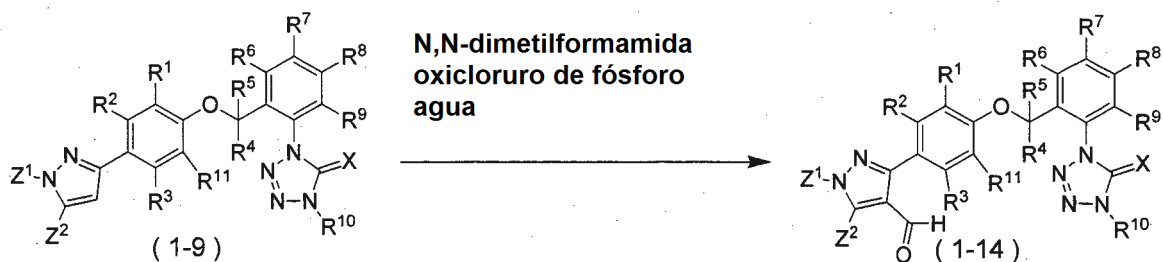
En la reacción, el agente de formilación se usa como una mezcla de 1 a 10 relaciones molares de N,N-dimetilformamida y de 1 a 10 relaciones molares de oxocloruro de fósforo, frente a 1 mol del Compuesto (1-7), y se usa agua dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto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

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, 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

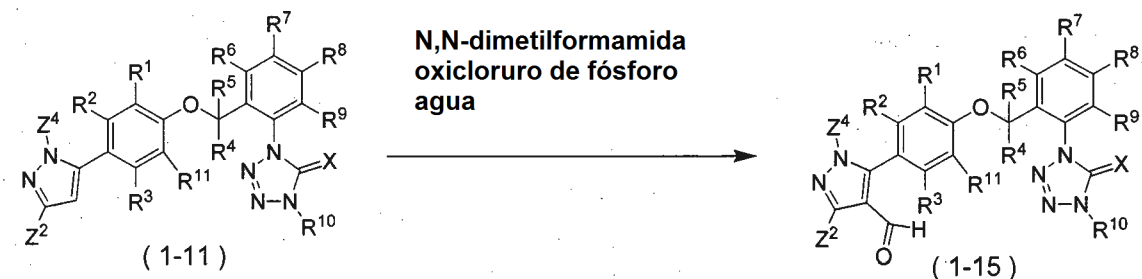
(por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-13). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

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 oxocloruro 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]

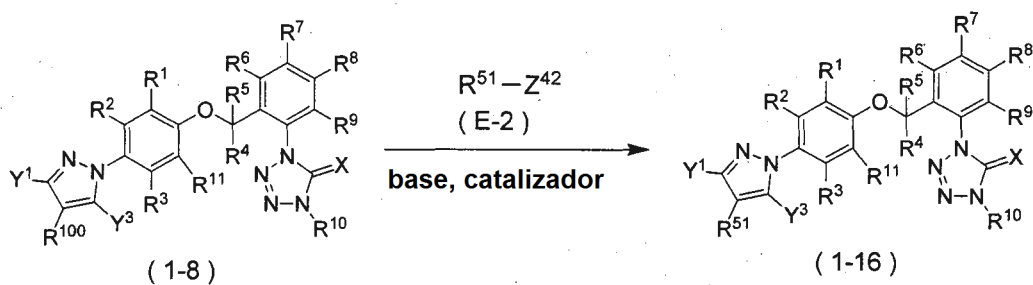
De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-13), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4 y Z³ representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (1-15) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (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 oxocloruro 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, Z², Z⁴ y X son los mismos como se han definido anteriormente]

(Proceso L)

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.



[en la que

$\text{R}^1, \text{R}^2, \text{R}^3, \text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{11}, \text{R}^{51}, \text{R}^{100}, \text{Y}^1, \text{Y}^3, \text{X}$ y Z^{42} 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 *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 (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 ($\text{R}^{51}-\text{I}$) o un compuesto de bromo ($\text{R}^{51}-\text{Br}$) 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 hidrólisis 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 ($\text{BF}_3 \text{K}^+$).

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)/díciclohexil(2',4',6'-triisopropilbifenil-2-il)fosfina y tris(dibencilidenoacetona)dipaladio y similares.

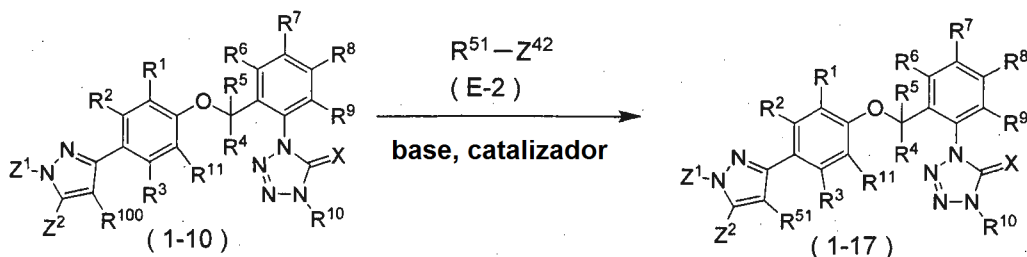
Ejemplos de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato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

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).

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.

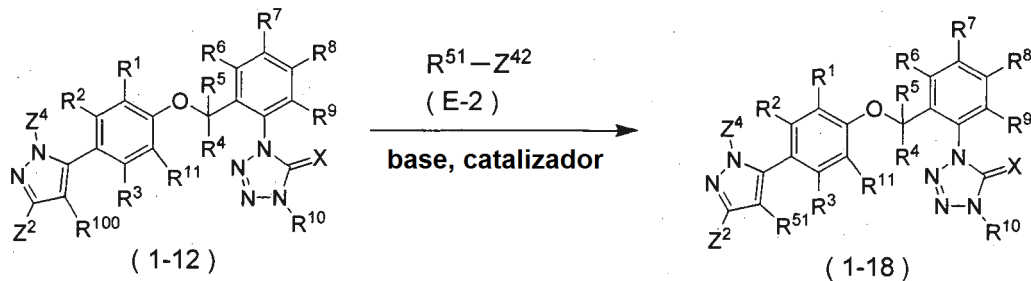
Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el presente compuesto de la fórmula (1-16). Además, el presente compuesto aislado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

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 Z³ 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.



[en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁵¹, R¹⁰⁰, X, Z¹, Z² y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

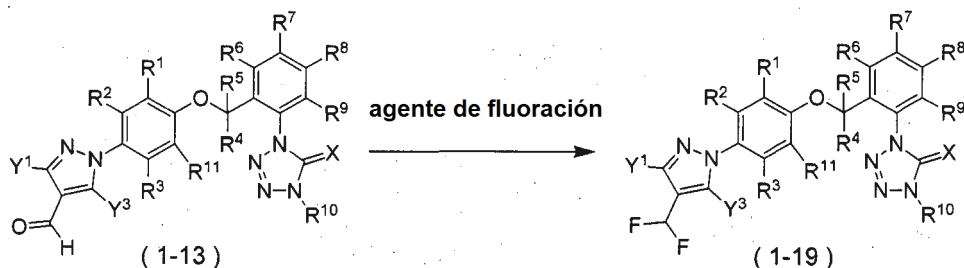
De acuerdo con el proceso para la preparación del Compuesto anteriormente mencionado (1-16), el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q4 y Z³ representa un R 51, es decir, el compuesto de una fórmula (1-18) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (1-18)), 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 formula (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, R¹¹, R⁵¹, R¹⁰⁰, X, Z², Z⁴ y Z⁴² son los mismos como se han definido anteriormente]

(Proceso M)

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.



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, Y^1, Y^3$ y X 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 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.

10

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, e incluye, por ejemplo, (1.8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno y trihydroborato de trietilamina.

15

20

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).

25

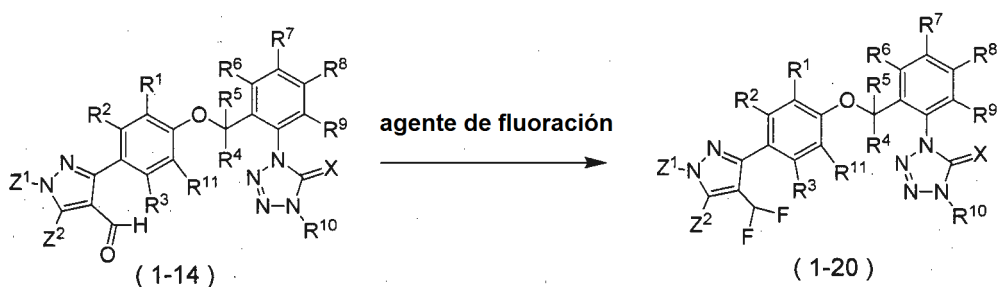
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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.

30

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.

35



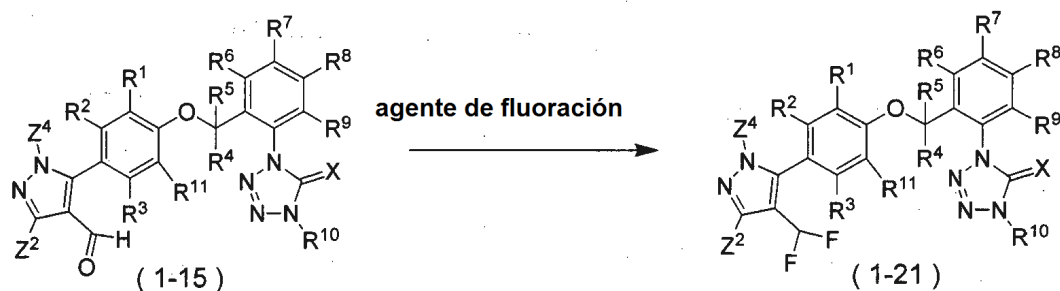
40

[en la que

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

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.

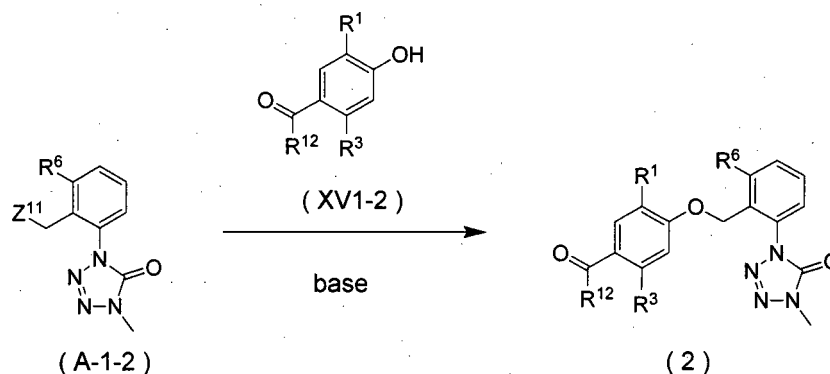
45



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

(Proceso N)

El presente compuesto de la fórmula (2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (2))
 10 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.



15 [en la que
 R^1, R^3, R^6, R^{12} y Z^{11} 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 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

40 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).

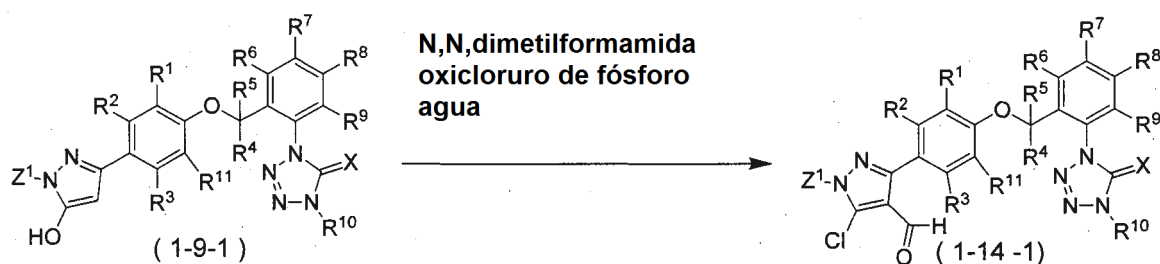
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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).

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)

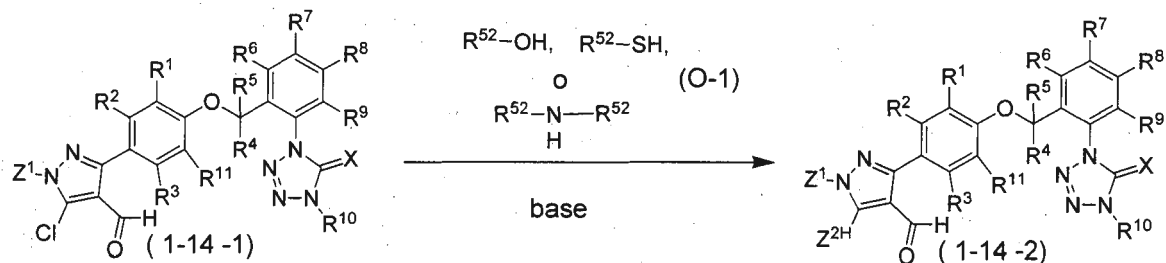
De acuerdo con el proceso para preparar el Compuesto (1-13) anteriormente mencionado, el presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2, Z² representa un átomo de cloro, y Z³ representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (1-14-1) (en lo sucesivo en el presente documento, 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 oxocloruro 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]

(Proceso P)

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 formula (1-14-1) con un compuesto de a formula (O-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (O-1)) en presencia de una base.



[en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R⁵¹, Z¹ y X son los mismos como se han definido anteriormente, R⁵² representa un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6 y Z^{2H} representa R⁵¹-O-, R⁵¹-S o (R⁵¹)₂-N]

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.

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

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.

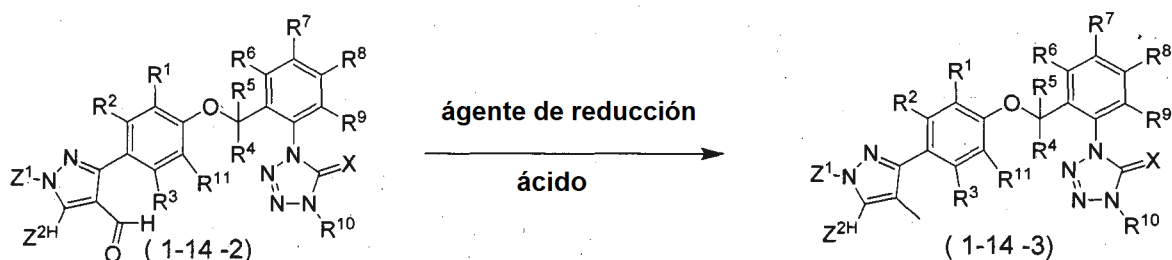
En la reacción, también pueden usarse sales metálicas del Compuesto (O-1), que se prepararan previamente haciendo reaccionar el Compuesto (O-1) con una base. Ejemplos de las sales a usarse incluyen metóxido de sodio, etóxido de sodio, propóxido de sodio, isopropóxido de sodio, metóxido de sodio, etóxido de sodio, tiometóxido de sodio y tioetóxido de sodio.

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).

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)

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



[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.

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 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.

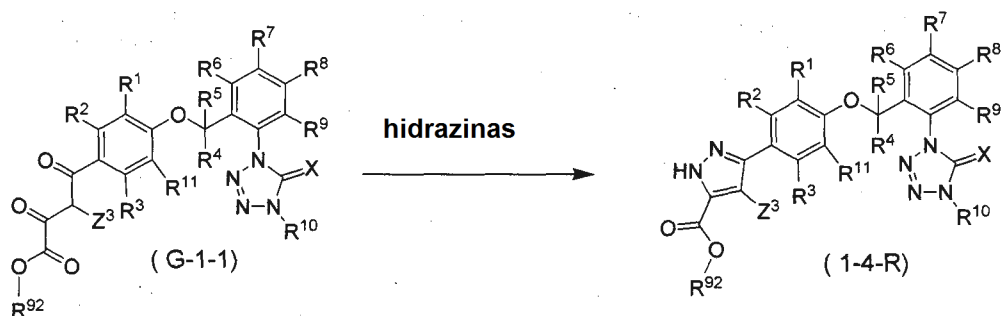
En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares y el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares o un exceso de relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-14-2).

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.

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 alcoxycarbonilo 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.



[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.

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; 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 hidrazina, hidrazina anhidro y similares.

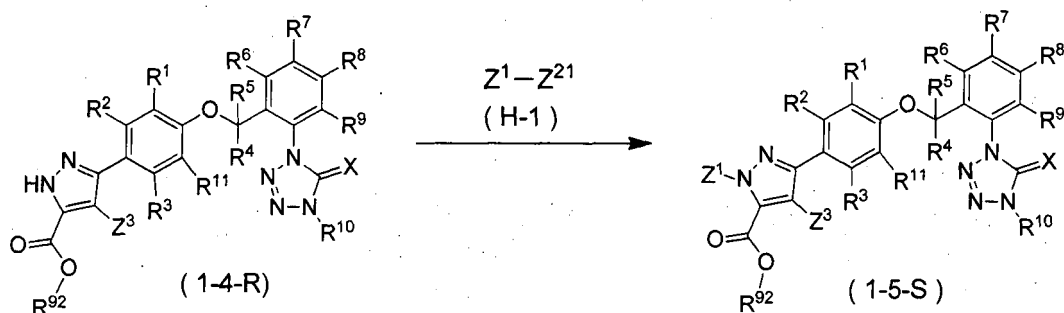
En la reacción, normalmente se usan hidrazinas dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (G-1-1).

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 (1-4-R). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso S)

El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z² representa un grupo alcóxicarbonilo 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.



[en la que

10 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]

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.

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 propilo, 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-butilino, bromuro de alilo, bromuro de ciclopropilo, bromuro de 2-propinilo, bromuro de 2-butilino, 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.

En la reacción, puede usarse una base, e incluye, por ejemplo, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

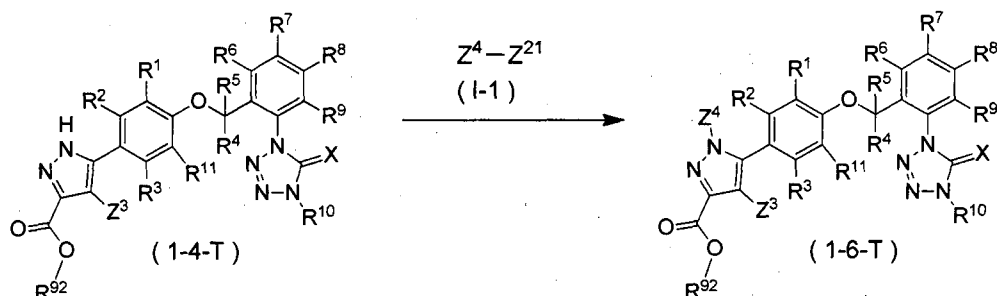
En la reacción, el compuesto (H-1) usa normalmente dentro del intervalo de una relación de 1 a 10 molar y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-4-R).

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 presente compuesto de la fórmula (1-5-S). Además, el presente compuesto aislado puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso T)

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.



[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] 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.

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 propilo, 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 ciclopropilo y cloruro de N,N-dimetilsulfonilo.

En la reacción, puede usarse una base, e incluye, por ejemplo, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 (I-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.

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.

(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.



5 [en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{92}, X, Z^1$ y Z^3 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 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 del agente de amidación a usarse en la reacción incluyen amoniaco acuoso, sal clorhidrato de amoniaco, sal hidrosulfato de amoniaco y gas amoniaco. También puede usarse el agente de amidación como disolvente.

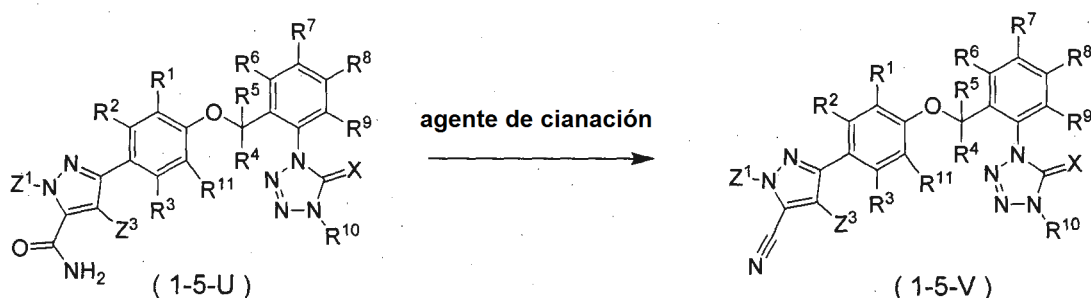
En la reacción, el agente de amidación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-5-S).

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.

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 (1-5-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 pueden purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso V)

35 El presente compuesto de la fórmula (1) en la que Q representa Q2 y Z^2 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.



40 [en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, Z^1$ y Z^3 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-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, pentacloruro 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.

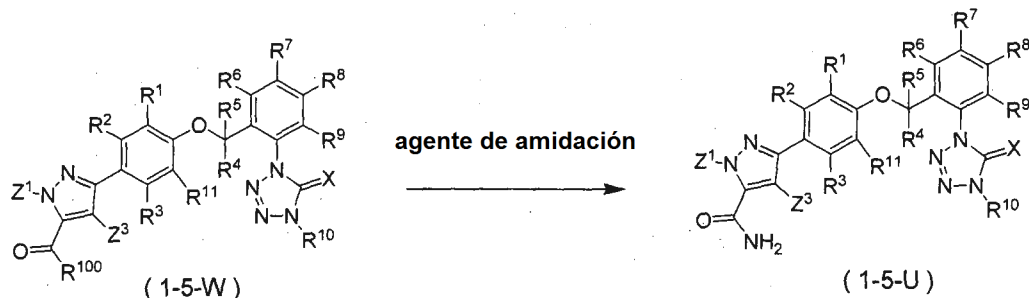
En la reacción, el agente de cianación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 20 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a una gran cantidad de relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (1-5-U).

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.



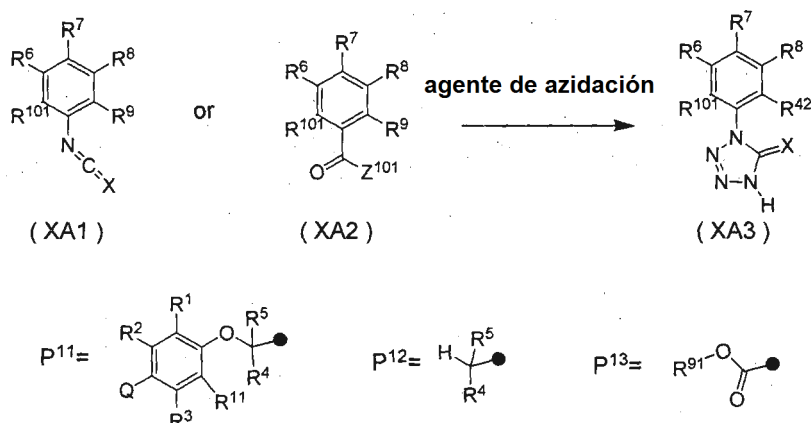
[en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{100}, X, Z^1$ y Z^3 son los mismos como se han definido anteriormente]

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

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

(Proceso de Referencia A)

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 (XA2)) 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 *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; 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.

20 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).

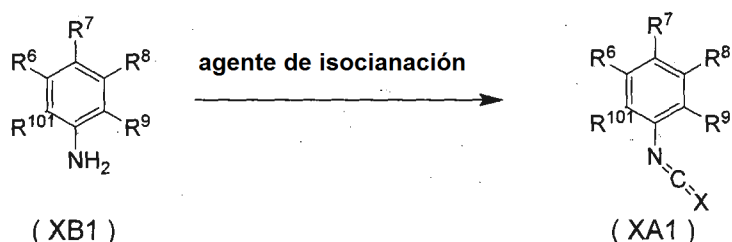
25 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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
 $R^6, R^7, R^8, R^9, R^{101}$ y X 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 *terc*-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 del agente de isocianación a usarse en la reacción incluyen fosgeno, difosgeno, trifosgeno, tiofosgenos, N,N-carbodiimidazol y N,N-tiocarbodiimidazol.

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).

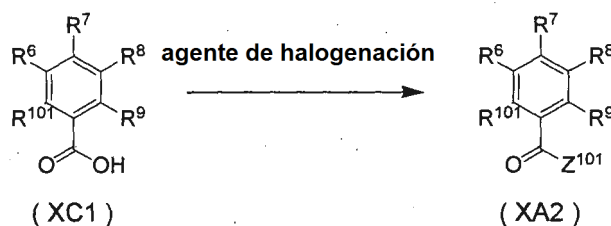
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Si fuese necesario, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalinos, 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).

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 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.



[en la que
 $R^6, R^7, R^8, R^9, R^{101}$ y Z^{101} 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 *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.

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, triyoduro de fósforo, dicloruro de oxalilo, dibromuro de oxalilo, trifosgeno, difosgeno, fosgeno y cloruro de sulfurilo.

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.

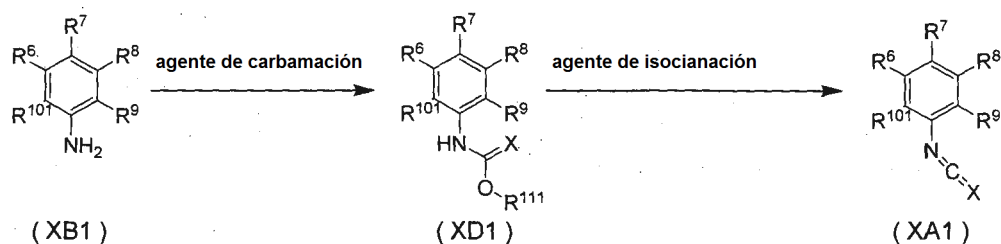
Puede añadirse a la reacción un catalizador, e incluye, por ejemplo, N,N-dimetilformida. El catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XC1).

Si fuese necesario, bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno, carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalinos, 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).

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 destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia D)

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.



[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]

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.

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 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 *tert*-butilo, dicarbonato de di-*tert*-butilo, dicarbonato de dimetilo, dicarbonato de dietilo, clorotioformiato de fenilo, clorotioformiato de metilo y clorotioformiato de etilo.

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.

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).

- 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 (XD1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XD1), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.
- 10 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.

- 15 Ejemplos del disolvente que puede usarse en la reacción incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, dioxano, etilenglicol dimetil éter, metil *tert*-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.

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.

- 25 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).

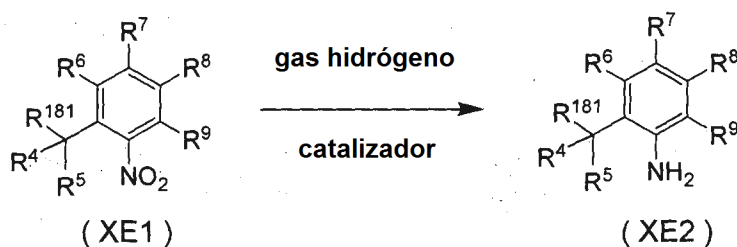
- 30 La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 250 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- Si fuese necesario, pueden añadirse a la reacción 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).

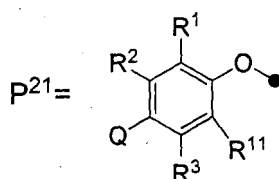
- 40 Cuando la reacción se completa, las mezclas de reacción se extraen con un disolvente o disolventes orgánicos, y las capas orgánicas resultantes se someten a tratamiento (por ejemplo, secado y concentración) para aislar el Compuesto (XA1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XA1), por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

(Proceso de Referencia E)

- 45 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.



50



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{11}$ y Q son los mismos como se han descrito anteriormente; R^{181} representa un átomo de hidrógeno o P^{21} ; y un punto representa un sitio de unión]

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

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.

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.

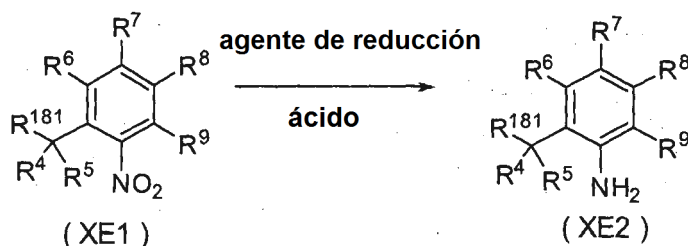
En la reacción, el catalizador se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 1 relaciones molares, y normalmente se usa gas hidrógeno en una cantidad en exceso, frente a 1 mol del Compuesto (XE1).

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.

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)

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



[en la que

$R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9$ y R^{181} 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 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.

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

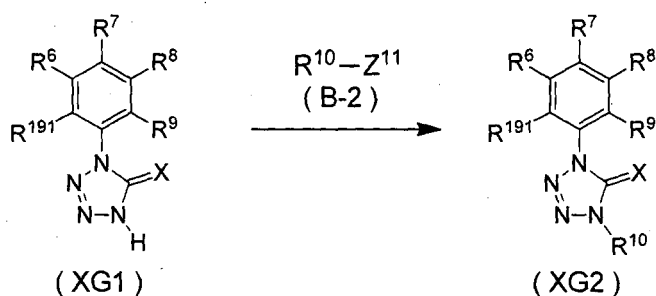
(XE1).

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 (XE2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XE2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia G)

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.

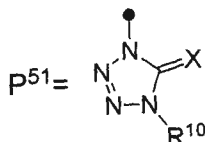
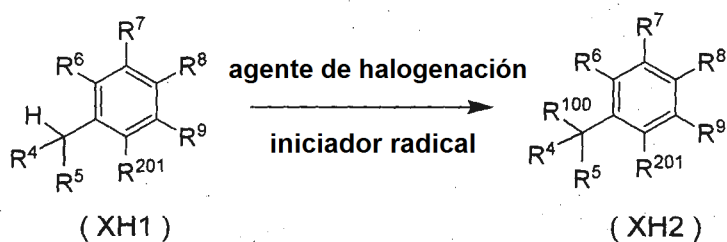


[en la que $\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{X}$ y Z^{11} son los mismos como se han descrito anteriormente; y R^{191} representa P^{12} o P^{13}]

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

(Proceso de Referencia H)

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 $\text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{100}$ y X son los mismos como se han descrito anteriormente; y R^{201} representa P^{51} o un grupo nitro]

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.

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-dimetilhidantoína, yodosuccinimida, hipoclorito de *tert*-butilo, N-cloroglutarimida, N-bromoglutarimida, N-cloro-N-ciclohexil-bencenosulfonamida y N-bromoftalimida.

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

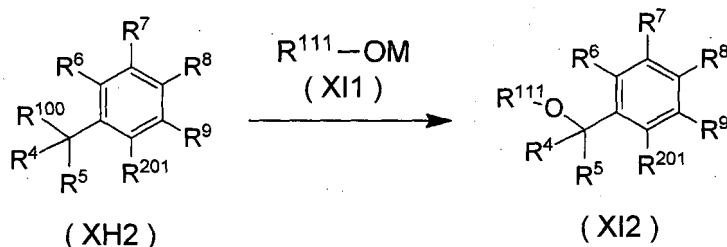
En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y el iniciador radical se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,01 a 5 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XH1).

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.

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 I)

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 $\text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{100}, \text{R}^{201}$ y R^{111} 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.

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

En la reacción, el Compuesto (XI1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a

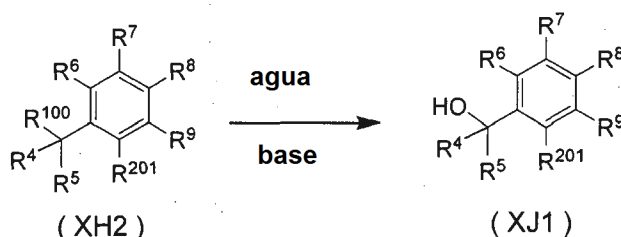
1 mol del Compuesto (XH2).

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.

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 (XJ2). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XJ2), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(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.



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

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 *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 de la base a usarse en la reacción incluyen bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropilamina, 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; 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; y alcóxidos de metal alcalinos, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio.

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).

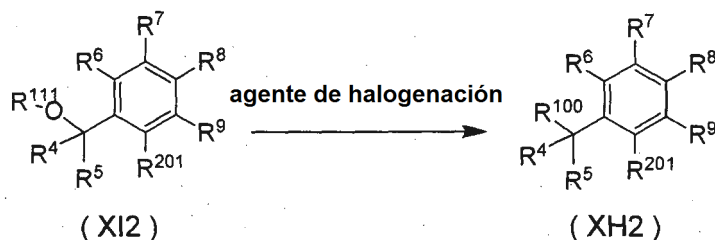
En la reacción, se usa normalmente agua dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XH2).

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 (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.



[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]

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, nitrilos de metil isobutil cetona, 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 incluyen ácido clorhídrico, ácido bromhídrico y ácido yodhídrico.

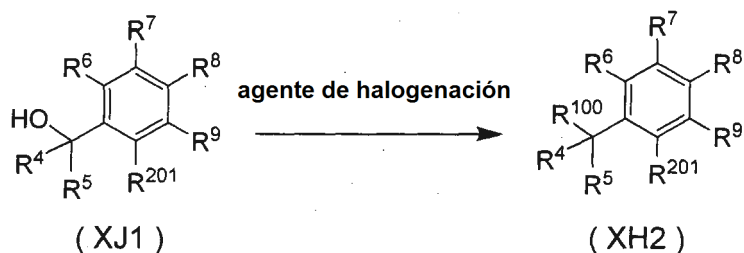
En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente en 1 o más relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XI2).

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 L)

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.



[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]

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, oxiclururo 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).

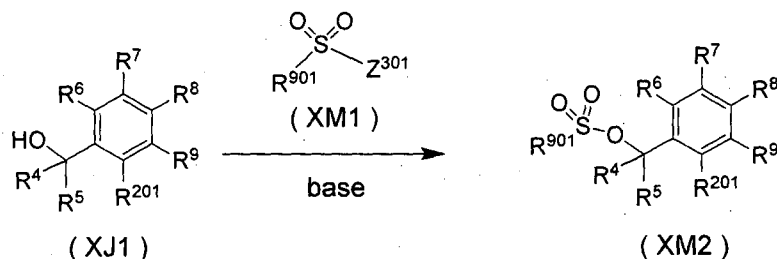
Para promover la reacción, puede añadirse un agente aditivo dependiendo del agente de halogenación usado, e incluye específicamente cloruro de cinc para cloruro de acetilo; trifenilfosfina para tetrabromuro de carbono; sulfuro de dimetilo para N-bromosuccinimida; complejo trifluoruro de boro dietileterato 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, 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; 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, 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).

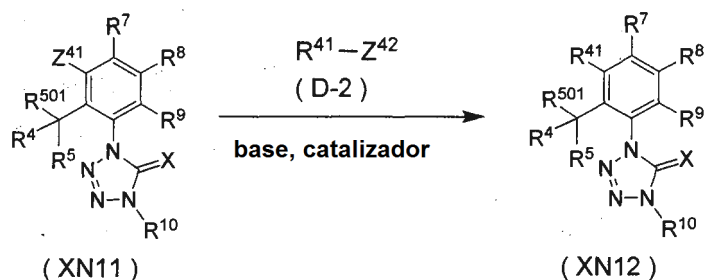
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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.

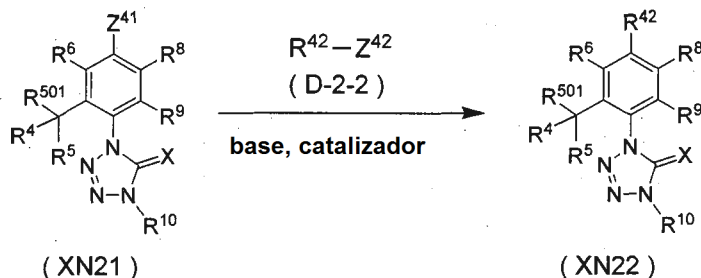


[en la que

R^{501} representa un átomo de hidrógeno o un grupo OR^{111} , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{41} , X , 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.

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.



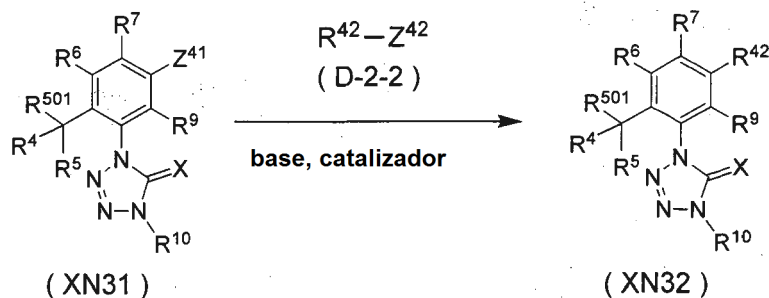
[en la que

R^4 , R^5 , R^6 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{42} , R^{501} , X , 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.

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

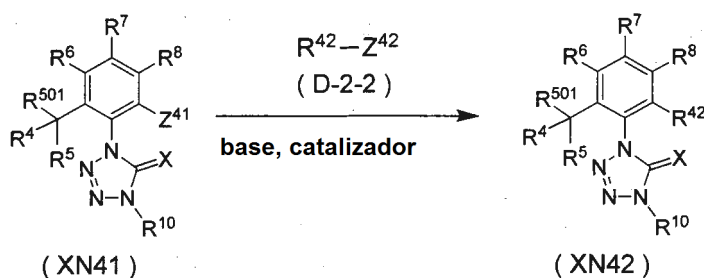
catalizador.



- 5 [en la que $\text{R}^4, \text{R}^5, \text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{42}, \text{R}^{501}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ 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.



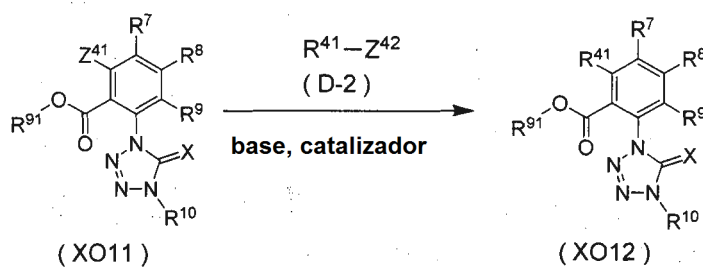
15

[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]

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

(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.

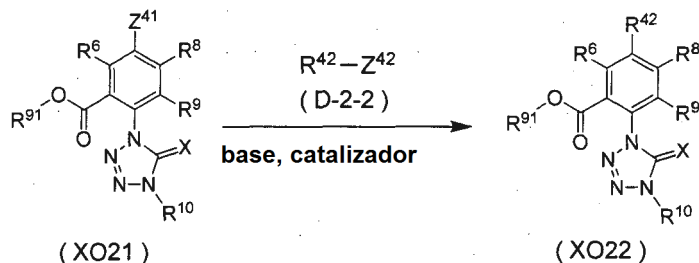


- 30 [en la que $\text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{41}, \text{R}^{91}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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

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.

5



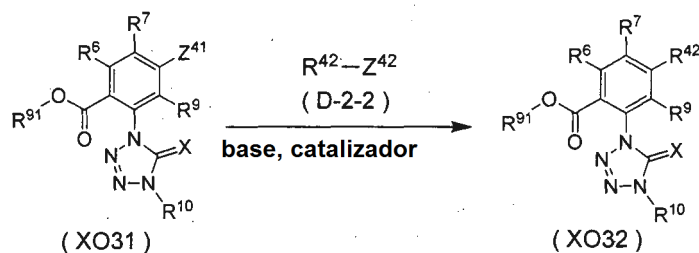
[en la que
 $\text{R}^6, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{42}, \text{R}^{91}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

10

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.

15



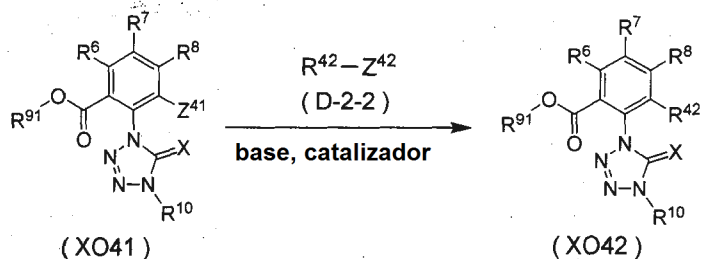
[en la que
 $\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^9, \text{R}^{10}, \text{R}^{42}, \text{R}^{91}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

20

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.

25



30

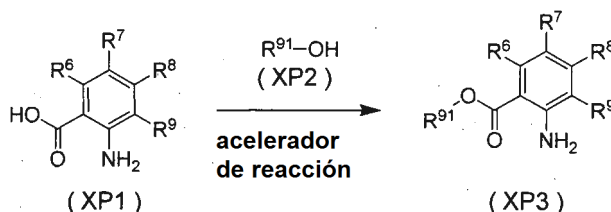
[en la que
 $\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^{10}, \text{R}^{42}, \text{R}^{91}, \text{X}, \text{Z}^{41}$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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

35

(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.



10 [en la que
 $\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9$ y R^{91} 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 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.

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

30 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).

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 0,001 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

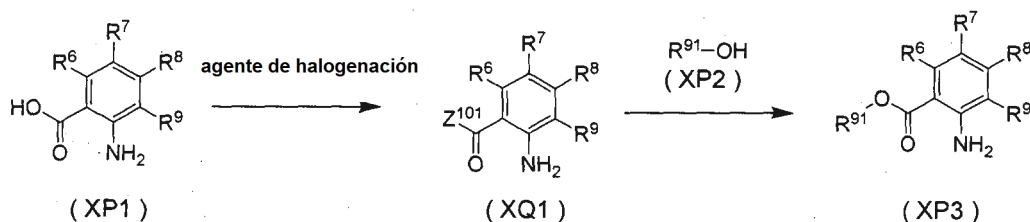
40 En la reacción, el Compuesto (XP2) se usa normalmente en un exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

45 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 (XP3). Además puede purificarse el Compuesto aislado (XP3), por ejemplo, por destilación, cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia Q)

55 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
 $\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9, \text{R}^{91}$ y Z^{101} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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).

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.

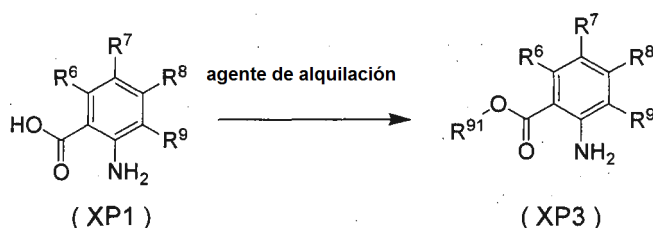
Ejemplos del Compuesto (XP2) a usarse en la reacción incluyen alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, isopropanol, butanol, sec-butanol, t-butanol y pentanol. En la reacción, el Compuesto (XP2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 50 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XQ1).

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 R)

Puede prepararse el Compuesto (XP3) haciendo reaccionar el Compuesto (XP1) con un agente de alquilación.



[en la que
 $\text{R}^6, \text{R}^7, \text{R}^8, \text{R}^9$ y R^{91} 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.

- 5 Ejemplos del agente de alquilación a usarse en la reacción incluyen compuestos diazo, tales como diazometano, trimetilsilildiazometano; alquilo 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).

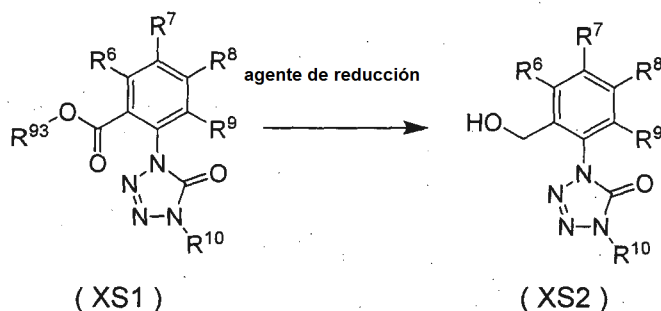
- 15 Si fuese necesario, puede añadirse un agente aditivo a la reacción, y específicamente, incluye bases orgánicas, tales como trietilamina, piridina, N-metilmorfolina, N-metilpiperidina, 4-dimetilaminopiridina, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicycloundeceno y diazabicyclononeno; carbonatos de metal alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio y bicarbonato cesio; y sales de amonio cuaternario, tales como hidróxido de tetrabutilamonio. Este agente aditivo, se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 5 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XP1).

- 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 S)

- 35 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.



- 40 [en la que R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son los mismos como se han descrito anteriormente; R^{93} representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3]

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; 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 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.

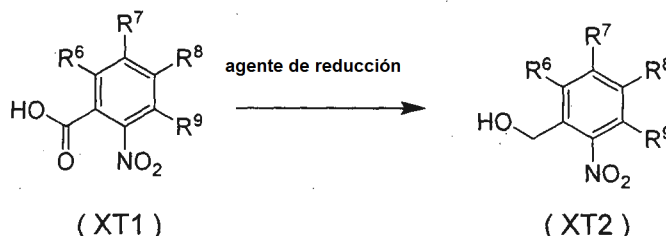
En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XS1).

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.

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 R^6 , R^7 , R^8 y R^9 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; 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.

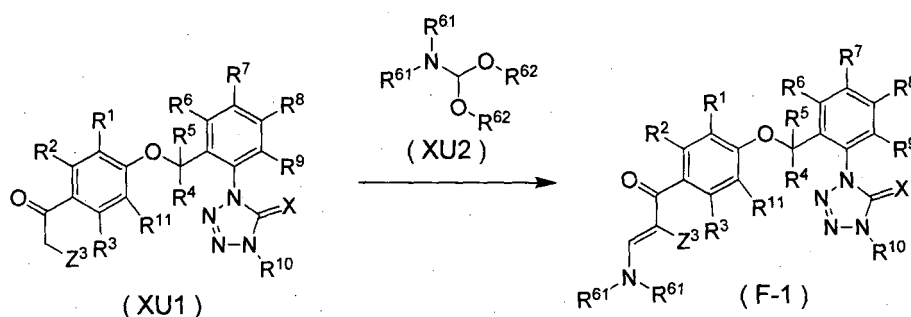
En la reacción, el agente de reducción se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XT1).

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)

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)).



[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 se lleva a cabo normalmente en un disolvente o en un sistema libre de 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; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

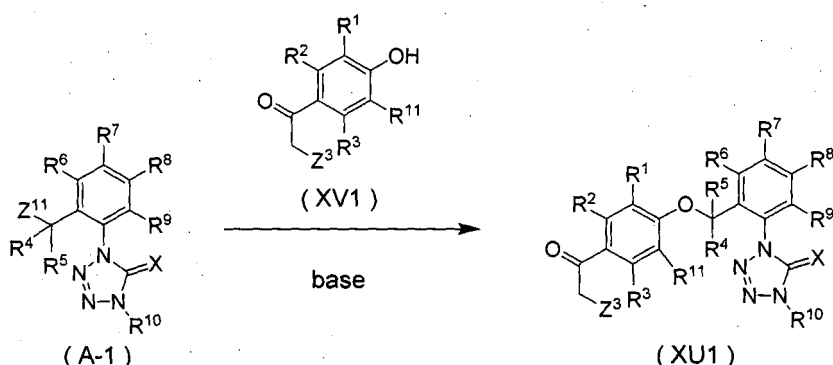
En la reacción, el Compuesto (XU2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

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.

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 destilación, cromatografía y recristalización.

(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.



[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]

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.

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

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).

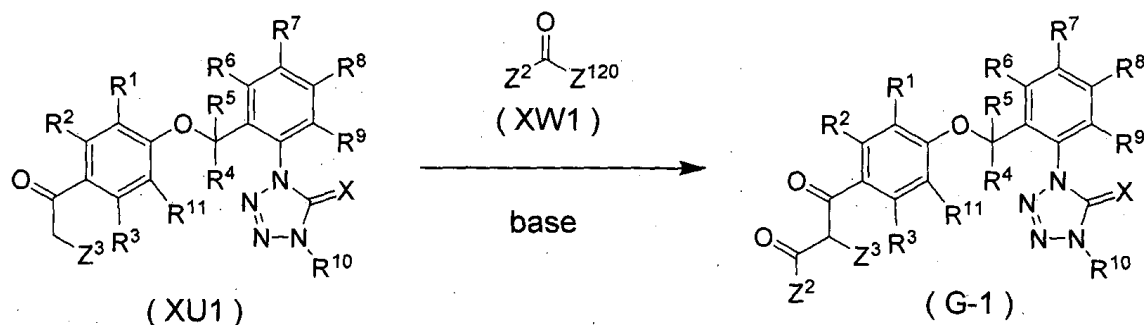
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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 recrystalización.

(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 $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, X, Z^2$ y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente; y Z^{120} 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, 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.

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 alcalinos, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

- 10 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).

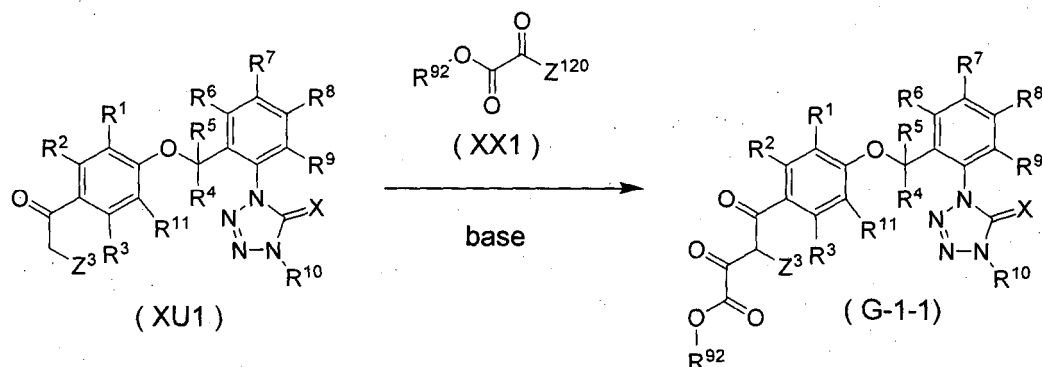
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- 15 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. El agente aditivo, se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

- 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 (G-1). Además puede purificarse el Compuesto aislado (G-1), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

- 25 (Proceso de Referencia X)

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.



30

[en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{92}, X, Z^3$ y Z^{120} 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 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.

- 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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 alcalinos, tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *terc*-butóxido de sodio, *terc*-butóxido de potasio.

50

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).

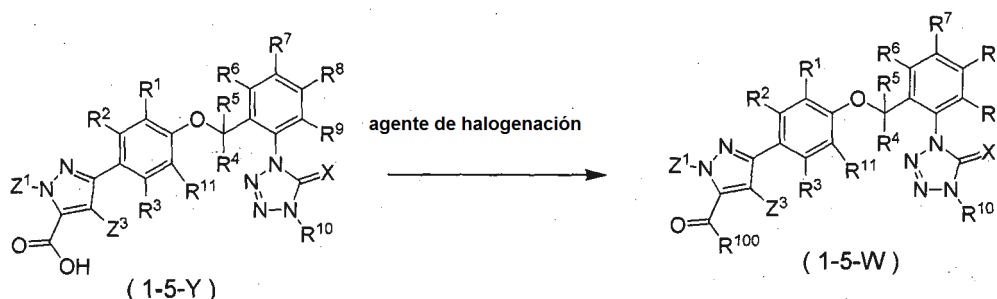
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El período de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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. El agente aditivo, se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XU1).

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.



[en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{100}, X, Z^1$ y Z^3 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 *terc*-butil éter, diisopropil éter; hidrocarburos halogenados, tales como tetracloruro de carbono, cloroforno, 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 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, triyoduro de fósforo, dicloruro de oxalilo, dibromuro de oxalilo, trifosgeno, difosgeno, fosgeno y cloruro de sulfúrico.

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 (1-5-Y).

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 a la reacción un catalizador, e 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 (1-5-Y).

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio, bicarbonatos de metal alcalinos, 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 (1-5-Y).

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 (1-5-W). Además puede purificarse el Compuesto aislado (1-5-W), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

5 (Proceso de Referencia Z)

Puede prepararse el Compuesto (1-5-Y) haciendo reaccionar un Compuesto (1-5-S) con un agente hidrolítico.



10 [en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{92}, X, Z^1$ y Z^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 agua; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; 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; cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona; y disolventes mezclas de los mismos.

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.

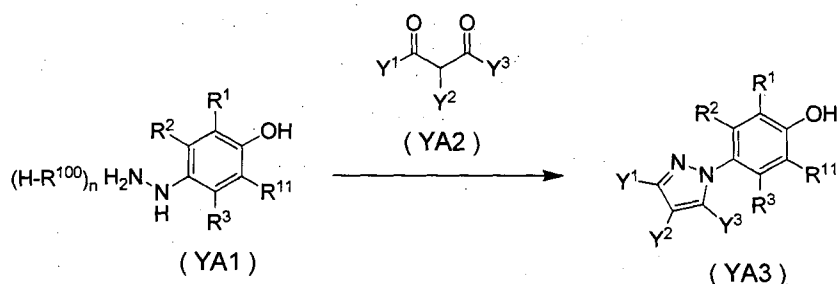
25 En la reacción, el agente hidrolítico se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,5 a 20 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (1-5-S).

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.

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 (1-5-Y). Además puede purificarse el Compuesto aislado (1-5-Y), por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

35 (Proceso de Referencia AA)

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)).



45 [en la que

$R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{100}, Y^1, Y^2$ 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 *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; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

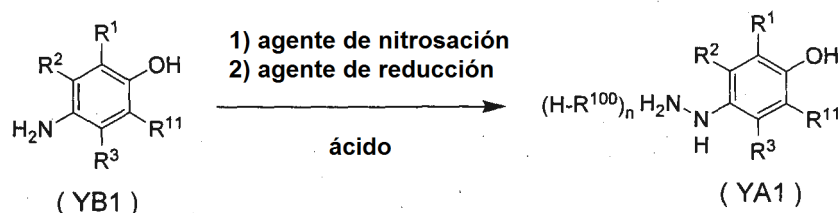
En la reacción, el Compuesto (YA2) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YA1).

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 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 (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 recrystalización.

(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.



[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{100}$ y n 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 alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del agente de nitrosación a usarse en la reacción incluyen nitrito de sodio, nitrito de potasio, nitrito de *terc*-butilo y nitrito de isoamilo.

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).

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).

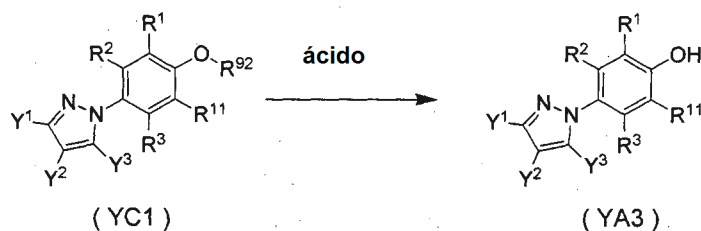
La temperatura de reacción está normalmente dentro de un intervalo de -20 a 150 °C. El periodo de reacción de la reacción está normalmente dentro de un intervalo de 0,1 a 24 horas.

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 (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 recrystalización.

5 (Proceso de Referencia AC)

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.



[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.

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.

Ejemplos del ácido a usarse en la reacción incluyen ácido acético, ácido clorhídrico y ácido bromhídrico, y estas soluciones acuosas pueden usarse como disolvente.

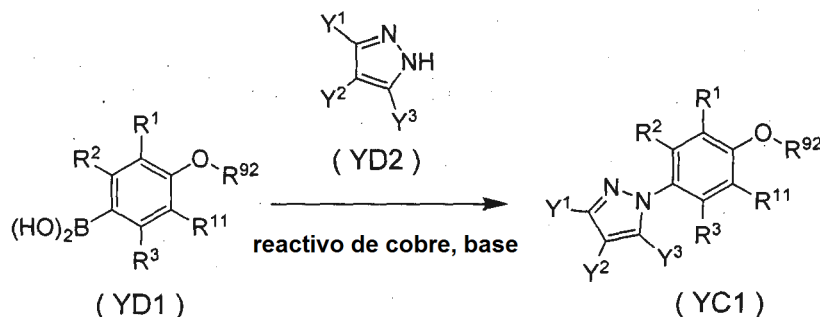
En la reacción, el ácido se usa normalmente en un intervalo de un gran exceso de relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YC1).

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 100 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 (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 recrystalización.

35 (Proceso de Referencia AD)

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.



[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.

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; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del reactivo de cobre a usarse en la reacción incluyen acetato de cobre (II).

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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

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).

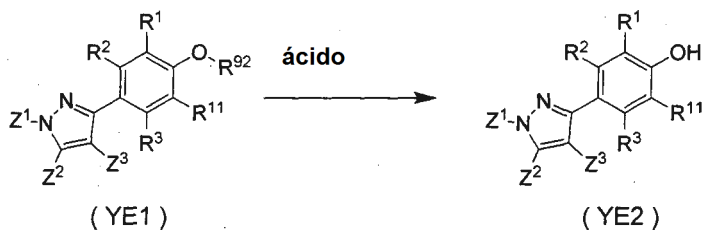
Si fuese necesario, puede usarse en la reacción un agente de deshidratación, tal como un tamiz molecular, y el agente de deshidratación se usa normalmente dentro de un intervalo de 100 a 500 por ciento en masa frente a 1 mol del Compuesto (YD1).

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.

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)

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.

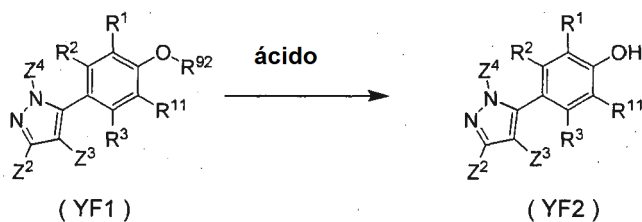


[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^1, Z^2$ y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

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

(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.



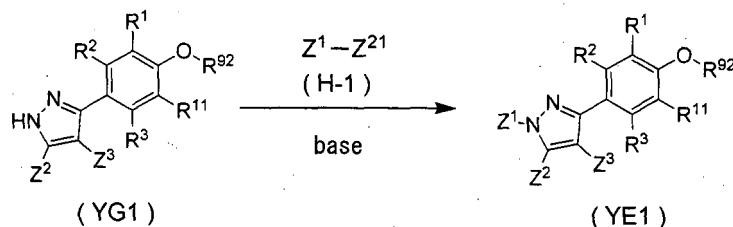
[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^2, Z^3$ y Z^4 son los mismos como se han descrito anteriormente]

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.

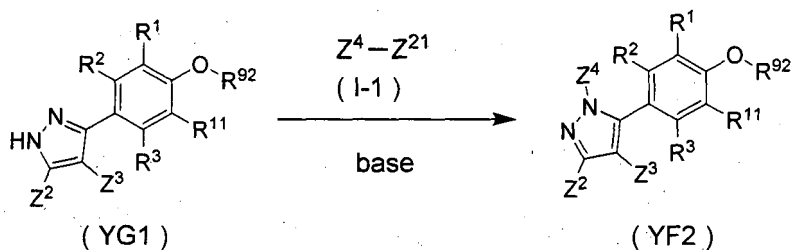


- 15 [en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^1, Z^2, Z^3$ y Z^{21} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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.



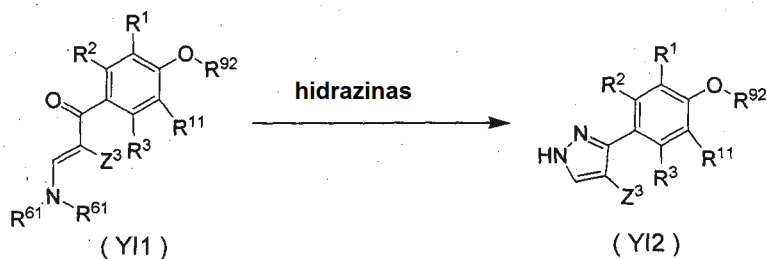
25

[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^2, Z^3, Z^4$ y Z^{21} 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 hidrazinas.



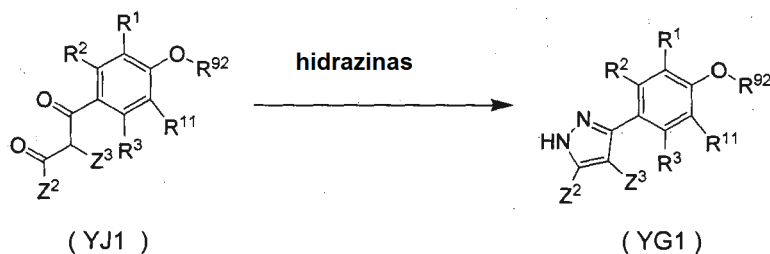
[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{61}, R^{92}$ y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

5

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 hidrazinas.

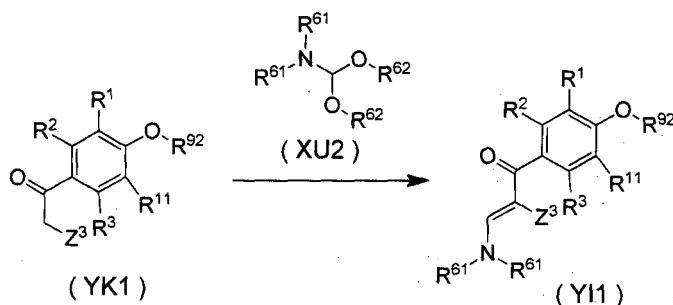


- 15 [en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^2$ y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

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).



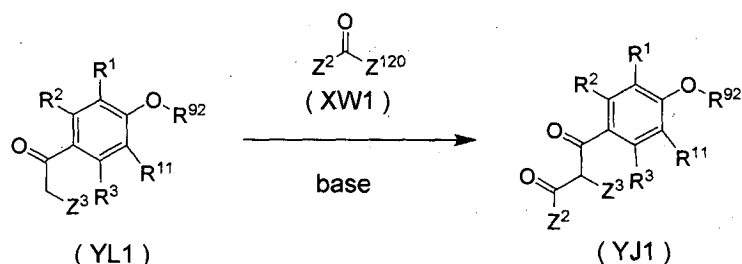
25

[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{61}, R^{62}, R^{92}$ y Z^3 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.



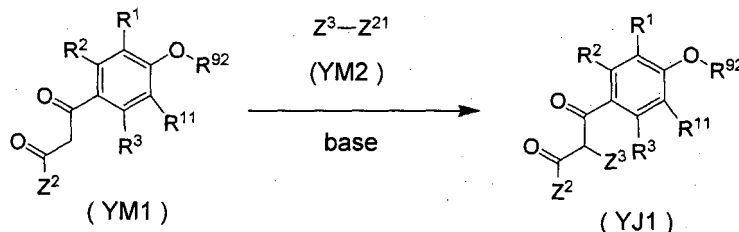
[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^2, Z^3$ y Z^{120} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^2, Z^3$ y Z^{21} 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.

- 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 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

- Si fuese necesario, puede añadirse un agente aditivo a la reacción, y específicamente, incluye bromuro de tetrabutilamonio y fluoruro de tetrabutilamonio y similares.

45

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).

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 (YJ1). Además, el presente Compuesto (YJ1) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AN)

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.

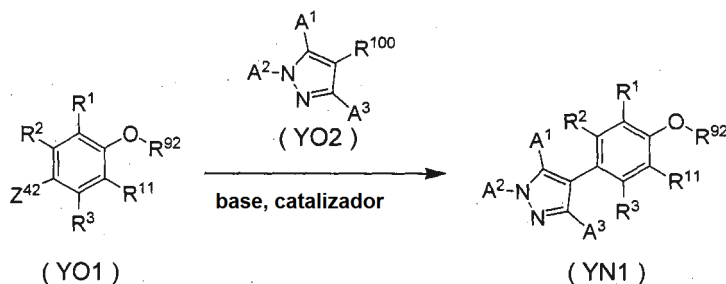


[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, A^1, A^2$ y A^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

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

(Proceso de Referencia AO)

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.

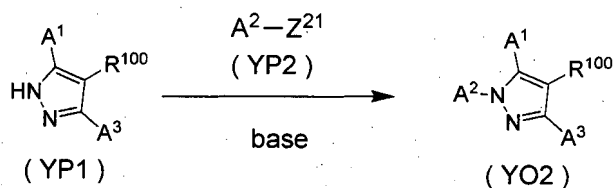


[en la que $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, R^{100}, A^1, A^2, A^3$ y Z^{42} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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

(Proceso de Referencia AP)

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.



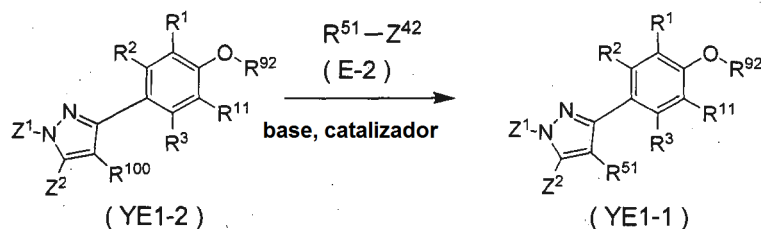
[en la que R^{100} , A^1 , A^2 , A^3 y Z^{21} son los mismos como se han descrito anteriormente]

5

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 de 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.



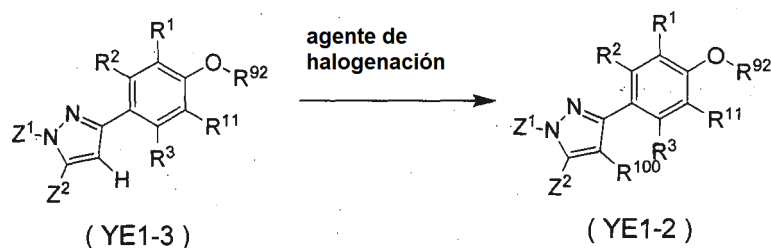
15

[en la que 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]

- 20 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.



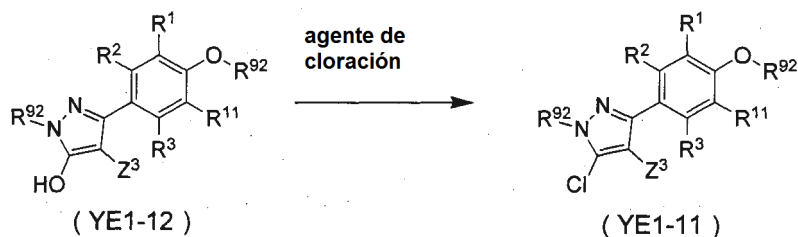
- 30 [en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} , R^{92} , R^{100} , Z^1 y Z^2 son los mismos como se han descrito anteriormente]

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

- 35 (Proceso de Referencia AS)

- Un compuesto de una fórmula (XE1) 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 (XE1-11)) 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 (XE1-12)) con un agente de cloración.

40



[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}$ y Z^3 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.

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.

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, oxiclورو 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, diisopropiletilamina, lutidina, colidina, diazabicicoundeceno y diazabiciclononeno.

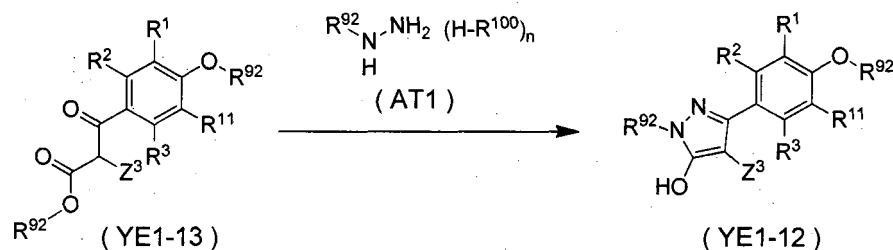
En la reacción, el agente de cloración se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a un gran exceso de relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YE1-12).

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.

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.

(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 (XE1-13)) con el Compuesto (AT1).



[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}$ y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente; y n es 0 o 1]

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.

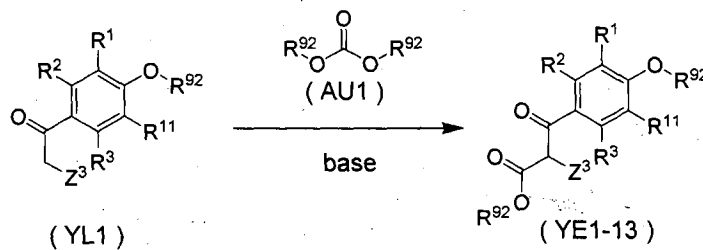
5 En la reacción, el Compuesto (AT1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares, y el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 100 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (YE1-13).

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.

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
15 Compuesto (YE1-12). Además, el presente Compuesto (YE1-12) aislado, puede purificarse, por ejemplo, por cromatografía y recristalización.

(Proceso de Referencia AU)

20 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.



25 [en la que
 R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} , R^{92} y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

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, 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; 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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).

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.

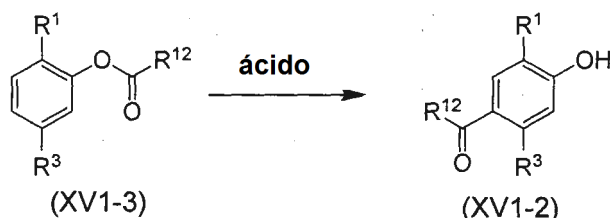
Si fuese necesario, puede añadirse a la reacción un agente aditivo, e incluye específicamente, por ejemplo, 18-corona-6, dibenzo-18-corona-6 y similares. El agente aditivo, se usa normalmente dentro de un intervalo de 0,001 a
55 1,2 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XL1).

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.

5 (Proceso de Referencia AV)

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 (XV1-3)) en presencia de un ácido.



[en la que R^1 , R^3 y R^{12} son los mismos como se han descrito anteriormente]

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 *terc*-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.

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.

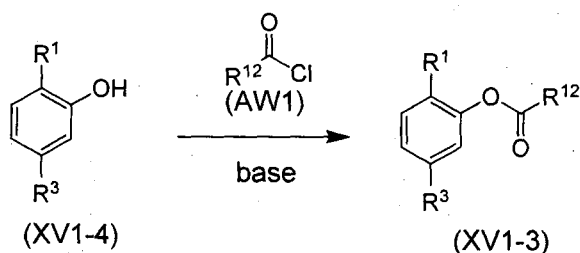
En la reacción, el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (XV1-3).

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.

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.

(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.



[en la que R^1 , R^3 y R^{12} 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; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; 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 alcalinos, tales como carbonato de litio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bicarbonatos de metal alcalinos, tales como bicarbonato de litio, bicarbonato de sodio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de cesio; hidróxidos de metal alcalinos, tales como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de cesio; haluros de metal alcalinos, 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.

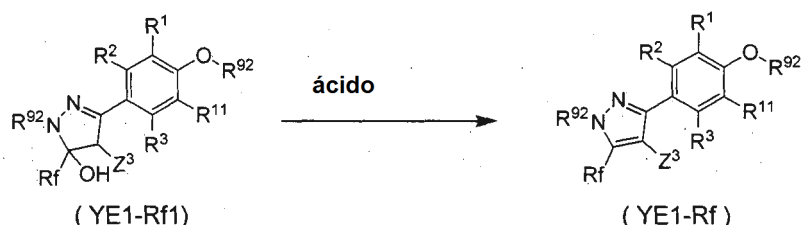
En la reacción, el Compuesto (AW1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, y la base se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares, frente a 1 mol del Compuesto (XV1-4).

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.

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)

El Compuesto (YE1) en el que Z^1 representa R^{92} , y Z^2 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.



[en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^{11} , R^{92} y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente; y R_f representa un grupo perfluoroalquilo C1-C6, un grupo 1,1-difluoroetilo, un grupo 1,1-difluoropropilo o un grupo 2,2-difluoropropilo]

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; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

Ejemplos del ácido a usarse en la reacción incluyen ácido acético, ácido clorhídrico y ácido bromhídrico, y estas soluciones acuosas pueden usarse como disolvente.

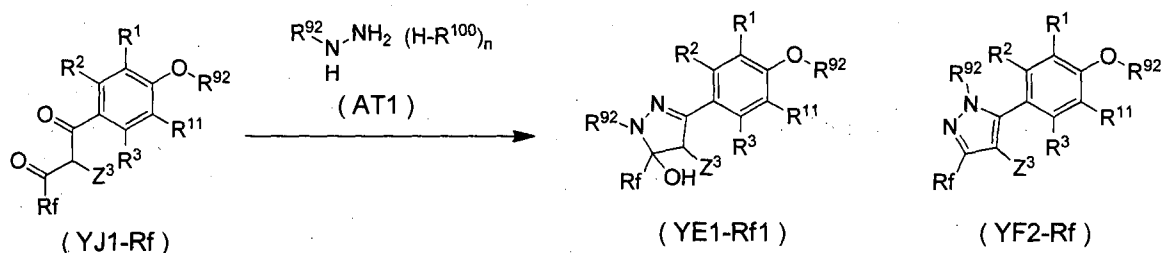
En la reacción, el ácido se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YE1- R_f1).

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.

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 AY)

El Compuesto (YE1-Rf1) y un compuesto de una fórmula (YF2) en el que Z^2 representa Rf y Z^4 representa R^{92} , 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 Z^2 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).



[en la que

$R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}, Z^3$ y Rf son los mismos como se han descrito anteriormente; y n es 0 o 1]

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; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo; alcoholes, tales como metanol, etanol, isopropanol; agua; y disolventes mezclas de los mismos.

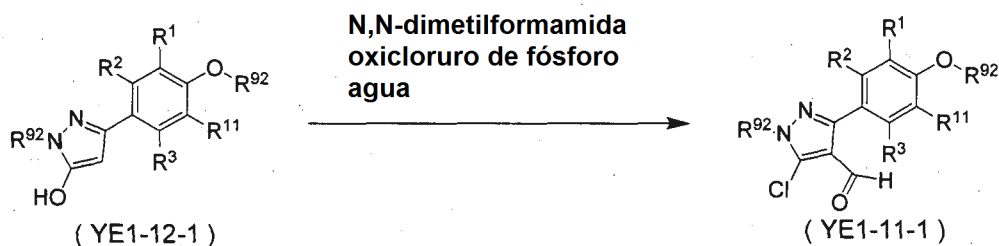
En la reacción, el Compuesto (AT1) se usa normalmente dentro de un intervalo de 1 a 10 relaciones molares frente a 1 mol del Compuesto (YJ1-Rf1).

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.

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.

(Proceso de referencia AZ)

El presente compuesto de la fórmula (YE1-11) en la que Z^3 representa un grupo aldehído, es decir, el compuesto de una fórmula (YE1-11-1) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-1)), puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una fórmula (YE1-12) en la que Z^3 representa un átomo de hidrógeno (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-12)) 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.



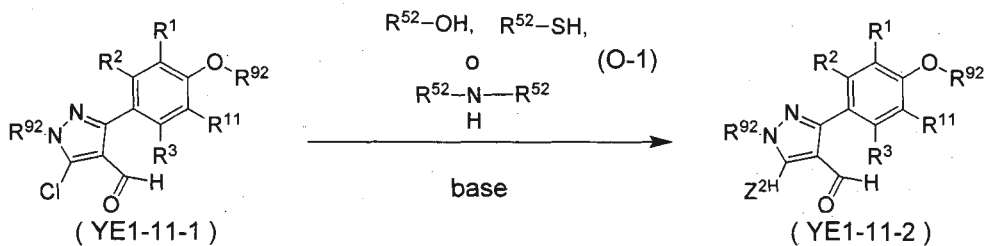
[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}$ y Z^3 son los mismos como se han descrito anteriormente]

5

La reacci3n puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso K.

(Proceso de referencia BA)

- 10 El Compuesto (YE1) en el que Z^2 representa Z^{2H} y Z^3 representa un grupo aldeh3do, es decir, un compuesto de una f3rmula (YE1-11-2) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-2)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una f3rmula (YE1-11-1) con el Compuesto (O-1) en presencia de una base.



15

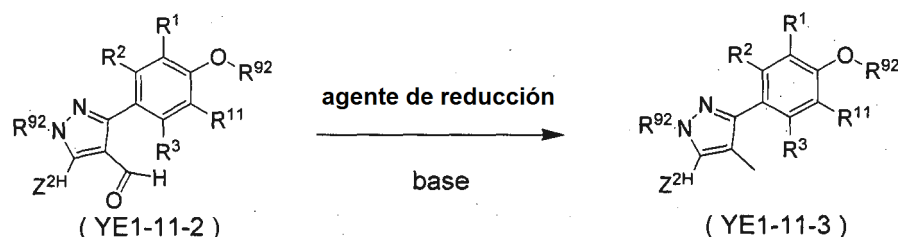
[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}$ y Z^{2H} son los mismos como se han definido anteriormente]

La reacci3n puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso P.

20

(Proceso de referencia BB)

- 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 f3rmula (YE1-11-3) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-3)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una f3rmula (YE1-11-2) con un agente reductor en presencia de una base.



30

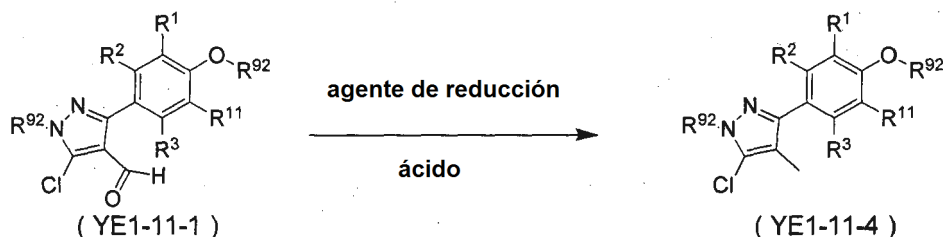
[en la que
 $R^1, R^2, R^3, R^{11}, R^{92}$ y Z^{2H} son los mismos como se han definido anteriormente]

La reacci3n puede llevarse a cabo de acuerdo con el Proceso Q.

35

(Proceso de referencia BC)

- 40 El Compuesto (YE1) en el que Z^2 representa un 3tomo de cloro y Z^3 representa un grupo metilo, es decir, un compuesto de una f3rmula (YE1-11-4) (en lo sucesivo en el presente documento, descrito como Compuesto (YE1-11-4)) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de una f3rmula (YE1-11-1) con un agente reductor en presencia de un 3cido.



[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.

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.

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.

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

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 alginico), 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.

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 sumergido; y una aplicación al suelo, tal como desinfección de la semilla.

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.

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.

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.

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.

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".

Cultivos:

maíz, arroz, trigo, cebada, centeno, avena, sorgo, algodón, soja, cacahuete, alforfón, remolacha, colza, girasol, caña de azúcar, tabaco y otros;

Hortalizas:

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),
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),
hortalizas lamiáceas (por ejemplo, *Perilla frutescens*, menta y albahaca),
fresa, batata, *Dioscorea japonica*, colocasia y otras;

Flores:

Plantas ornamentales de follaje:

Frutas:

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),
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:

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*);
y otros.

Las "plantas" mencionadas anteriormente incluyen cultivos modificados genéticamente.

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.

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*);

Enfermedades del trigo: oídio del trigo (*Erysiphe graminis*), fusariosis (*Fusarium gaminearum*, *F. avenaceum*, *F. culmorum*, *Microdochium nivale*), roya de la cebada (*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*);
- 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*),
- 5 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 collo-cygni*) y podredumbre por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*);
- 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*
- 10 *gaminicola*), cercosporiosis (*Cercospora zeae-maydis*), mancha ocular (*Kabatiella zeae*) 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*);
- 15 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*), oídio (*Podosphaera*
- 20 *leucotricha*), mancha de la hoja por *Alternaria* (*Alternaria alternata*, patotipo de la manzana), roña (*Venturia inaequalis*) y podredumbre amarga (*Colletotrichum acutatum*);
- 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
- 25 podredumbre por *Phomopsis* (*Phomopsis* sp.);
- Enfermedades de la uva: antracnosis (*Elsinoe ampelina*), podredumbre madura (*Glomerella cingulata*), oídio (*Uncinula necator*), roya (*Phakopsora ampelopsidis*), podredumbre negra (*Guignardia bidwellii*) y mildiú (*Plasmopara viticola*);
- Enfermedades del caqui japonés: antracnosis (*Gloeosporium kaki*) y mancha de la hoja (*Cercospora kaki*, *Mycosphaerella nawae*);
- 30 Enfermedades de la familia de la calabaza: antracnosis (*Colletotrichum lagenarium*), oídio (*Sphaerotheca fuliginea*), tizón gomoso del tallo (*Didymella bryoniae*), mancha anillada (*Corynespora cassicola*), 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
- 35 hoja (*Pseudocercospora fuligena*) y tizón tardío (*Phytophthora infestans*);
- Enfermedades de la berenjena: mancha marrón (*Phomopsis vexans*) y oídio (*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*);
- 40 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 cassicola*), antracnosis (*Colletotrichum glycines*, *C. truncatum*), podredumbre por *Rhizoctonia* (*Rhizoctonia solani*), mancha de ojo de rana en la hoja (*Cercospora sojae*);
- 45 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*);
- Enfermedades del guisante de jardín: oídio (*Erysiphe pisi*);
- Enfermedades de la patata: tizón temprano (*Alternaria solani*), tizón tardío (*Phytophthora infestans*) y verticilosis
- 50 (*Verticillium albo-atrum*, *V. dahliae*, *V. nigrescens*);
- Enfermedades de la fresa: oídio (*Sphaerotheca humuli*);
- Enfermedades del té: tizón vesicular de red (*Exobasidium reticulatum*), roña blanca (*Elsinoe leucospila*), tizón gris (*Pestalotiopsis* sp.) y antracnosis (*Colletotrichum theae-sinensis*);
- Enfermedades del tabaco: mancha marrón (*Alternaria longipes*), oídio (*Erysiphe cichoracearum*), antracnosis
- 55 (*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*);
- Enfermedades de la rosa: mancha negra (*Diplocarpon rosae*) y oídio (*Sphaerotheca pannosa*);
- 60 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*);
- Enfermedades de diversos grupos: moho gris (*Botrytis cinerea*) y podredumbre por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*);
- 65 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

Enfermedades del plátano: enfermedad de Sigatoka (*Mycosphaerella fijiensis*, *Mycosphaerella musicola*).

Hemiptera:

- 5 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*);
 10 Pentatomidae (por ejemplo, *Nezara antennata*, *Riptortus clavatus*, *Leptocoris chinensis*, *Eysarcoris parvus*,
Halyomorpha mista o *Lygus lineolaris*);
 Aleyrodidae (por ejemplo, *Trialeurodes vaporariorum* o *Bemisia argentifolii*);
 Coccoidea (por ejemplo, *Aonidiella aurantii*, *Comstockaspis perniciosus*, *Unaspis citri*, *Ceroplastes rubens* o *Icerya*
purchasi);
 15 Tingidae;
 Psyllidae;

chinchas (*Cimex lectularius*) y similares;

20 Lepidoptera:

- Pyrilidae (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*,
 25 *Agrotis ipsilon*, *Plusia nigrisigna*, *Trichoplusia* spp., *Heliothis* spp o *Helicoverpa* spp.);
 Pieridae (por ejemplo, *Pieris rapae*);
 Tortricidae (por ejemplo, *Adoxophyes* spp., *Grapholita molesta*, *Cydia pomonella*, *Leguminivora glycinivorella*,
Matsumuraesia azukivora, *Adoxophyes orana fasciata*, *Adoxophyes* sp., *Homona magnanima*, *Archips*
fuscocupreanus, *Cydia pomonella*);
 30 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.);
 Yponomeutidae (por ejemplo, *Plutella xylostella*);
 Gelechiidae (por ejemplo, *Pectinophora gossypiella* o *Phthorimaea operculella*);
 35 Arctiidae (por ejemplo, *Hyphantria cunea*);
 Tineidae (por ejemplo, *Tinea translucens* o *Tineola bisselliella*); y otros;

Thysanoptera:

- 40 Thysanoptera (por ejemplo, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Scirtothrips dorsalis*, *Thrips tabaci*,
Frankliniella intonsa, *Frankliniella fusca*);

Diptera:

- 45 *Musca domestica*, *Culex pipiens pallens*, *Tabanus trigonus*, *Hylemya antiqua*, *Hylemya platura*, *Anopheles*
sinensis, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Chlorops oryzae*, *Dacus cucurbitae*, *Ceratitis capitata*, *Liriomyza*
trifolii y otros;

Coleoptera:

- 50 *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*, *Agrotis* spp., *Lasioderma*
serricorne, *Anthrenus verbasci*, *Tribolium castaneum*, *Lyctus brunneus*, *Anoplophora malasiaca*, *Tomicus*
 55 *piniperda*) y otros;

Orthoptera:

- 60 *Locusta migratoria*, *Gryllotalpa africana*, *Oxya yezeensis*, *Oxya japonica* y otros;

Hymenoptera:

Athalia rosae, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp. y otros;

65 Nemátodos:

Aphelenchoides besseyi, *Nothotylenchus acris*, *Heterodera glycines*, *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus*, *Nacobbus aberrans* y otros;

Blattariae:

5

Blattella germanica, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Blatta orientalis* y otros;

Acarina:

10

Tetranychidae (por ejemplo, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri* o *Oligonychus* spp.);
Eriophyidae (por ejemplo, *Aculops pelekassi*);
Tarsonemidae (por ejemplo, *Polyphagotarsonemus latus*); Tenuipalpidae;
Tuckerellidae;

15

Acaridae (por ejemplo, *Tyrophagus putrescentiae*);
Pyroglyphidae (por ejemplo, *Dermatophagoides farinae* o *Dermatophagoides pteromyssus*);
Cheyletidae (por ejemplo, *Cheyletus eruditus*, *Cheyletus malaccensis* o *Cheyletus moorei*);
Dermanyssidae;
y otros.

20

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*), *Dermatophagoides* spp., *Ornithonyssus sylviae*, *Sarcoptes* spp. (por ejemplo, *Sarcoptes scabiei*), *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Demodex* spp., *Eutrombicula* spp., *Ades* spp. (por ejemplo, *Aedes albopictus*), *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp.,

25

30

Haematobia spp., *Tabanus* spp., *Simulium* spp., *Triatoma* spp., *Phthiraptera* (por ejemplo, *Damalinea* 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.

35

Ejemplos

40

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.

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.

45

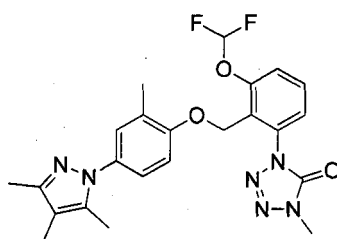
Ejemplo de la preparación 1

50

Una mezcla de 1-(2-bromometil-3-difluorometoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 1) 0,30 g, 0,26 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 20), 0,21 g de carbonato de potasio y 10 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante seis 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 0,31 g de 1-{3-difluorometoxi-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 1").

55

Presente compuesto 1

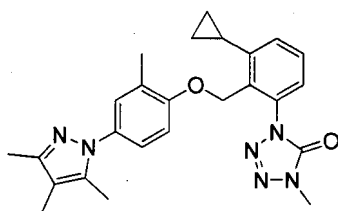


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,56 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,39 (2H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,14 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,11-7,06 (1H, m), 6,91-6,87 (1H, m), 6,59 (1H, t, $J = 72,8$ Hz), 5,27 (2H, s), 3,62 (3H, d, $J = 0,5$ Hz), 2,22 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,96 (3H, s).

5 Ejemplo de Preparación 2

Una mezcla de 0,50 g de 1-(2-bromometil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 2), 0,36 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 20), 0,29 g de carbonato de potasio y 15 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante siete 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 0,51 g de 1-{3-ciclopropil-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 2").

15 Presente compuesto 2

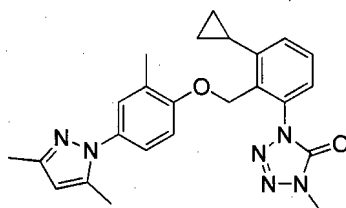


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,28 (2H, d, $J = 8,3$ Hz), 7,15 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,11 (1H, dd, $J = 8,5$, 2,4 Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,13-2,09 (4H, m), 1,97 (3H, s), 1,02-0,97 (2H, m), 0,76 (2H, c, $J = 5,4$ Hz).

Ejemplo de Preparación 3

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3,5-dimetil-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-ciclopropil-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 3").

30 Presente compuesto 3

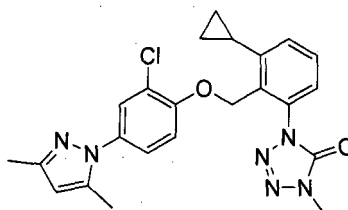


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,28 (2H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,17 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,14 (1H, dd, $J = 8,5$, 2,7 Hz), 6,91 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,95 (1H, s), 5,28 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,14-2,08 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 4

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 17) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 4").

Presente compuesto 4

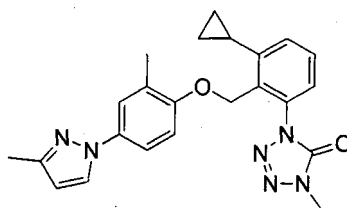


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,46-7,41 (2H, m), 7,30 (2H, t, $J = 6,8$ Hz), 7,23 (1H, dd, $J = 8,7, 2,6$ Hz), 6,98 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 5,96 (1H, s), 5,44 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,20-2,12 (1H, m), 1,04-0,99 (2H, m), 0,79-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 5

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 22) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 5").

15 Presente compuesto 5

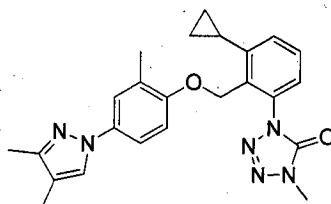


- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,69 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,46-7,40 (2H, m), 7,34 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 7,28 (1H, s), 7,26 (1H, s), 6,89 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,20 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,15-2,09 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 6

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3,4-dimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 23) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 6").

30 Presente compuesto 6

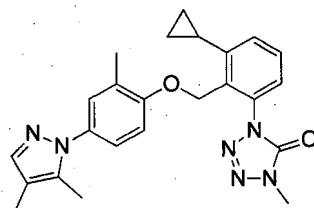


- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,52 (1H, s), 7,43 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,38 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,31-7,25 (3H, m), 6,88 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,27 (2H, s), 3,60 (3H, s), 2,27 (3H, s), 2,15-2,10 (4H, m), 2,06 (3H, s), 1,02-0,97 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 7

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 16) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 7").

Presente compuesto 10

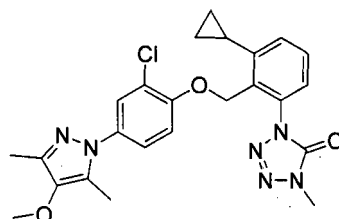


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,40 (1H, s), 7,29 (1H, s), 7,27-7,26 (1H, m), 7,18-7,13 (2H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,29 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,15-2,10 (4H, m), 2,05 (3H, s), 1,03-0,98 (2H, m), 0,80-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 11

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 18) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 11").

Presente compuesto 11

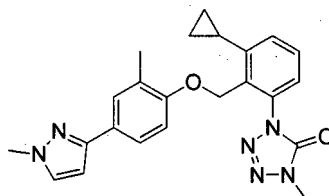


- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,50-7,44 (2H, m), 7,36-7,31 (2H, m), 7,27-7,23 (1H, m), 7,01 (1H, d, $J = 8,9$ Hz), 5,47 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,70 (3H, s), 2,31 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,22-2,17 (1H, m), 1,08-1,03 (2H, m), 0,82-0,78 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 12

- 25 Una mezcla de 0,30 g de 1-(2-bromometil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona, 0,18 g de 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 29), 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-ciclopropil-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 12").

Presente compuesto 12



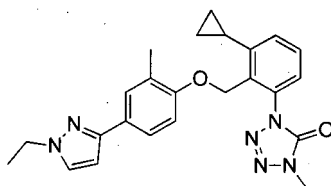
- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,57-7,56 (1H, m), 7,53 (1H, dd, $J = 8,3, 2,2$ Hz), 7,43 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,34 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,29-7,25 (2H, m), 6,90 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,45 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,15-2,11 (4H, m), 1,01-0,96 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 13

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-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-ciclopropil-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 13").

Presente compuesto 13

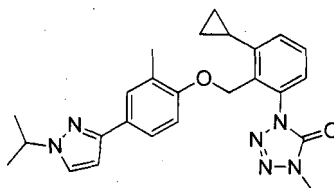


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,58-7,56 (1H, m), 7,55-7,51 (1H, m), 7,43 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,38 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,30-7,25 (2H, m), 6,90 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,45 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 5,28 (2H, s), 4,20 (2H, c, $J = 7,3$ Hz), 3,60 (3H, s), 2,16-2,10 (4H, m), 1,52 (3H, t, $J = 7,2$ Hz), 1,02-0,96 (2H, m), 0,81-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 14

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(1-isopropil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 31) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(1-isopropil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 14").

Presente compuesto 14

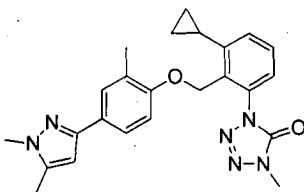


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,58-7,56 (1H, m), 7,54 (1H, dd, $J = 8,7, 1,9$ Hz), 7,43-7,40 (2H, m), 7,30-7,25 (2H, m), 6,89 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,44 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,28 (2H, s), 4,57-4,51 (1H, m), 3,60 (3H, s), 2,16-2,10 (4H, m), 1,53 (6H, d, $J = 6,8$ Hz), 1,03-0,96 (2H, m), 0,81-0,73 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 15

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 32) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 15").

Presente compuesto 15

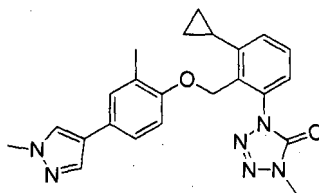


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,53 (1H, d, $J = 1,5$ Hz), 7,49 (1H, dd, $J = 8,3, 2,0$ Hz), 7,42 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,27 (2H, dd, $J = 8,8, 4,9$ Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,23 (1H, s), 5,28 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,15-2,10 (4H, m), 1,02-0,96 (2H, m), 0,79-0,73 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 16

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 28) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-4-il)-fenoxy]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 16").

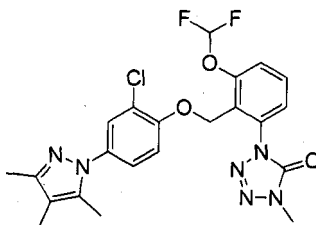
Presente compuesto 16



- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,67 (1H, s), 7,51 (1H, s), 7,43 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,28-7,21 (4H, m), 6,87 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 5,26 (2H, s), 3,92 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,16-2,10 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 17

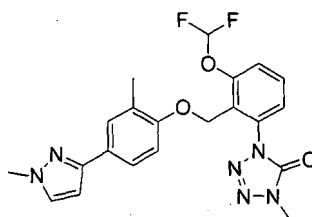
- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 16) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-difluorometoxi-2-[2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 17").
- 15 Presente compuesto 17



- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,56 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 7,44 (1H, dd, $J = 8,1, 0,8$ Hz), 7,40 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,36 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 7,21 (1H, dd, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 7,00-6,96 (1H, m), 6,63 (1H, t, $J = 73,0$ Hz), 5,41 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,18 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 18

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 29) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-difluorometoxi-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 18").
- 30 Presente compuesto 18

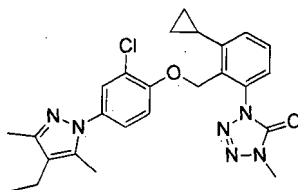


- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,57-7,50 (3H, m), 7,41-7,33 (3H, m), 6,87 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,58 (1H, t, $J = 73,2$ Hz), 6,44 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,28 (2H, d, $J = 3,9$ Hz), 3,93 (3H, s), 3,57 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 19

- 40 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 19) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-cloro-4-(4-etil-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 19").

Presente compuesto 19



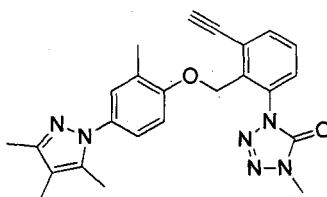
- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,41 (2H, m), 7,31-7,28 (2H, m), 7,21 (1H, dd, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 6,97 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,43 (2H, s), 3,66 (3H, s), 2,40 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,24 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,18-2,14 (1H, m), 1,10 (3H, t, $J = 7,6$ Hz), 1,04-0,99 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 20

- 10 Una mezcla de 0,2 g de 1-{2-(2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil)-3-trimetilsililetinil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 71), 0,7 g de carbonato de potasio, 5 ml de cloroformo y 5 ml de metanol, se agitó a temperatura ambiente durante tres horas, y después la mezcla resultante se calentó a 60 °C y se agitó 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
- 15 0,07 g de 1-{3-etinil-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 20").

Presente compuesto 20

20



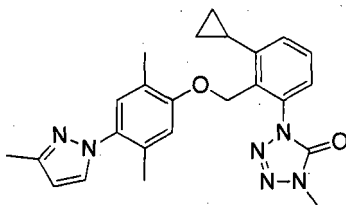
- 25 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,72 (1H, dd, $J = 5,8, 3,4$ Hz), 7,49 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,48 (1H, s), 7,13 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,09 (1H, dd, $J = 8,6, 2,5$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,45 (2H, s), 3,61 (3H, s), 3,38 (1H, s), 2,22 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,02 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 21

- 30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 73) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 21)").

Presente compuesto 21

35



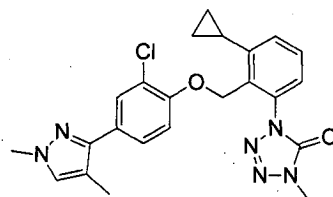
- 40 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,40 (1H, d, $J = 2,1$ Hz), 7,28 (1H, s), 7,26 (1H, s), 7,06 (1H, s), 6,74 (1H, s), 6,17 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 5,27 (2H, s), 3,65 (3H, s), 2,35 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,14-2,10 (1H, m), 2,04 (3H, s), 1,02-0,98 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 22

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(1,4-dimetil-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-ciclopropil-2-[2-cloro-4-(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 22").

Presente compuesto 22

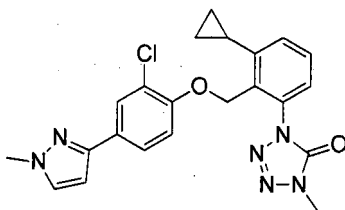


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,66 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,47 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,42 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,29 (2H, t, $J = 8,1$ Hz), 7,17 (1H, s), 6,97 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,43 (2H, s), 3,87 (3H, s), 3,65 (3H, s), 2,19-2,15 (4H, m), 1,04-0,99 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 23

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-cloro-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 54) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-cloro-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 23").

Presente compuesto 23

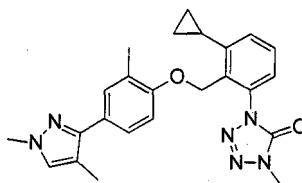


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,76 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,58 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,42 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,35 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,29 (2H, t, $J = 7,8$ Hz), 6,94 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,43 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 5,43 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,64 (3H, s), 2,21-2,14 (1H, m), 1,04-0,99 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 24

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-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-ciclopropil-2-[4-(1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 24").

Presente compuesto 24

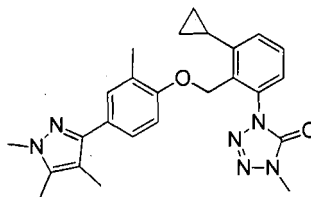


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,40 (3H, m), 7,28-7,26 (2H, m), 7,17 (1H, s), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,29 (2H, s), 3,87 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,20 (3H, s), 2,16-2,10 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 25

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 66) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(1,4,5-trimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 25").

Presente compuesto 25

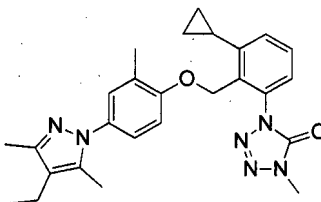


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,45-7,40 (2H, m), 7,37 (1H, dd, $J = 8,4, 1,7$ Hz), 7,28-7,26 (2H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,16-2,11 (4H, m), 2,10 (3H, s), 1,01-0,96 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 26

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-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-ciclopropil-2-[4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-2-metil-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 26").

- 15 Presente compuesto 26

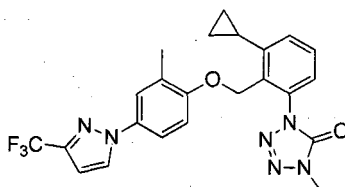


- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,28-7,26 (2H, m), 7,16 (1H, d, $J = 2,5$ Hz), 7,12 (1H, dd, $J = 8,5, 2,5$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,41 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,25 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,13-2,10 (4H, m), 1,11 (3H, t, $J = 7,6$ Hz), 1,02-0,97 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 27

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 75) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 27").

- 30 Presente compuesto 27

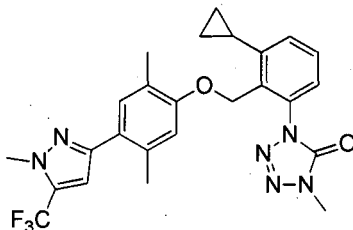


- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,83 (1H, dd, $J = 2,5, 0,9$ Hz), 7,47-7,43 (2H, m), 7,41 (1H, dd, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 7,29 (1H, s), 7,27 (1H, s), 6,93 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 6,68 (1H, d, $J = 2,5$ Hz), 5,31 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,15-2,09 (4H, m), 1,03-0,98 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 28

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 86) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2,5-dimetil-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 28").

Presente compuesto 28

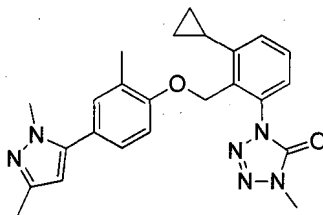


- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,28-7,26 (3H, m), 6,75 (1H, s), 6,68 (1H, s), 5,27 (2H, s), 4,02 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,42 (3H, s), 2,17-2,10 (1H, m), 2,06 (3H, s), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 29

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 69) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[3-ciclopropil-2-metil-4-(1,3-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 29").

- 15 Presente compuesto 29

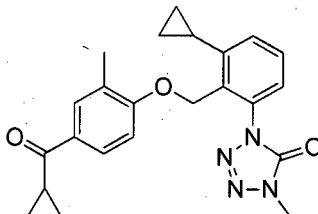


- 20 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,29 (1H, s), 7,27 (1H, s), 7,17 (1H, dd, J = 8,2, 2,3 Hz), 7,14-7,13 (1H, m), 6,94 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,01 (1H, s), 5,29 (2H, s), 3,80 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,18-2,10 (4H, m), 1,03-0,98 (2H, m), 0,80-0,76 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 30

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-metanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 88) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-[3-ciclopropil-2-(4-ciclopropanocarbonil-2-metil-fenoximetil)-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 30").

- 30 Presente compuesto 30

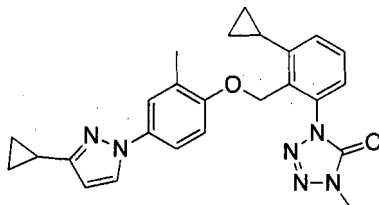


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,88 (1H, dd, J = 8,70, 2,18 Hz), 7,82-7,80 (1H, m), 7,45 (1H, t, J = 7,90 Hz), 7,31-7,27 (2H, m), 6,94 (1H, d, J = 8,70 Hz), 5,34 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,65-2,61 (1H, m), 2,13-2,07 (4H, m), 1,22-1,16 (2H, m), 1,02-0,97 (4H, m), 0,80-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 31

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 2-metil-4-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 68) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(3-ciclopropil-pirazol-1-il)-fenoxtimetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 31").

Presente compuesto 31

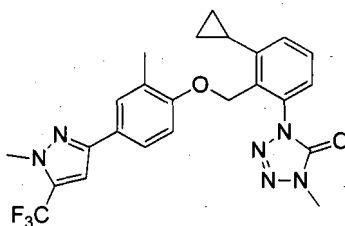


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,67-7,66 (1H, m), 7,46-7,40 (2H, m), 7,34 (1H, dd, $J = 8,8, 2,9$ Hz), 7,28 (1H, s), 6,89 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 6,05 (1H, d, $J = 2,3$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,14-2,10 (4H, m), 2,06-2,01 (2H, m), 1,02-0,93 (4H, m), 0,80-0,74 (4H, m).

Ejemplo de Preparación 32

- 10 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 79) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 32").

- 15 Presente compuesto 32

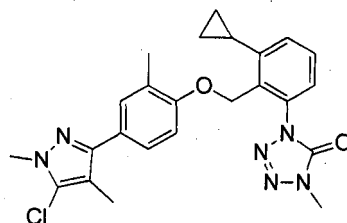


- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,53-7,50 (2H, m), 7,43 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,27 (2H, d, $J = 8,0$ Hz), 6,91 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,80 (1H, s), 5,29 (2H, s), 4,01 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,15-2,09 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 33

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 109) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 33").

- 30 Presente compuesto 33

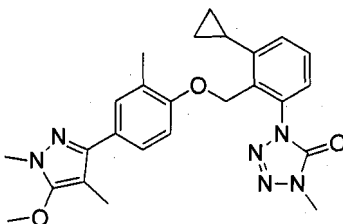


- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,43 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,40 (1H, d, $J = 1,8$ Hz), 7,38 (1H, dd, $J = 8,4, 2,2$ Hz), 7,28 (2H, s), 6,93 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 5,29 (2H, s), 3,85 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,14-2,12 (4H, m), 1,01-0,97 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 34

- 40 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 99) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(5-metoxi-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 34").

Presente compuesto 34

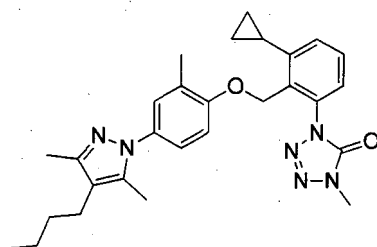


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,41 (1H, d, $J = 1,4$ Hz), 7,37 (1H, dd, $J = 8,2, 2,1$ Hz), 7,28 (2H, d, $J = 8,0$ Hz), 6,93 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,30 (2H, s), 3,95 (3H, s), 3,72 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,16-2,13 (4H, m), 2,12 (3H, s), 1,03-0,98 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 35

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(4-butil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-metil-fenol. (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 108) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(4-butil-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 35").

Presente compuesto 35

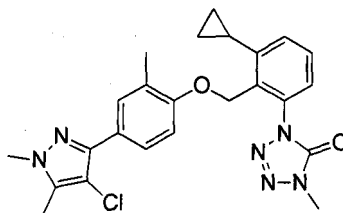


- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,28 (2H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,16 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,12 (1H, dd, $J = 8,6, 2,5$ Hz), 6,90 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 5,28 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,38 (2H, t, $J = 7,5$ Hz), 2,24 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,14-2,08 (4H, m), 1,48-1,44 (2H, m), 1,39-1,33 (2H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,94 (3H, t, $J = 7,2$ Hz), 0,79-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 36

- 25 Una mezcla de 0,37 g de 1-{3-ciclopropil-2-(2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil)-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 15) (Presente compuesto 15), 0,12 g de N-clorosuccinimida y 5 ml de cloroformo se agitó a temperatura ambiente durante doce horas. La mezcla resultante se extrajo con cloroformo y se lavó con una 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 0,13 g de 1-{3-ciclopropil-2-(2-metil-4-(4-cloro-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 36").

Presente compuesto 36

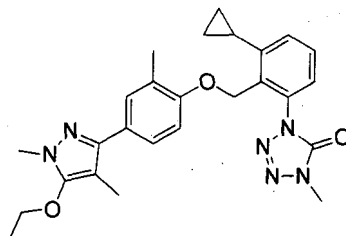


- 40 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,66 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,60 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,43 (1H, t, $J = 7,8$ Hz), 7,28-7,26 (2H, m), 6,93 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,29 (2H, s), 3,82 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,28 (3H, s), 2,16-2,09 (4H, m), 1,01-0,97 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 37

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 102) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(5-etoxi-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 37").

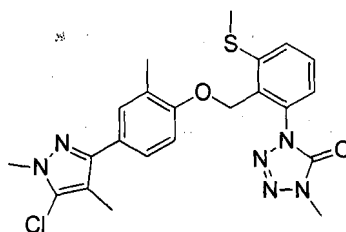
Presente compuesto 37



RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,41 (2H, m), 7,37 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,3 Hz), 7,27-7,26 (2H, m), 6,91 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,28 (2H, s), 4,17-4,12 (2H, m), 3,70 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,14-2,10 (7H, m), 1,41 (3H, t, *J* = 7,1 Hz), 1,00-0,96 (2H, m), 0,78-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 38

Una mezcla de 1,5 g de 1-(2-bromometil-3-metiltiofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 13), 1 g de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol, 0,9 g de carbonato de potasio y 20 ml de acetonitrilo se agitó con calentamiento a reflujo durante cinco horas. La mezcla de reacción se concentró y el residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 2,1 g de 1-{3-metiltio-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 38").

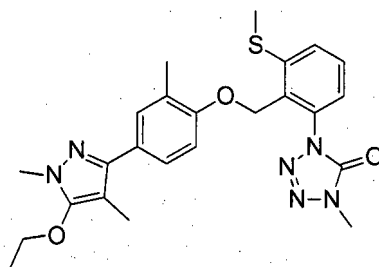


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,52-7,50 (2H, m), 7,40 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,39-7,36 (1H, m), 7,29-7,27 (1H, m), 6,93 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 5,27 (2H, s), 3,86 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 39

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 38 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102) en lugar de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol dio 1-{3-metiltio-2-[2-metil-4-(5-etoxi-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 39").

Presente compuesto 39

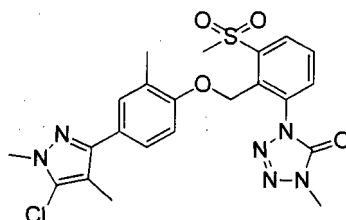


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,50-7,46 (2H, m), 7,40 (1H, d, $J = 1,6$ Hz), 7,35 (1H, dd, $J = 8,4, 2,2$ Hz), 7,27-7,25 (1H, m), 6,90 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,25 (2H, s), 4,14 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,70 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,52 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,09 (3H, s), 1,41 (3H, t, $J = 7,0$ Hz).

5 Ejemplos de Preparación 40 y 41

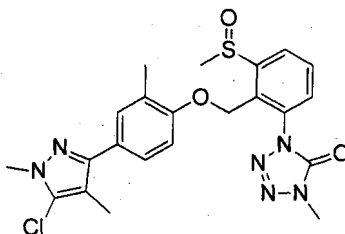
A temperatura ambiente, una mezcla de 1 g de 1-{3-metiltio-2-[2-metil-4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación 39) (Presente compuesto 40), 0,55 g de ácido m-cloroperoxibenzoico y 15 ml de cloroformo, se agitó durante cuatro horas. La mezcla de reacción se extrajo con cloroformo. La capa orgánica se lavó con agua y una solución acuosa de tiosulfato de sodio y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La mezcla resultante se concentró. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 0,12 g de 1-{2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metanosulfonyl-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 40") y 0,95 g de 1-{2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metanosulfinil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 41").

1-{2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metanosulfonyl-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona
Presente compuesto 40



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,39 (1H, dd, $J = 7,0, 2,4$ Hz), 7,81-7,75 (2H, m), 7,41-7,38 (2H, m), 6,99 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 5,63 (2H, s), 3,86 (3H, s), 3,56 (3H, s), 3,19 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,07 (3H, s).

1-{2-[4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenoximetil]-3-metanosulfinil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona
(en lo sucesivo en el presente documento, denominado como Presente compuesto 41)

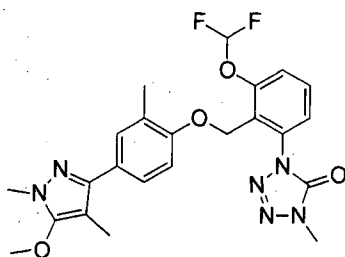


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,33 (1H, dd, $J = 8,0, 1,1$ Hz), 7,82 (1H, t, $J = 8,0$ Hz), 7,63 (1H, dd, $J = 7,9, 1,3$ Hz), 7,42 (1H, dd, $J = 2,1, 0,7$ Hz), 7,39-7,36 (1H, m), 6,87 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,27 (1H, d, $J = 11,9$ Hz), 5,08 (1H, d, $J = 11,9$ Hz), 3,85 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,81 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,12 (3H, s).

35 Ejemplo de Preparación 42

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 99) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-difluorometoxi-2-[2-metil-4-(5-metoxi-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 42").

Presente compuesto 42

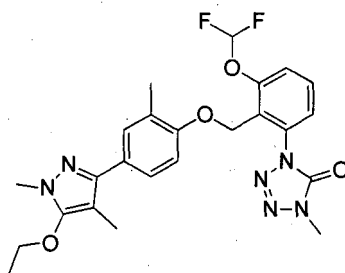


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,54 (1H, t, $J = 8,3$ Hz), 7,40-7,36 (3H, m), 7,34 (1H, dd, $J = 8,4$, 2,3 Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 6,57 (1H, t, $J = 73,2$ Hz), 5,27 (2H, s), 3,93 (3H, s), 3,70 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,12 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 43

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 102) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-difluorometoxi-2-[2-metil-4-(5-etoxi-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]metil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 43").

- 15 Presente compuesto 43



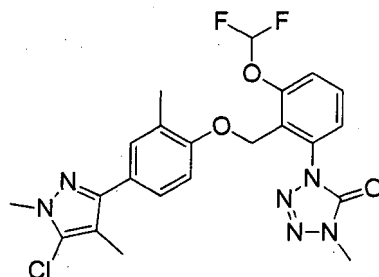
- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,54 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,40-7,34 (4H, m), 6,88 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,57 (1H, t, $J = 73,2$ Hz), 5,27 (2H, s), 4,14 (2H, c, $J = 7,1$ Hz), 3,70 (3H, s), 3,58 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,41 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

Ejemplo de Preparación 44

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 109) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-difluorometoxi-2-[2-metil-4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoxy]metil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 44").

Presente compuesto 44

30



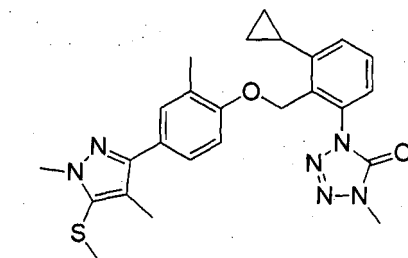
- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,55 (1H, t, $J = 8,2$ Hz), 7,40-7,34 (4H, m), 6,89 (1H, d, $J = 8,4$ Hz), 6,58 (1H, t, $J = 73,1$ Hz), 5,27 (2H, s), 3,84 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,14 (3H, s), 2,03 (3H, s)

Ejemplo de Preparación 45

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1H-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

(descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 105) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-ciclopropil-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 45").

5 Presente compuesto 45

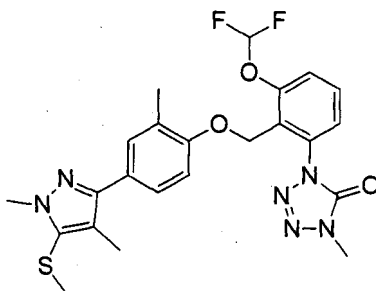


10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45-7,39 (3H, m), 7,28-7,26 (2H, m), 6,93 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,29 (2H, s), 3,99 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,27 (6H, s), 2,16-2,10 (4H, m), 1,00-0,97 (2H, m), 0,78-0,76 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 46

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 1 usando 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 105) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{3-difluorometoxi-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 46").

20 Presente compuesto 46

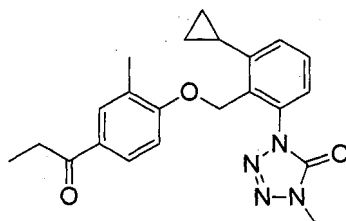


25 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,55 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,41-7,37 (4H, m), 6,89 (1H, d, J = 8,4 Hz), 6,58 (1H, t, J = 73,2 Hz), 5,27 (2H, s), 3,98 (3H, s), 3,59 (3H, s), 2,26 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,03 (3H, s).

Ejemplo de Preparación 47

30 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-[3-Ciclopropil-2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-fenil]-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 47").

Presente compuesto 47



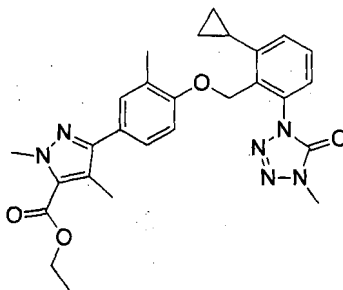
35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, J = 8,5, 2,2 Hz), 7,76 (1H, dd, J = 2,2, 0,8 Hz), 7,45 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,29 (2H, d, J = 7,9 Hz), 6,91 (1H, d, J = 8,6 Hz), 5,33 (2H, s), 3,61 (3H, s), 2,95 (2H, c, J = 7,3 Hz), 2,13-2,07 (4H, m), 1,21 (3H, t, J = 7,2 Hz), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

40

Ejemplo de Preparación 48

A temperatura ambiente, a una mezcla de 5,5 g de éster etílico del ácido 4-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3-metil-2,4-dioxo-butírico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 115), 100 ml de tetrahidrofrano se le añadieron 0,56 g de hidrato de hidrazina uno y la mezcla resultante se agitó durante doce horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar 5 g del producto en bruto de éster etílico del ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-4-metil-2H-pirazol-3-carboxílico. A continuación, la mezcla de 5 g del producto en bruto del éster etílico del ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-4-metil-2H-pirazol-3-carboxílico anteriormente mencionado, 70 ml de tolueno y 3,8 g de sulfato de dimetilo se agitó a 100 °C durante tres horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua 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 1,4 g de éster etílico del ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carboxílico (en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 48").

Presente compuesto 48

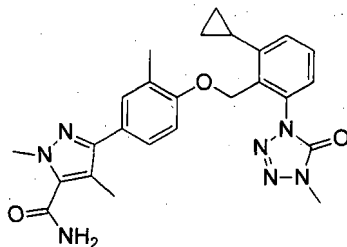


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,38-7,31 (2H, m), 7,28 (1H, s), 7,20 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 6,94 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 5,29 (2H, s), 4,40 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 4,17 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,17-2,10 (4H, m), 1,42 (3H, t, $J = 7,2$ Hz), 1,05-0,97 (2H, m), 0,79-0,72 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 49

A temperatura ambiente, a una solución de 50 ml al 28 % de amoníaco se le añadieron 1,3 g de cloruro de 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carbonilo (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 117). La mezcla se agitó durante doce horas y se concentró a presión reducida y se añadió una solución de 10 ml al 10 % de ácido clorhídrico. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua y se secaron a presión reducida para dar 0,8 g de 1-{3-ciclopropil-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 49").

Presente compuesto 49



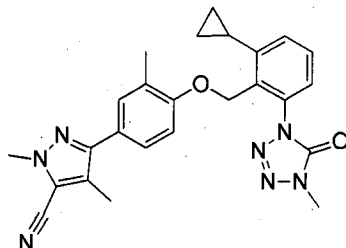
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,33-7,27 (4H, m), 6,94 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 5,76 (2H, s a), 5,29 (2H, s), 4,13 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,17-2,10 (4H, m), 1,03-0,97 (2H, m), 0,79-0,73 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 50

A temperatura ambiente, a la mezcla de 0,8 g de 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(5-aminocarbonil-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 49) y 10 ml de piridina, se le añadieron 0,58 g de oxiclورو de fósforo y se agitó durante dos horas. A la mezcla resultante se le añadieron 40 ml de agua y los precipitados se filtraron. Los precipitados se lavaron con agua y se secaron a presión reducida para dar 0,6 g de

1-{3-ciclopropil-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 50").

Presente compuesto 50

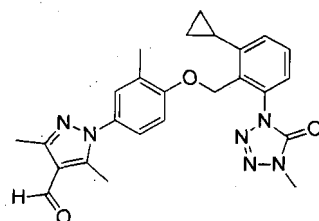


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,44 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,40-7,36 (2H, m), 7,28 (2H, d, J = 7,9 Hz), 6,94 (1H, d, J = 8,4 Hz), 5,29 (2H, s), 4,03 (3H, s), 3,62 (3H, s), 2,34 (3H, s), 2,16-2,09 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 51

A temperatura ambiente, una mezcla de 20 ml de N,N-dimetilformamida y 0,85 ml de oxiclورو de fósforo, se agitó durante una hora. A la mezcla anteriormente mencionada, se le añadieron 2,0 g de 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 3) y se agitó a 100 °C durante tres horas. A temperatura ambiente, a la mezcla resultante se le añadieron 10 ml de agua. La mezcla 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 1,7 g de 1-{3-ciclopropil-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 51").

Presente compuesto 51

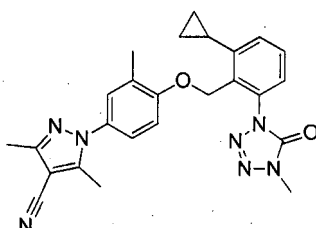


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,98 (1H, s), 7,44 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,28 (2H, d, J = 7,8 Hz), 7,15-7,12 (2H, m), 6,94 (1H, d, J = 8,2 Hz), 5,29 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,49 (6H, s), 2,12-2,09 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,78-0,74 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 52

A temperatura ambiente, a la mezcla de 1,5 g de 1-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3,5-dimetil-1*H*-pirazol-4-carbaldehído oxima (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 118) y N,N-dimetilformamida, se le añadieron 0,6 g de 2,4,6-tricloro-[1,3,5]triazina y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante tres horas. A la mezcla resultante se le añadieron 100 ml de agua y los precipitados se filtraron. Los precipitados se lavaron con agua y se secaron a presión reducida para dar 1,0 g de 1-{3-ciclopropil-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 52").

Presente compuesto 52



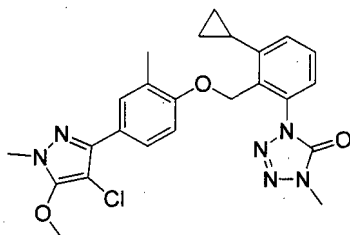
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,45 (1H, t, J = 7,9 Hz), 7,28 (2H, d, J = 7,9 Hz), 7,13-7,11 (2H, m), 6,93 (1H, d, J = 8,2 Hz), 5,30

(2H, s), 3,64 (3H, s), 2,39 (3H, s), 2,39 (3H, s), 2,12-2,08 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

Ejemplo de Preparación 53

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación 2 usando 4-(4-Cloro-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metileno (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 112) en lugar de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol dio 1-{2-[4-(4-Cloro-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenoximetil]-3-ciclopropil-fenil}-4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-ona(en lo sucesivo en el presente documento, denominado como "Presente compuesto 53").

- 10 Presente compuesto 53



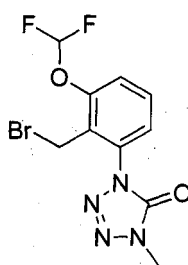
- 15 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,64-7,61 (1H, m), 7,58-7,57 (1H, m), 7,44 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,30-7,27 (2H, m), 6,94 (1H, d, J = 8,5 Hz), 5,30 (2H, s), 4,12 (3H, s), 3,71 (3H, s), 3,61 (3H, s), 2,14-2,11 (4H, m), 1,01-0,97 (2H, m), 0,79-0,76 (2H, m).

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.

- 20 Ejemplo de Preparación de Referencia 1

- 25 A una mezcla de 1,0 g de 1-(2-metil-3-difluorometoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 2), 0,19 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 0,80 g de N-bromosuccinimida y 50 ml de clorobenceno, se agitó con calentamiento a reflujo durante ocho horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a las soluciones de reacción se les 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 1,1 g de 1-(2-bromometil-3-difluorometoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

- 30 1-(2-bromometil-3-difluorometoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 7,50 (1H, t, J = 8,2 Hz), 7,34 (2H, d, J = 8,2 Hz), 6,62 (1H, t, J = 72,8 Hz), 4,65 (2H, s), 3,76 (3H, d, J = 0,5 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 2

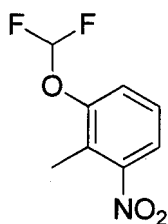
- 40 En enfriamiento con hielo, a una mezcla de 200 ml de N,N-dimetilformamida y 5,91 g de tricloruro de aluminio, se le añadieron 2,64 g de azida de sodio y la mezcla resultante se agitó durante una hora. Después, se añadieron a la misma 7,36 g de 1-difluorometoxi-3-isocianato-2-metilbenceno y la mezcla de reacción se calentó a 75 °C y se agitó durante cinco horas. La mezcla de reacción se enfrió y en enfriamiento con hielo a la mezcla de reacción se le añadieron 50 ml de agua enfriada con hielo, seguido de una adición de una mezcla de 4,1 g de nitrito de sodio y 100 ml de agua. La mezcla resultante se acidificó con ácido clorhídrico concentrado 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. A los residuos resultantes que contenían 1-(2-metil-3-difluorometoxifenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona, se les añadieron 100 ml de N,N-dimetilformamida, 7,66 g de carbonato de potasio, 9,32 g de sulfato de dimetilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante cuatro horas. Se añadieron a la misma 100 ml de agua, y la

mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo y 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 1,0 g de 1-(2-metil-3-difluorometoxifenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

Ejemplo de Preparación de Referencia 3

Una mezcla de 7,17 g de 2-metil-3-nitrofenol, 27 g de hidróxido de potasio, 25 g de bromodifluorometil-dimetil fosfonato, 100 ml de agua y 100 ml de acetonitrilo, se mezcló a temperatura ambiente durante veinticuatro 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 y después, se concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 7,50 g de 1-difluorometoxi-2-metil-3-nitrobenceno.

1-difluorometoxi-2-metil-3-nitrobenceno

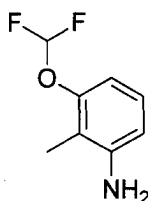


RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 7,74 (1H, dd, $J = 7,6, 1,8$ Hz), 7,40-7,32 (2H, m), 6,56 (1H, t, $J = 72,4$ Hz), 2,46 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 4

Una mezcla de 7,50 g del 1-difluorometoxi-2-metil-3-nitrobenceno anteriormente preparado (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 3), 0,8 g de paladio-carbono (paladio al 5 %) y 80 ml de etanol, se agitó a temperatura ambiente en atmósfera de hidrógeno durante ocho horas. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se concentró para dar 6,4 g de 3-difluorometoxi-2-metilanilina.

3-difluorometoxi-2-metilanilina

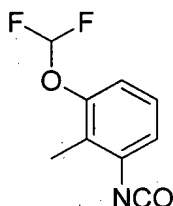


RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 6,99 (1H, t, $J = 8,1$ Hz), 6,55 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 6,51 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,46 (1H, td, $J = 74,4, 0,4$ Hz), 3,72 (2H, s a), 2,09 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 5

A temperatura ambiente, a una mezcla de 6,4 g de 3-difluorometoxi-2-metilanilina y 100 ml de tolueno, se le añadieron 5,48 g de trifosgeno y la mezcla resultante se agitó con calentamiento a reflujo durante una hora. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida para dar 7,36 g de 1-difluorometoxi-3-isocianato-2-metilbenceno.

1-difluorometoxi-3-isocianato-2-metilbenceno

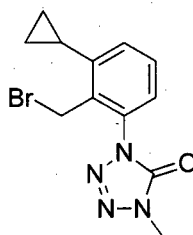


RMN ^1H (CDCl_3) δ 7,14 (1H, t, J = 8,1 Hz), 6,97 (2H, t, J = 8,5 Hz), 6,50 (1H, td, J = 73,6, 0,4 Hz), 2,27 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 6

- 5 Una mezcla de 26,0 g de 1-(2-metoximetil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 7), 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 dos horas. A la mezcla de reacción se le añadió solución salina saturada y la mezcla de reacción 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
- 10 30,8 g de 1-(2-bromometil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-bromometil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

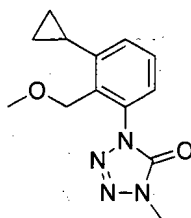


- 15 RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 7,38 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,26-7,22 (2H, m), 4,77 (2H, s), 3,75 (3H, s), 2,16-2,09 (1H, m), 1,10-1,06 (2H, m), 0,82-0,78 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 7

- 20 Una mezcla de 30,1 g de 1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 8), 12,9 g de ácido ciclopropilborónico, 46,2 g de fluoruro de cesio, 8,2 g de aducto [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) dicloruro de diclorometano y 680 ml de dioxano, se agitó a 90 °C durante cuatro horas. Después del enfriamiento de la mezcla de reacción, la mezcla de reacción se filtró y el filtrado se
- 25 concentró a presión reducida. El residuo resultante se sometió a una cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 26,0 g de 1-(2-metoximetil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metoximetil-3-ciclopropilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

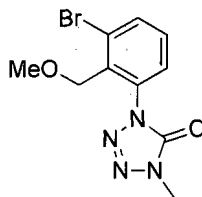


- 30 RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 7,36 (1H, t, J = 8,0 Hz), 7,20 (2H, d, J = 8,0 Hz), 4,64 (2H, s), 3,72 (3H, s), 3,24 (3H, s), 2,20-2,13 (1H, m), 1,04-1,00 (2H, m), 0,76-0,72 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 8

- Una mezcla de 45,0 g de 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona, 37,4 g de metóxido de sodio y 600 ml de tetrahidrofurano se agitó a temperatura ambiente 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.
- 40 La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. La mezcla resultante se concentró a presión reducida para dar 36,2 g de 1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metoximetil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



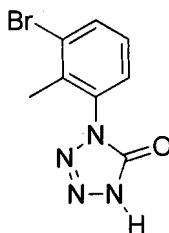
- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 3,23 (3H, s), 3,72 (3H, s), 4,67 (2H, s), 7,33 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,3 (1H, dd, J = 1,2, 8,1 Hz), 7,76 (1H, dd, J = 1,5, 7,8 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 9

- 10 Se añadieron 19,7 g de cloruro de aluminio anhidro a 220 ml de N,N-dimetilformamida en enfriamiento con hielo y la mezcla resultante se agitó durante quince minutos. Se añadieron a la misma azida de sodio 9,6 g y la mezcla resultante se agitó durante quince minutos. Después, se añadieron a la misma 30,3 g de 1-bromo-3-isocianato-2-metilbenceno y la mezcla resultante se calentó a 80 °C durante cinco horas. Después de un periodo de refrigeración,
- 15 las soluciones de reacción se añadieron a una mezcla de 33 g de nitrito de sodio, 2 l de agua y 500 g de 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 31,4 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

20



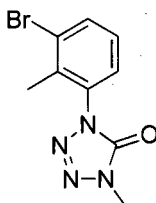
RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ (ppm): 2,22 (3H, s), 7,34 (1H, t, J = 7,2 Hz), 7,49 (1H, dd, J = 8,2, 1,1 Hz), 7,82 (1H, dd, J = 8,0, 1,0 Hz), 14,72 (1H, s).

25

Ejemplo de Preparación de Referencia 10

- A una mezcla de 31,40 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 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 resultante se elevó a temperatura ambiente y se agitó durante catorce horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla de reacción 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.
- 35 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.

1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



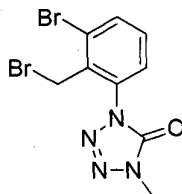
40

RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 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).

Ejemplo de Preparación de Referencia 11

Una mezcla de 8,47 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 10), 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 las soluciones de reacción se les 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

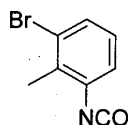


RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 3,76 (3H, s), 4,71 (2H, s), 7,34 (1H, t, J = 7,8 Hz), 7,38 (1H, dd, J = 8,0, 1,7 Hz), 7,77 (1H, dd, J = 7,8, 1,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 12

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

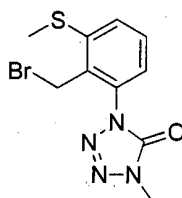


RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 2,42 (3H, s), 7,00 (1H, dt, J = 0,5, 8,0 Hz), 7,05 (1H, dd, J = 1,7, 8,0 Hz), 7,39 (1H, dd, J = 1,5, 7,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 13

A una mezcla de 1,50 g de 1-(2-metil-3-metilsulfanilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 15), 0,620 g de 1,1'-azobis(ciclohexano-1-carbonitrilo), 1,30 g de N-bromosuccinimida y 15 ml de clorobenceno, se agitó con calentamiento a reflujo durante cuatro horas. Después del enfriamiento de la mezcla, a las soluciones de reacción se les 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 0,400 g de 1-(2-bromometil-3-metiltiofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-bromometil-3-metiltiofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



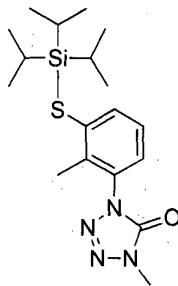
RMN ^1H (CDCl_3) δ (ppm): 2,57 (3H, s), 3,75 (3H, s), 4,69 (2H, s), 7,20 (1H, t, J = 4,5 Hz), 7,44 (2H, d, J = 4,5 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 14

En enfriamiento con hielo, a una mezcla de 4,99 g de triisopropilsilanotiol y 30 ml de tolueno, se le añadieron 0,63 g de hidruro de sodio al 60 % y la mezcla resultante se agitó durante treinta minutos. A la mezcla de reacción se le añadieron 2,82 g de 1-(2-metil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación

de Referencia 10) y 0,856 de aducto de [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]paladio (II) dicloruro de diclorometano. La mezcla de reacción se calentó a 90 °C y se agitó durante cuatro horas. Después del enfriamiento de la mezcla 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 3,64 g de 1-(2-metil-3-triisopropilsilanilsulfanilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-triisopropilsilanilsulfanilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

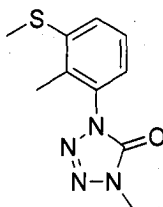


RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 1,09 (18H, d, J = 6,6 Hz), 1,31 (3H, c, J = 6,6 Hz), 2,45 (3H, s), 3,71 (3H, s), 7,16-7,21 (2H, m), 7,64 (1H, dd, J = 6,6, 2,7 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 15

Una mezcla de 3,63 g de 1-(2-metil-3-triisopropilsilanilsulfanilfenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona, 2,91 de fluoruro de cesio y 10 ml de N,N-dimetilformamida, se agitó a temperatura ambiente durante treinta minutos. A la mezcla resultante se le añadieron 2,72 g de yoduro de metilo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante tres horas. 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 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 1,65 g de 1-(2-metil-3-metiltiofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-(2-metil-3-metiltiofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

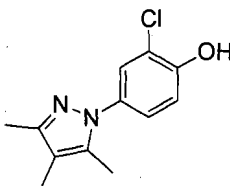


RMN ¹H (CDCl₃) δ(ppm): 2,22 (3H, s), 2,51 (3H, s), 3,72 (3H, s), 7,10-7,16 (1H, m), 7,36-7,29 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 16

Una mezcla de 3,0 g de sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol, 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.

2-cloro-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol



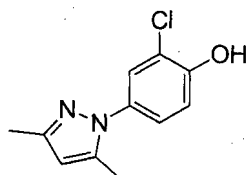
RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,43 (1H, d, J = 2,7 Hz), 7,24 (1H, dd, J = 8,7, 2,6 Hz), 7,07 (1H, d, J = 8,8 Hz), 2,15 (3H, s), 2,13 (3H, s), 1,92 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 17

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 16 usando acetilacetona en lugar de 3-metil-2,4-pentanediona dio 2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

5

2-cloro-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

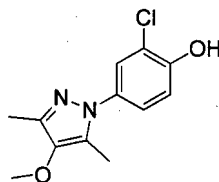


- 10 RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 8,66 (1H, s a), 7,46 (1H, d, $J = 2,6$ Hz), 7,26 (1H, dd, $J = 8,7, 2,6$ Hz), 7,10 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,07 (1H, s), 2,23 (3H, s), 2,14 (3H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 18

- 15 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-pentanediona, 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
- 20 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.

- 25 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-metoxi-pirazol-1-il)-fenol



EM+; 253

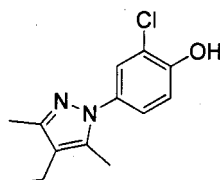
30

Ejemplo de Preparación de Referencia 19

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 19 usando 3-etil-2,4-pentanediona en lugar de 3-metil-2,4-pentanediona dio 2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol.

35

2-cloro-4-(3,5-dimetil-4-etil-pirazol-1-il)-fenol

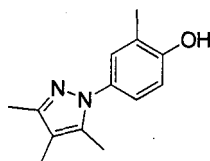


- 40 RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,45 (1H, s), 7,27-7,23 (1H, m), 7,11-7,07 (1H, m), 2,37 (2H, c, $J = 7,5$ Hz), 2,17 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,05 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 20

- 45 Una mezcla de 7,3 g de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 33), 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 a los residuos resultantes se les 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.

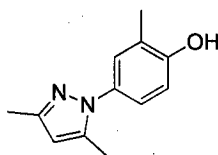


- 5 RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,22 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,14 (1H, dd, $J = 8,4, 2,3$ Hz), 6,91 (1H, d, $J = 8,3$ Hz), 2,22 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,97 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 21

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol en lugar de 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

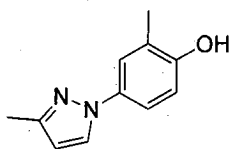


- 15 RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 9,68 (1H, s a), 7,19 (1H, s), 7,10 (1H, dd, $J = 8,8, 2,3$ Hz), 6,87 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,13 (1H, s), 2,20 (6H, s), 2,16 (3H, s).

- 20 Ejemplo de Preparación de Referencia 22

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 35) 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.

- 25 2-metil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol



- 30 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 23

- 35 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-fenil-3-metil-fenil)-3,4-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 36) 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

- 40
-

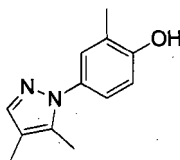
RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,94 (1H, s), 7,41 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,29 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,80 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 2,15 (6H, s), 1,99 (3H, s).

45

Ejemplo de Preparación de Referencia 24

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 36) 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.

2-metil-4-(4,5-dimetil-pirazol-1-il)-fenol

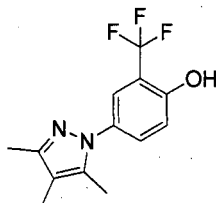


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,51 (1H, s), 7,17 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,08 (1H, dd, $J = 8,5, 2,4$ Hz), 6,88 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 2,16 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,01 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 25

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-trifluorometil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 38) 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

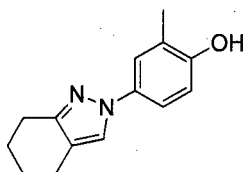


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 10,96 (1H, s), 7,59-7,55 (2H, m), 7,16-7,12 (1H, m), 2,16 (3H, s), 2,15 (3H, s), 1,94 (3H, s):

Ejemplo de Preparación de Referencia 26

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 2-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 37) 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

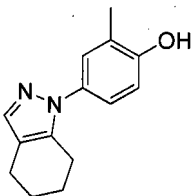


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,92 (1H, s), 7,43 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 7,31 (1H, dd, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 6,79 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 2,61 (2H, t, $J = 6,2$ Hz), 2,55-2,51 (2H, m), 2,16-2,13 (3H, m), 1,79-1,72 (2H, m), 1,72-1,65 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 27

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-1H-indazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 37) 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



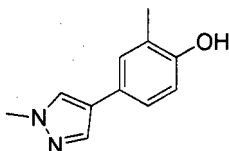
5 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,39 (1H, s), 7,20 (1H, s), 7,12-7,09 (1H, m), 6,84 (1H, d, J = 8,5 Hz), 2,64-2,59 (2H, m), 2,52-2,48 (2H, m), 2,16 (3H, s), 1,75-1,65 (4H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 28

10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 39) 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-1H-pirazol-4-il)-fenol

15



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).

20

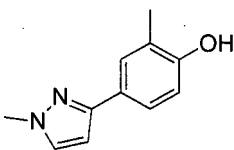
Ejemplo de Preparación de Referencia 29

Una mezcla de 2,9 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol, 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 a los residuos resultantes se les 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.

25

2-metil-4-(1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol

30



RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,30 (1H, s a), 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).

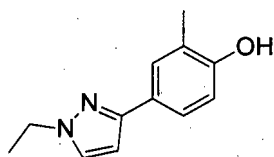
35

Ejemplo de Preparación de Referencia 30

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 29 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 41) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

40

2-metil-4-(1-etil-1H-pirazol-3-il)-fenol



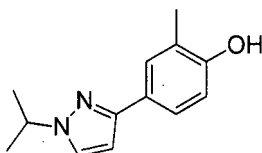
45

RMN ^1H (DMSO- D_6) 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).

5 Ejemplo de Preparación de Referencia 31

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 29 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 42) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(1-isopropil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

10



RMN ^1H (DMSO- D_6) 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).

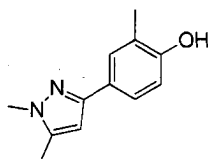
15

Ejemplo de Preparación de Referencia 32

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 29 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 43) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol dio 2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

20

2-metil-4-(1,5-dimetil-1H-pirazol-3-il)-fenol



25

RMN ^1H (DMSO- D_6) 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).

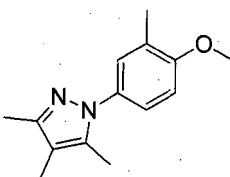
Ejemplo de Preparación de Referencia 33

30

Una mezcla de 10 g de ácido 4-metoxi-3-metil-fenilborónico, 7,3 g de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 49), 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-1H-pirazol.

35

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol



40

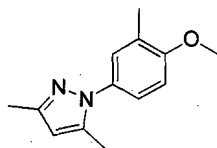
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,19-7,17 (1H, m), 7,14 (1H, dd, $J = 8,5$, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,86 (3H, s), 2,24 (6H, s), 2,16 (3H, s), 1,97 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 34

45

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 3,5-dimetil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol

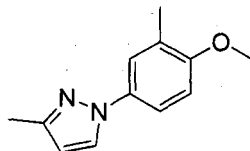


- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,20 (1H, d, $J = 2,0$ Hz), 7,16 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,84 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,95 (1H, s), 3,86 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 35

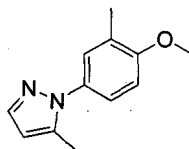
- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 3-metil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-metil-1H-pirazol y 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-metil-1H-pirazol



- 15 RMN ^1H (CDCl_3) 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).

- 20 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1H-pirazol

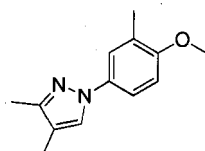


- 25 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,54 (1H, d, $J = 1,7$ Hz), 7,23-7,17 (2H, m), 6,87 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,17-6,15 (1H, m), 3,88 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 36

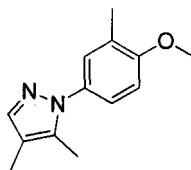
- 30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 3,4-dimetil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4-dimetil-1H-pirazol y 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5-dimetil-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,4-dimetil-1H-pirazol



- 35 RMN ^1H (CDCl_3) 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).

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5-dimetil-1H-pirazol



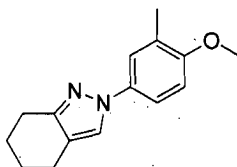
- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,41 (1H, s), 7,20-7,15 (2H, m), 6,86 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,87 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,05 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 37

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 4,5,6,7-tetrahidroindazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 2-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol y 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol.

2-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol

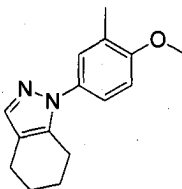
15



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).

20

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4,5,6,7-tetrahidro-2H-indazol

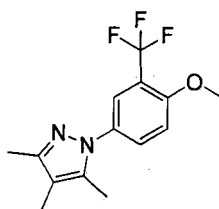


- 25 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,42 (1H, s), 7,29-7,25 (1H, m), 7,22 (1H, dd, $J = 8,5, 2,7$ Hz), 6,85 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,86 (3H, s), 2,66 (2H, t, $J = 5,2$ Hz), 2,58 (2H, t, $J = 5,2$ Hz), 2,25 (3H, s), 1,83-1,74 (4H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 38

- 30 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 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-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-3-trifluorometil-fenil)-3,4,5-trimetil-1H-pirazol



35

RMN ^1H (CDCl_3) 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).

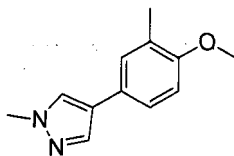
40 Ejemplo de Preparación de Referencia 39

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, 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-1*H*-pirazol.

5

4-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol



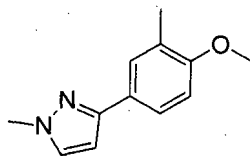
- 10 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,68 (1H, s), 7,52 (1H, s), 7,28-7,24 (2H, m), 6,82 (1H, d, J = 8,3 Hz), 3,93 (3H, s), 3,84 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 40

- 15 A temperatura ambiente, a una mezcla de 5,38 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 44) 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-1*H*-pirazol y 1,0 g de 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.

20

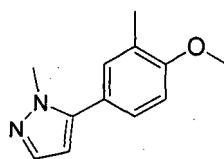
3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol



25

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).

- 30 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol

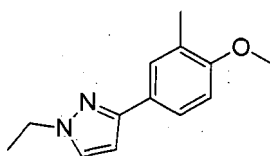


- 35 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,49 (1H, d, J = 1,7 Hz), 7,22-7,19 (2H, m), 6,89 (1H, d, J = 8,5 Hz), 6,24 (1H, d, J = 1,7 Hz), 3,88 (3H, s), 3,87 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 41

- 40 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 40 usando yoduro de etilo en lugar de yoduro de metilo dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1*H*-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-etil-1*H*-pirazol



45

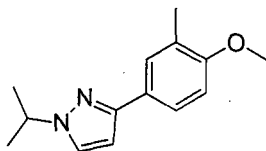
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,60 (1H, s), 7,57 (1H, dd, J = 8,5, 2,2 Hz), 7,38 (1H, d, J = 2,4 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,2 Hz), 6,45 (1H, d, J = 2,2 Hz), 4,20 (2H, c, J = 7,3 Hz), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,52 (3H, t, J = 7,4 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 42

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 40 usando isopropil yoduro en lugar de yoduro de metilo dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1H-pirazol.

5

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-isopropil-1H-pirazol



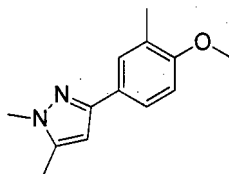
10 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,60 (1H, s), 7,58-7,54 (1H, m), 7,42 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 6,84 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,45 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 4,60-4,50 (1H, m), 3,85 (3H, s), 2,26 (3H, s), 1,54 (6H, d, $J = 6,8$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 43

15 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 40 usando 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 45) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,5-dimetil-1H-pirazol y 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,5-dimetil-1H-pirazol

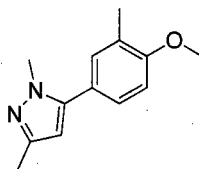
20



RMN ^1H (CDCl_3) 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).

25

5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol



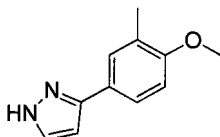
30 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,20-7,17 (2H, m), 6,88 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,02 (1H, s), 3,87 (3H, s), 3,79 (3H, s), 2,29 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 44

35 A temperatura ambiente, a una mezcla de 7,69 g de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propenona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 46) 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 cromatografía en columna sobre gel de sílice para dar 5,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1H-pirazol.

40

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol

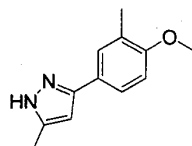


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 11,91 (1H, s a), 7,58 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,54-7,50 (2H, m), 6,84-6,80 (1H, m), 6,51 (1H, d, $J = 2,0$ Hz), 3,85 (3H, s), 2,24 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 45

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 44 usando 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-butano-1,3-diona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 47) en lugar de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propenona dio 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol.

- 10 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-metil-1*H*-pirazol

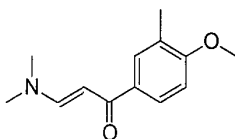


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,49-7,46 (2H, m), 6,83-6,80 (1H, m), 6,26 (1H, s), 3,84 (3H, s), 2,31 (3H, s), 2,23 (3H, s).

- 15 Ejemplo de Preparación de Referencia 46

Una mezcla de 5,76 g de 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-etanona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 48) 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.

3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-propenona

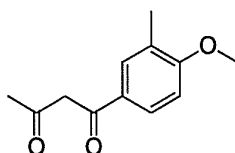


RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 7,76 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,72 (1H, s), 7,64 (1H, d, $J = 12,4$ Hz), 6,95 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,80 (1H, d, $J = 12,4$ Hz), 3,83 (3H, s), 3,11 (3H, s a), 2,90 (3H, s a), 2,18 (3H, s).

- 30 Ejemplo de Preparación de Referencia 47

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-metilfenil)-etanona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 48), 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.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona

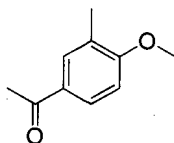


- 45 RMN ^1H (CDCl_3 ; 23 °C) δ : 7,76 (1H, dd, $J = 8,6, 2,3$ Hz), 7,69 (1H, d, $J = 1,4$ Hz), 6,85 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,12 (1H, s), 3,89 (3H, s), 2,25 (3H, s), 2,17 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 48

- 50 Una mezcla de 5,0 g de 1-(4-hidroxi-3-metilfenil)-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-metilfenil)-etanona.

1-(4-metoxi-3-metilfenil)-etanona

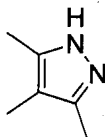


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,82 (1H, dd, $J = 8,5, 1,7$ Hz), 7,79-7,76 (1H, m), 6,85 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,90 (3H, s), 2,55 (3H, s), 2,25 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 49

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-pentanediona 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 concentraron a presión reducida para dar 3,68 g de 3,4,5-torimetil-1H-pirazol.

3,4,5-torimetil-1H-pirazol

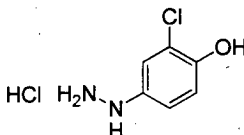


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,19 (6H, s), 1,90 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 50

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 la mezcla de reacción se filtró y se lavó con ácido clorhídrico acuoso al 10 % y hexano para dar 105 g de sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol.

sal clorhidrato de 2-cloro-4-hidrazinofenol

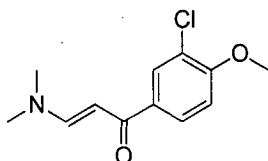


RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 10,00 (3H, s), 9,90 (1H, s), 7,92 (1H, s a), 7,07 (1H, d, $J = 2,7$ Hz), 6,93 (1H, d, $J = 8,8$ Hz), 6,85 (1H, dd, $J = 8,8, 2,7$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 51

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 46 usando 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.

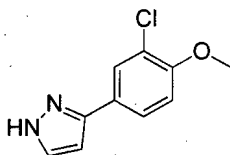
3-dimetilamino-1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-propenona



RMN ^1H (CDCl_3) 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).

Ejemplo de Preparación de Referencia 52

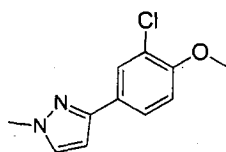
Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 44 usando 3-dimetilamino-1-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-propenona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 51) en lugar de 3-dimetilamino-1-(4-metoxi-3-metilfenil)-propenona dio 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol.

3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol

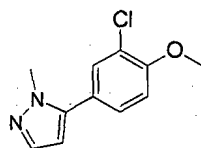
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,78 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,61-7,59 (2H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 6,54 (1H, dd, $J = 2,2$, 0,7 Hz), 3,92 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 53

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 40 usando 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 52) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metilfenil)-1*H*-pirazol dio 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol y 5-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.

3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol

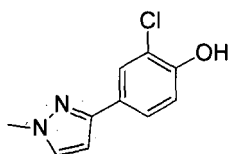
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,81 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,64 (1H, dd, $J = 8,6$, 2,1 Hz), 7,36 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 6,95 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,45 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 3,94 (3H, s), 3,93 (3H, s)

5-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol

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).

Ejemplo de Preparación de Referencia 54

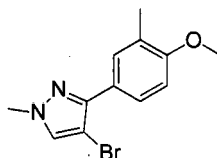
Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 29 usando 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 53) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metilfenil)-1*H*-pirazol dio 2-cloro-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

2-cloro-4-(1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol

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 55

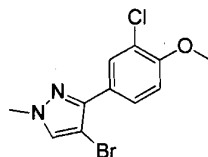
A temperatura ambiente, una mezcla de 3 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 29), 2,9 g de N-bromosuccinimida y 50 ml de cloroformo, se agitó durante dieciséis horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua y la mezcla resultante 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.

10 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol

15 RMN ¹H (CDCl₃) 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 56

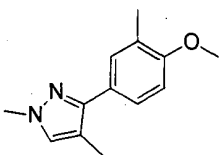
20 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 120 usando 3-(3-cloro-4-metoxi-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 53) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol.

3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol

25 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).

30 Ejemplo de Preparación de Referencia 57

35 Una mezcla de 3,9 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 55), 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-1*H*-pirazol.

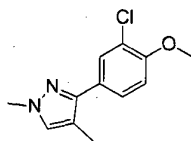
40 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol

45 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 58

50 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 57 usando 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 56) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-4-bromo-1-metil-1*H*-pirazol dio 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol.

3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol

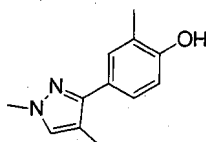


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,70 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,53 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,2 Hz), 7,18 (1H, s), 6,97 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,93 (3H, s), 3,88 (3H, s), 2,20 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 59

Una mezcla de 2,4 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 57), 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 a los residuos resultantes se les 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 concentraron a presión reducida para dar 2,1 g de 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

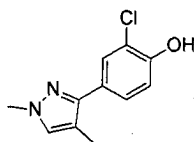


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,58 (1H, s), 7,34 (1H, s), 7,25 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,2 Hz), 6,83 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,81 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,13 (3H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 60

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 59 usando 3-(4-metoxi-3-cloro-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 58) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol dio 4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-clorofenol.

4-(1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-cloro-fenol

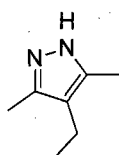


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,54 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,52 (1H, s), 7,41 (1H, dd, *J* = 8,5, 1,9 Hz), 7,01 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 3,79 (3H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 61

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-1*H*-pirazol.

3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol

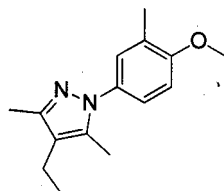


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,36 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,20 (6H, s), 1,07 (3H, t, *J* = 7,6 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 62

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 61) en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol

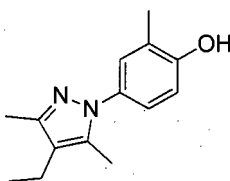


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,19 (1H, d, *J* = 2,7 Hz), 7,14 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,84 (1H, d, *J* = 8,7 Hz), 3,86 (3H, s), 2,41 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,26 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,11 (3H, t, *J* = 7,5 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 63

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-4-etil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 62) 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

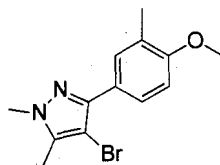


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,24 (1H, d, *J* = 2,5 Hz), 7,15 (1H, dd, *J* = 8,5, 2,7 Hz), 6,93-6,91 (1H, m), 2,43 (2H, c, *J* = 7,6 Hz), 2,25 (3H, s), 2,17 (3H, s), 2,17 (3H, s), 1,07 (3H, t, *J* = 7,6 Hz)

Ejemplo de Preparación de Referencia 64

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 43), 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.

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).

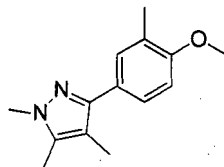
Ejemplo de Preparación de Referencia 65

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 64), 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.

3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol

5



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).

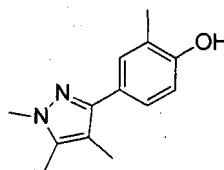
10

Ejemplo de Preparación de Referencia 66

Una mezcla de 0,6 g de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 65), 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 a los residuos resultantes se les 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 concentraron a presión reducida para dar 0,5 g de 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

15

20 4-(1,4,5-trimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol



RMN ¹H (DMSO-D₆) 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).

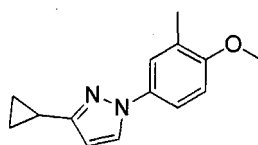
25

Ejemplo de Preparación de Referencia 67

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 3-ciclopropil-1*H*-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-ciclopropil-1*H*-pirazol y 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-ciclopropil-1*H*-pirazol.

30

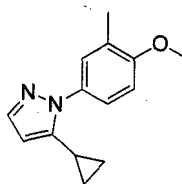
1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-ciclopropil-1*H*-pirazol



35

RMN ¹H (CDCl₃) 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).

40 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-ciclopropil-1*H*-pirazol



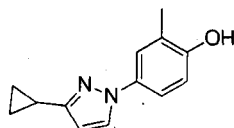
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,51 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 7,37-7,35 (2H, m), 6,89-6,87 (1H, m), 5,91 (1H, d, *J* = 1,9 Hz), 3,88 (3H, s), 2,27 (3H, s), 1,81-1,74 (1H, m), 0,97-0,93 (2H, m), 0,76-0,72 (2H, m).

45

Ejemplo de Preparación de Referencia 68

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-5-ciclopropil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 67) en lugar de 3,4,5-trimetil-1*H*-pirazol dio 2-metil-(4-metoxi-3-ciclopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol.

2-metil-(4-metoxi-3-ciclopropil-1*H*-pirazol-3-il)-fenol

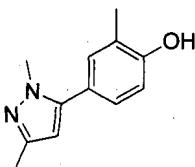


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 8,10 (1H, d, *J* = 1,4 Hz), 7,45 (1H, d, *J* = 2,2 Hz), 7,35-7,32 (1H, m), 6,81 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,15-6,14 (1H, m), 2,16 (3H, s), 1,97-1,90 (1H, m), 0,91-0,87 (2H, m), 0,71-0,67 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 69

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 29 usando 5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 43) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol dio 2-metil-(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)-fenol.

2-metil-(1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il)-fenol

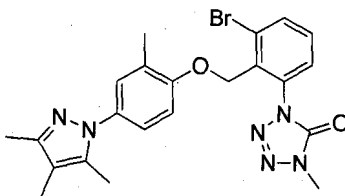


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,22 (1H, s), 7,15 (1H, dd, *J* = 8,2, 1,9 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,2 Hz), 6,20 (1H, s), 3,77 (3H, s), 2,21 (3H, s), 2,16 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 70

Una mezcla de 3,1 g de 1-(2-bromometil-3-bromofenil)-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 11), 1,6 g de 2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 20), 1,3 g de carbonato de potasio y 70 ml de acetonitrilo, se agitó con calentamiento a reflujo durante seis horas, y después, la mezcla de reacción se filtró y se concentró a presión reducida. 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.

1-{3-bromo-2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona



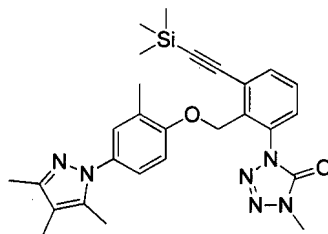
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,81 (1H, dd, *J* = 7,7, 1,4 Hz), 7,46-7,38 (2H, m), 7,15 (1H, d, *J* = 2,4 Hz), 7,10 (1H, dd, *J* = 8,6, 2,5 Hz), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 5,32 (2H, s), 3,62 (3H, s), 2,23 (3H, s), 2,16 (3H, s), 2,06 (3H, s), 1,96 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 71

Una mezcla de 0,3 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 (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 70), 0,2 g de trimetilsililacetileno, 0,05 g de tetraquis trifenilfosfina paladio, 0,07 g de tri-*tert*-butilfosfina, 0,6 g de fosfato de potasio, 5 ml de 1,4-dioxano y 0,5 ml de agua, se agitó a 100 °C durante cinco horas. Después de un periodo de refrigeración, 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 0,1 g de 1-{2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-3-trimetilsililetinil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona.

1-{2-[2-metil-4-(3,4,5-trimetil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-3-trimetilsililetinil-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona

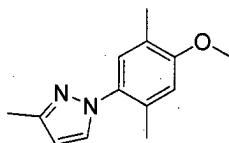


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,67 (1H, dd, $J = 7,2, 1,9$ Hz), 7,48-7,44 (2H, m), 7,13 (1H, d, $J = 2,5$ Hz), 7,11-7,08 (1H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,42 (2H, s), 3,64 (3H, s), 2,22 (3H, s), 2,15 (3H, s), 2,03 (3H, s), 1,96 (3H, s), 0,19 (9H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 72

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando ácido 2,5-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-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol.

1-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-1H-pirazol

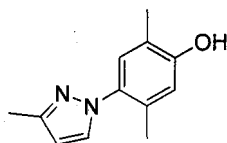


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,40 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,09 (1H, s), 6,69 (1H, s), 6,17 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 3,86 (3H, s), 2,36 (3H, s), 2,18 (3H, s), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 73

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(2,5-dimetil-4-metoxi-fenil)-3-metil-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 2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol.

2,5-dimetil-4-(3-metil-pirazol-1-il)-fenol

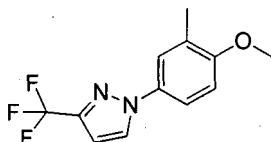


RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 7,74 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 7,00 (1H, s), 6,70 (1H, s), 6,22 (1H, d, $J = 2,2$ Hz), 2,23 (3H, s), 2,10 (3H, s), 2,02 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 74

Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol.

1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-1H-pirazol



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,

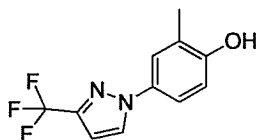
$J = 8,8 \text{ Hz}$), 6,68 (1H, d, $J = 2,4 \text{ Hz}$), 3,87 (3H, s), 2,28 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 75

- 5 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 20 usando 1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-trifluorometil-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 2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol.

2-metil-4-(3-trifluorometil-pirazol-1-il)-fenol

10



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,83-7,80 (1H, m), 7,45 (1H, d, $J = 2,2 \text{ Hz}$), 7,32 (1H, dd, $J = 8,5, 2,4 \text{ Hz}$), 6,82 (1H, d, $J = 8,5 \text{ Hz}$), 6,68 (1H, d, $J = 2,2 \text{ Hz}$), 5,46 (1H, s), 2,29 (3H, s).

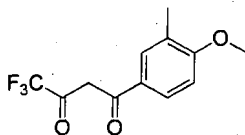
15

Ejemplo de Preparación de Referencia 76

- A temperatura ambiente, a una mezcla de 6,9 g de 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-etanona (descrita en el Ejemplo de Preparación de Referencia 48) y 200 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 11,9 g de éster etílico del ácido trifluoroacético y una solución al 20 % de 28,5 g de etóxido de sodio. 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 4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona.

25

4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-butano-1,3-diona



30

RMN ^1H (CDCl_3 ; 23 °C) δ : 7,84 (1H, dd, $J = 8,7, 2,4 \text{ Hz}$), 7,75 (1H, dd, $J = 1,7, 0,7 \text{ Hz}$), 6,90 (1H, d, $J = 8,7 \text{ Hz}$), 6,51 (1H, s), 3,93 (3H, s), 2,27 (3H, s).

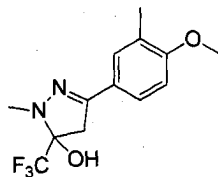
Ejemplo de Preparación de Referencia 77

35

- 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 76) 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.

40

5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol

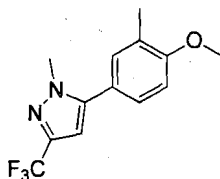


45

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44-7,44 (1H, m), 7,33 (1H, dd, $J = 8,5, 2,4 \text{ Hz}$), 6,79 (1H, d, $J = 8,5 \text{ Hz}$), 3,85 (3H, s), 3,50 (1H, d, $J = 17,6 \text{ Hz}$), 3,24 (1H, d, $J = 17,6 \text{ Hz}$), 3,06 (3H, s), 2,87 (1H, s), 2,22 (3H, s).

50

5-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol

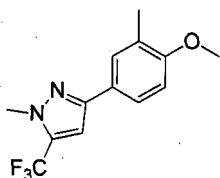


5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,22-7,17 (2H, m), 6,91 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,48 (1H, s), 3,90 (3H, s), 3,89 (3H, s), 2,27 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 78

10 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 77), 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

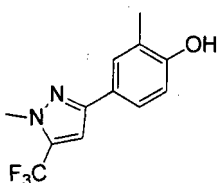


20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,56-7,53 (2H, m), 6,85 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 6,81 (1H, s), 4,01 (3H, s), 3,86 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 79

25 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 78), 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 a los residuos resultantes se les añadieron 70 ml de agua enfriada con hielo. Los precipitados se filtraron y se lavaron con agua enfriada con 70 ml de hielo, y después se concentraron a presión reducida para dar 2 g de 2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

2-metil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol

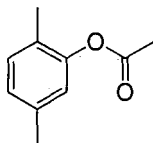


35 RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 9,52 (1H, s), 7,57 (1H, s), 7,47 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 7,22 (1H, s), 6,80 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,96 (3H, s), 2,15 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 80

40 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.

2,5-dimetilfenil éster del ácido acético

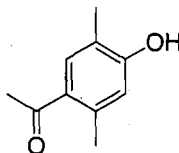


5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,10 (1H, d, $J = 7,7$ Hz), 6,95 (1H, d, $J = 7,2$ Hz), 6,82 (1H, s), 2,31 (6H, s), 2,13 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 81

10 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 80) 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.

1-(2,5-dimetil-4-hidroxi-fenil)-etanona

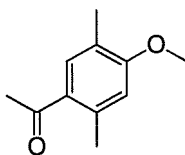


20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,59 (1H, s), 6,64 (1H, s), 5,56 (1H, s), 2,55 (3H, s), 2,50 (3H, s), 2,26 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 82

25 Una mezcla de 14,6 g de 1-(2,5-dimetil-4-hidroxi-fenil)-etanona, 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-fenil)-etanona.

1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-etanona

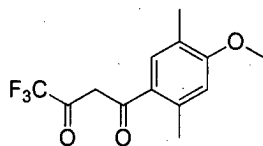


35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,56 (1H, s), 6,65 (1H, s), 3,87 (3H, s), 2,56 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,21 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 83

40 A temperatura ambiente, a una mezcla de 5 g de 1-(4-metoxi-2,5-dimetilfenil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 82) 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.

4,4,4-trifluoro-1-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-butano-1,3-diona



RMN ^1H (CDCl_3 : 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).

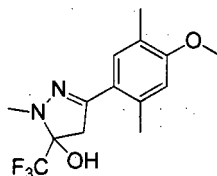
5

Ejemplo de Preparación de Referencia 84

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 83) 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-dimetil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol y 3 g de 5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol.

10

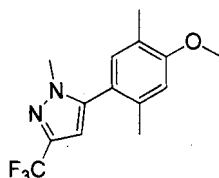
15 5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-2-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidro-2H-pirazol-3-ol



RMN ^1H (CDCl_3) 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).

20

5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol



25

RMN ^1H (CDCl_3) 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).

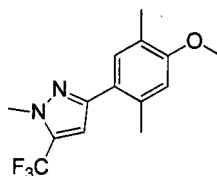
Ejemplo de Preparación de Referencia 85

Una mezcla de 3,2 g de 5-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 84), 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-dimetil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol.

30

35

3-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol



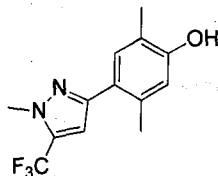
40

RMN ^1H (CDCl_3) 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 86

Una mezcla de 3 g de 3-(4-metoxi-2,5-dimetil-fenil)-1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 85), 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 a los residuos resultantes se les añadieron 90 ml de agua enfriada con hielo. Los precipitados se filtraron y se lavaron con 90 ml de agua enfriada con hielo y 100 ml de hexano, y después se concentraron a presión reducida para dar 2,9 g de 2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

2,5-dimetil-4-(1-metil-5-trifluorometil-1H-pirazol-3-il)-fenol

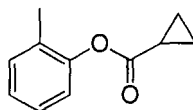


RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 9,37 (1H, s), 7,26 (1H, s), 7,02 (1H, s), 6,66 (1H, s), 3,98 (3H, s), 2,32 (3H, s), 2,10 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 87

A 0 °C, a una mezcla de 5,9 g de *O*-cresol y 50 ml de cloroformo, se le añadieron 6,8 g de cloruro de ciclopropanocarbonilo y 16,6 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 9,8 g de 2-metilfenil éster del ácido ciclopropanocarboxílico.

2-metilfenil éster del ácido ciclopropanocarboxílico

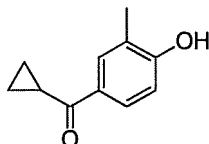


RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,24-7,17 (2H, m), 7,13 (1H, td, J = 7,38, 1,26 Hz), 7,01 (1H, dd, J = 7,67, 1,26 Hz), 2,19 (3H, s), 1,88 (1H, tt, J = 8,01, 3,78 Hz), 1,21-1,16 (2H, m), 1,06-1,00 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 88

A 0 °C, a una mezcla de 100 ml de nitrometano y 9,5 g de 2-metilfenil éster del ácido ciclopropanocarboxílico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 87), se le añadieron 18 g de tricloruro de aluminio y después, la mezcla resultante se calentó a 50 °C y se agitó durante doce horas. A la mezcla de reacción se añadieron 50 ml de agua enfriada con hielo. 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 8,2 g de ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-etanona.

ciclopropil-(4-hidroxi-3-metil-fenil)-etanona



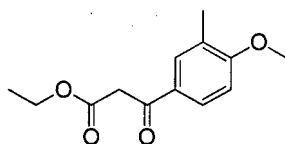
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,85 (1H, d, J = 2,17 Hz), 7,80 (1H, dd, J = 8,45, 2,17 Hz), 6,84 (1H, d, J = 8,45 Hz), 6,15 (1H, s), 2,68-2,61 (1H, m), 2,30 (3H, s), 1,25-1,20 (2H, m), 1,04-0,98 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 89

A temperatura ambiente, a una mezcla de 1-(4-metoxi-3-metilfenil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 48) y 200 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 16,1 g de carbonato dietílico, 6,2 g de hidruro de

sodio al 55 %, 0,05 g de dibenzo-18-coro-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.

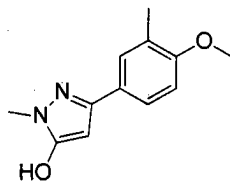
éster etílico del ácido 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3-oxo-propiónico



RMN ^1H (CDCl_3) 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 90

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 89) 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.

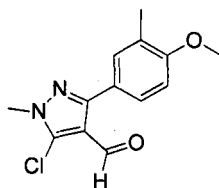


RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 7,58-7,56 (2H, m), 6,97 (1H, d, $J = 8,9$ Hz), 5,90 (1H, s), 3,81 (3H, s), 3,60 (3H, s), 2,18 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 91

A 0 °C, a 56 g de oxiclورو 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 90). 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.

5-cloro-4-formil-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol



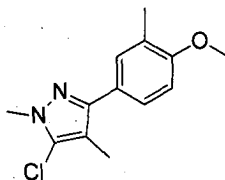
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 9,93 (1H, s), 7,55 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 7,51 (1H, s), 6,90 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 3,92 (3H, s), 3,88 (3H, s), 2,27 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 92

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 91) 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-metilfenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol.

5-cloro-3-(4-metoxi-3-metilfenil)-1,4-dimetil-1*H*-pirazol

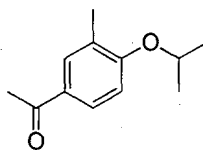


RMN ^1H (DMSO- D_6) δ : 7,42-7,40 (2H, m), 6,98 (1H, d, $J = 9,2$ Hz), 3,81 (3H, s), 3,80 (3H, s), 2,19 (3H, s), 2,11 (3H, s).

Ejemplo de Preparación de Referencia 93

Una mezcla de 10 g de 1-(4-hidroxí-3-metilfenil)-etanona, 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-metilfenil)-etanona.

1-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-etanona

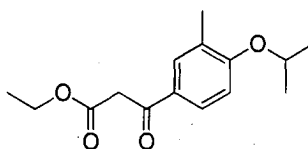


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,80-7,78 (2H, m), 6,84 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 4,69-4,60 (1H, m), 2,54 (3H, s), 2,23 (3H, s), 1,37 (6H, d, $J = 6,0$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 94

A temperatura ambiente, a una mezcla de 9,4 g de 1-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-etanona (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 93) 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-metilfenil)-3-oxo-propiónico.

éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-3-oxo-propiónico



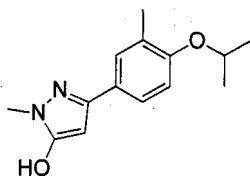
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,79-7,76 (2H, m), 6,85-6,83 (1H, m), 4,68-4,62 (1H, m), 4,21 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 3,93 (2H, s), 2,22 (3H, s), 1,37 (6H, d, $J = 6,0$ Hz), 1,26 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 95

A temperatura ambiente, a una mezcla de 12,1 g del éster etílico del ácido 3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-3-oxo-propiónico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 94) 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.

5 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol

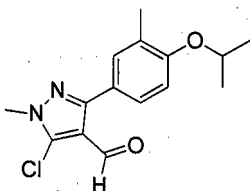


10 RMN ¹H (DMSO-D₆) δ: 7,58-7,54 (2H, m), 7,01-6,98 (1H, m), 5,95 (1H, s), 4,66-4,60 (1H, m), 3,62 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,28 (6H, d, J = 5,1 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 96

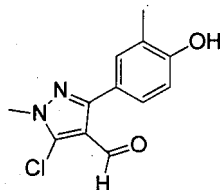
15 A 0 °C, a 43 g de oxiclورو de fósforo, se les añadieron 3,2 g de N,N-dimetilformamida y la mezcla resultante se agitó durante una media hora. Se añadieron a la misma 8,3 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 95). La mezcla 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 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 5,1 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol y 0,6 g de 2-metil-4-(5-cloro-4-formil-1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol.

5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol



25 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).

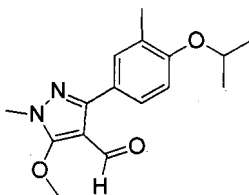
30 2-metil-4-(5-cloro-4-formil-1-metil-1H-pirazol-3-il)-fenol



35 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).

Ejemplo de Preparación de Referencia 97

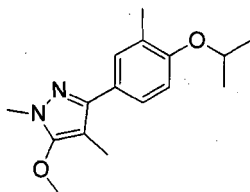
40 A temperatura ambiente, a una mezcla de 4,8 g de 5-cloro-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 96) y 100 ml de tetrahidrofurano, se le añadieron 0,6 g de metanol y 0,8 g de hidruro de sodio al 55 % y la mezcla resultante se 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-1*H*-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 98

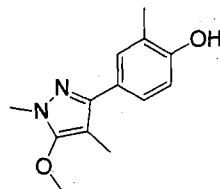
- 10 A 0 °C, a una mezcla de 4,2 g de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 97) y 20 ml de ácido trifluoroacético, se le añadieron 4,2 g de trietilsilano. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 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-metil-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol.

1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1*H*-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 99

- Una mezcla de 7,4 g de 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 98) y 100 ml de una solución acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante quince horas. A continuación, se llevaron a cabo 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 algunos sólidos. De nuevo, los filtrados se concentraron a presión reducida a aproximadamente medio volumen y se enfriaron a 0 °C, y los precipitados resultantes se filtraron y se lavaron con agua fría para dar algunos sólidos. 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-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

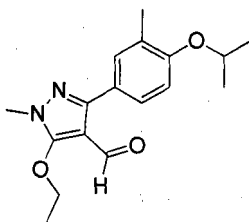
35 4-(1,4-dimetil-5-metoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metileno

- 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 100

- 45 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 97 usando etanol en lugar de metanol dio 5-etoxi-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.

5-etoxi-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol.



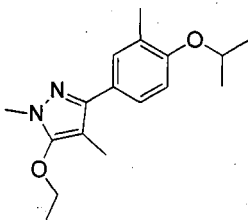
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 9,74 (1H, s), 7,39 (1H, d, *J* = 1,8 Hz), 7,35 (1H, dd, *J* = 8,2, 2,3 Hz), 6,89 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,63 (2H, c, *J* = 7,1 Hz), 4,61-4,55 (1H, m), 3,72 (3H, s), 2,24 (3H, s), 1,44 (3H, t, *J* = 7,1 Hz), 1,36 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 101

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 97 usando 5-etoxi-4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 100) en lugar de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-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-metilfenil)-1*H*-pirazol

15



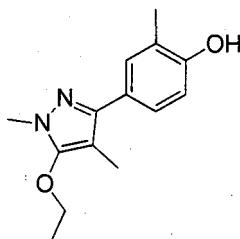
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 7,43 (1H, d, *J* = 1,6 Hz), 7,38-7,35 (1H, m), 6,86 (1H, d, *J* = 8,5 Hz), 4,57-4,51 (1H, m), 4,14 (2H, c, *J* = 7,0 Hz), 3,71 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,12 (3H, s), 1,41 (3H, t, *J* = 7,0 Hz), 1,35 (6H, d, *J* = 6,0 Hz).

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 102

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 99 usando 1,4-dimetil-5-etoxi-3-(4-isopropoxi-3-metilfenil)-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 101) 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.

4-(1,4-dimetil-5-etoxi-1*H*-pirazol-3-il)-2-metilfenol



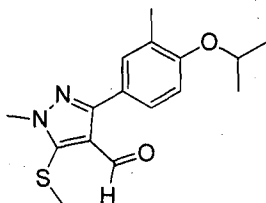
30

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 103

35

- 40 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 96) 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*-pirazol.

4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol

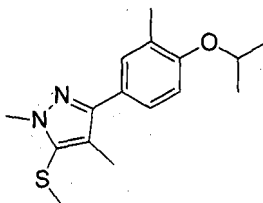
- 5 RMN ¹H (CDCl₃) δ: 10,02 (1H, s), 7,50-7,48 (2H, m), 6,91-6,89 (1H, m), 4,62-4,56 (1H, m), 4,02 (3H, s), 2,54 (3H, s), 2,25 (3H, s), 1,36 (6H, d, J = 6,0 Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 104

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 98 usando 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 103) en lugar de 4-formil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol dio 1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol.

1,4-dimetil-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metiltio-1*H*-pirazol

15



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).

20

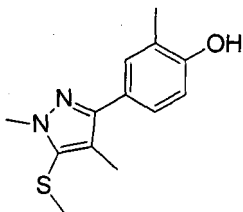
Ejemplo de Preparación de Referencia 105

- 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 104) 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 concentraron a presión reducida para dar 7,3 g de 4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol.

25

4-(1,4-dimetil-5-metiltio-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

30



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).

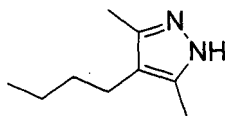
35

Ejemplo de Preparación de Referencia 106

- 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.

40

4-butil-3,5-dimetil-1H-pirazol



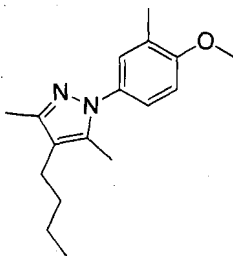
- 5 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,33 (2H, t, $J = 7,5$ Hz), 2,20 (3H, s), 2,20 (3H, s), 1,46-1,37 (2H, m), 1,36-1,27 (2H, m), 0,91 (3H, t, $J = 7,2$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 107

- 10 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 33 usando 4-butil-3,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 106) en lugar de 3,4,5-trimetil-1H-pirazol dio 4-butil-1-(4-metoxi-3-metilfenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol.

4-butil-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol

15



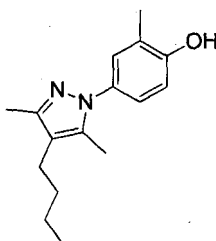
- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,19 (1H, d, $J = 2,4$ Hz), 7,15 (1H, dd, $J = 8,7, 2,7$ Hz), 6,84 (1H, d, $J = 8,7$ Hz), 3,86 (3H, s), 2,38 (2H, t, $J = 7,5$ Hz), 2,25 (3H, s), 2,24 (3H, s), 2,16 (3H, s), 1,50-1,43 (2H, m), 1,36 (2H, td, $J = 14,6, 7,3$ Hz), 0,94 (3H, t, $J = 7,1$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 108

- 25 Una reacción similar al Ejemplo de Preparación de Referencia 29 usando 4-butil-1-(4-metoxi-3-metil-fenil)-3,5-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 107) en lugar de 3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1H-pirazol dio 4-(4-butil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-metil-fenol.

4-(4-butil-3,5-dimetil-pirazol-1-il)-2-metil-fenol

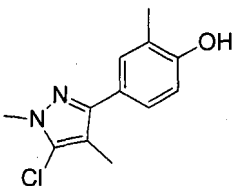
30



- 35 RMN ^1H ($\text{DMSO}-d_6$) 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 109

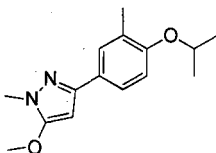
- 40 Una mezcla de 0,4 g de 5-cloro-3-(4-metoxi-3-metil-fenil)-1,4-dimetil-1H-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 92), 3 ml de ácido bromhídrico al 47 % y 3 ml de ácido acético, se agitó con calentamiento a reflujo durante quince horas. El disolvente se retiró por destilación y a los residuos resultantes se les 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 concentraron a presión reducida para dar 0,3 g de 4-(5-cloro-1,4-dimetil-1H-pirazol-3-il)-2-metilfenol.

4-(5-cloro-1,4-dimetil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metilfenol

- 5 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 110

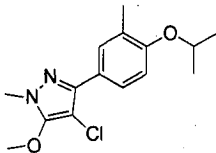
- 10 A temperatura ambiente, a la mezcla de 9,5 g de 5-hidroxi-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 95) y 70 ml de N,N-dimetilformamida, se le añadieron 2,5 g de hidruro de sodio al 55 % y se agitó durante una hora, y se añadieron a 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-1*H*-pirazol.

3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol

- 20 RMN ¹H (CDCl₃) 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).

Ejemplo de Preparación de Referencia 111

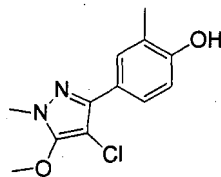
- A temperatura ambiente, a mezcla de 5,8 g de 3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 110), 3,3 g de N-clorosuccinimida y 70 ml de cloroformo se agitó durante 14 horas. Se añadieron a la misma 50 ml de agua y la mezcla resultante 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-1*H*-pirazol.

4-Cloro-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol

- 35 RMN ¹H (CDCl₃) 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 112

- Una mezcla de 5,6 g de 4-cloro-3-(4-isopropoxi-3-metil-fenil)-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 111) y una solución de 60 ml, acuosa al 30 % de ácido sulfúrico, se agitó con calentamiento a reflujo durante 20 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-1*H*-pirazol-3-il)-2-metilfenol.

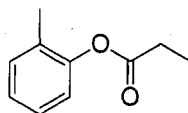
4-(4-Cloro-5-metoxi-1-metil-1*H*-pirazol-3-il)-2-metil-fenol

- 5 RMN ^1H (CDCl_3) 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 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



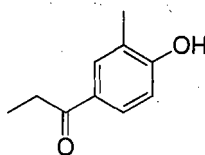
- 20 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,24-7,18 (2H, m), 7,15-7,11 (1H, m), 7,01-6,99 (1H, m), 2,61 (2H, c, $J = 7,6$ Hz), 2,17 (3H, s), 1,29 (3H, t, $J = 7,6$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 114

- 25 A 0 °C, a una mezcla de 150 ml de nitrometano 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.

30 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

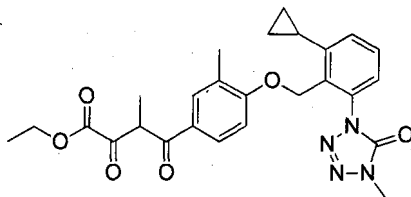


- 35 RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,80 (1H, d, $J = 1,9$ Hz), 7,75 (1H, dd, $J = 8,5, 2,2$ Hz), 6,86 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 6,65 (1H, s), 2,96 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 2,30 (3H, s), 1,22 (3H, td, $J = 7,3, 1,3$ Hz).

Ejemplo de Preparación de Referencia 115

- 40 A 0 °C, a una mezcla de 7 g de 1-[3-ciclopropil-2-(2-metil-4-propionil-fenoximetil)-fenil]-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 47), 5,2 g de oxalato de etilo y 150 ml de *N,N*-dimetilformamida, se le añadieron 4 g de *tert*-butoxido de potasio y la mezcla resultante se agitó durante tres horas. A la mezcla de reacción se le añadió agua, y se acidificó con una solución 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 5,5 g de éster etílico del ácido 4-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3-metil-1-2,4-dioxo-butírico.
- 45 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 5,5 g de éster etílico del ácido 4-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3-metil-1-2,4-dioxo-butírico.

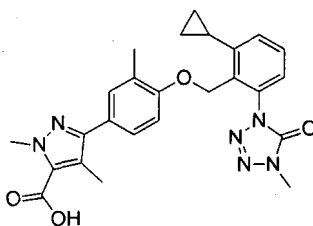
éster etílico del ácido 4-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3-metil-2,4-dioxo-butírico.



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,84 (1H, dd, $J = 8,6, 2,2$ Hz), 7,77-7,77 (1H, m), 7,46 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,29 (2H, d, $J = 8,0$ Hz), 6,97 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,35 (2H, s), 5,01 (1H, c, $J = 7,1$ Hz), 4,27 (2H, c, $J = 7,2$ Hz), 3,62 (3H, s), 2,12-2,07 (4H, m), 1,45 (3H, d, $J = 7,1$ Hz), 1,31 (3H, t, $J = 7,1$ Hz), 1,03-0,98 (2H, m), 0,80-0,76 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 116

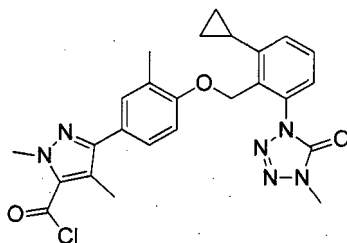
A temperatura ambiente, la mezcla de 1,4 g de éster etílico del ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carboxílico (Presente compuesto 48), 40 ml de tetrahydrofrano, 10 ml de metanol, 10 ml de agua y 0,2 g de hidróxido de litio, se agitó durante doce horas. La mezcla resultante se concentró a presión reducida y se acidificó con una solución al 10 % de ácido clorhídrico y la mezcla 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 1,3 g de ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carboxílico. Ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carboxílico



RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,44 (1H, t, $J = 7,9$ Hz), 7,39-7,33 (2H, m), 7,28 (1H, d, $J = 8,0$ Hz), 7,20 (1H, d, $J = 7,8$ Hz), 6,95 (1H, d, $J = 8,2$ Hz), 5,30 (2H, s), 4,20 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,41 (3H, s), 2,19-2,10 (4H, m), 1,05-0,97 (2H, m), 0,79-0,72 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 117

A temperatura ambiente, a la mezcla de ácido 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carboxílico (descrito en el Ejemplo de Preparación de Referencia 116) y 50 ml de tetrahydrofurano se le añadieron 0,5 g de dicloruro de oxililo y 0,1 ml de N,N-dimetilformamida. La mezcla se agitó durante dos horas y se concentró a presión reducida para dar 1,3 g de 5-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carbonilcloruro. 5-{4-[2-Ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-2,4-dimetil-2H-pirazol-3-carbonilcloruro



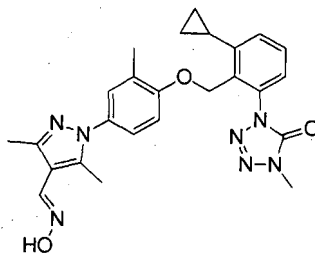
RMN ^1H (CDCl_3) δ : 7,47-7,42 (1H, m), 7,30-7,27 (3H, m), 7,20 (1H, d, $J = 7,9$ Hz), 6,96 (1H, d, $J = 8,3$ Hz), 5,30 (2H, s), 4,15 (3H, s), 3,63 (3H, s), 2,48 (3H, s), 2,17-2,11 (4H, m), 1,04-0,98 (2H, m), 0,79-0,73 (2H, m).

Ejemplo de Preparación de Referencia 118

A temperatura ambiente, una mezcla de 1,7 g de 1-{3-ciclopropil-2-[2-metil-4-(3,5-dimetil-4-formil-pirazol-1-il)-fenoximetil]-fenil}-4-metil-1,4-dihidrotetrazol-5-ona (Presente compuesto 51), 20 ml de cloroformo, 0,3 g de sal

clorhidrato de hidroxilamina y 0,9 g de piridina, se agitó durante doce horas. A la mezcla resultante se le añadieron 20 ml de agua y la mezcla 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 1,4 g de 1-{4-[2-ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3,5-dimetil-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima.

1-{4-[2-Ciclopropil-6-(4-metil-5-oxo-4,5-dihidro-tetrazol-1-il)-benciloxi]-3-metil-fenil}-3,5-dimetil-1H-pirazol-4-carbaldehído oxima

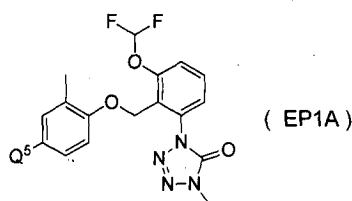


RMN ^1H (CDCl_3) δ : 8,14 (1H, s), 7,59 (1H, s), 7,46-7,42 (1H, m), 7,28 (2H, d, $J = 7,8$ Hz), 7,15-7,11 (2H, m), 6,92 (1H, d, $J = 8,5$ Hz), 5,29 (2H, s), 3,63 (3H, s), 2,38 (3H, s), 2,34 (3H, s), 2,14-2,08 (4H, m), 1,02-0,97 (2H, m), 0,79-0,75 (2H, m).

De acuerdo con los procesos mencionados anteriormente, pueden prepararse los siguientes compuestos:

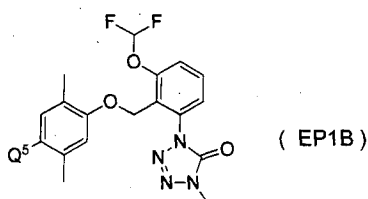
Compuestos EP1A-001~EP1A-1023, EP1B-001~EP1B-1023, EP1C-001~EP1C-1023, EP1D-001~EP1D-1023, EP1E-001~EP1E-1023, EP1F-001~EP1F-1023, EP1G-001~EP1G-1023, EP1H-001~EP1H-1023, EP1I-001~EP1I-1023, EP1J-001~EP1J-1023, EP2A-001~EP2A-1023, EP2B-001~EP2B-1023, EP2C-001~EP2C-1023, EP2D-001~EP2D-1023, EP2E-001~EP2E-1023, 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~EP4I-1023, 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~EP5I-1023 y EP5J-001~EP5J-1023.

Los Compuestos EP1A-001~EP1A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



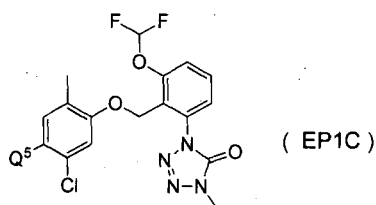
[en la fórmula (EP1A), Q^5 representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

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];

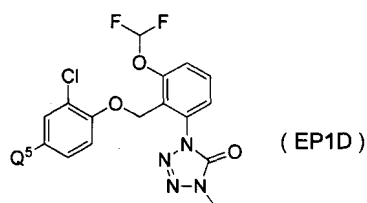
Los Compuestos EP1C-001~EP1C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EP1C), 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];

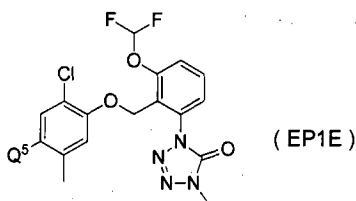
5

Los Compuestos EP1D-001~EP1D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



10 [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];

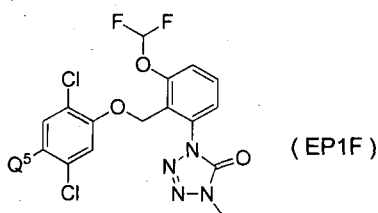
Los Compuestos EP1E-001~EP1E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



15

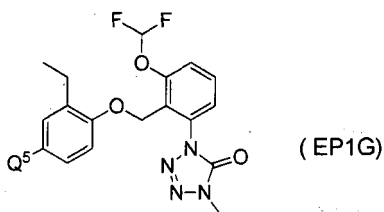
[en la fórmula (EP1E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EP1F-001~EP1F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [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];

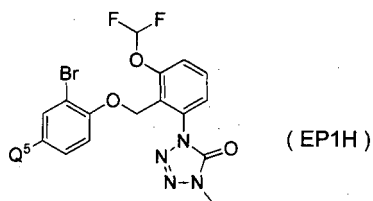
Los Compuestos EP1G-001~EP1G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



30

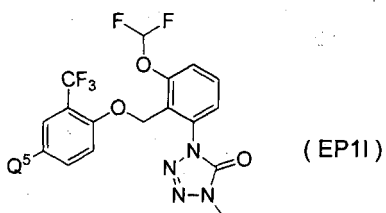
[en la fórmula (EP1G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP1H-001~EP1H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



- 5 [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];

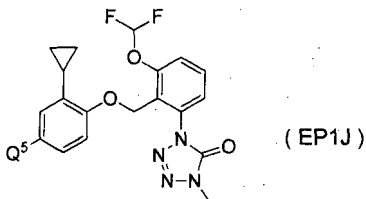
Los Compuestos EP1I-001~EP1I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



10

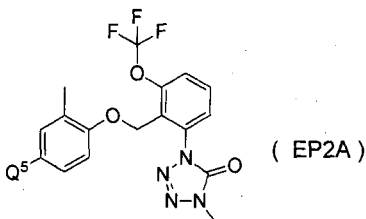
[en la fórmula (EP1I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

- 15 Los Compuestos EP1J-001~EP1J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



- 20 [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:

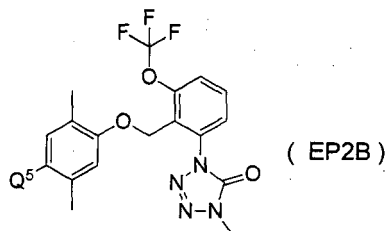


25

[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];

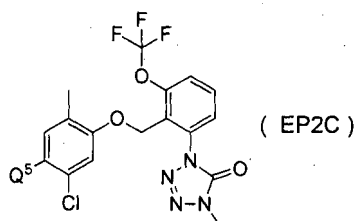
Los Compuestos EP2B-001~EP2B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

30



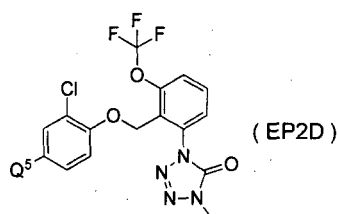
[en la fórmula (EP2B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2C-001~EP2C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



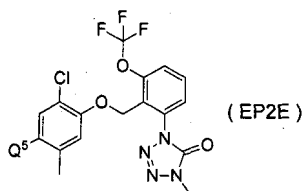
[en la fórmula (EP2C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2D-001~EP2D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



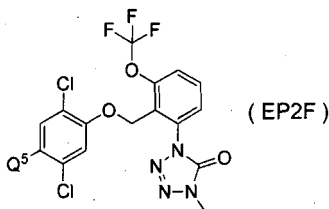
[en la fórmula (EP2D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2E-001~EP2E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



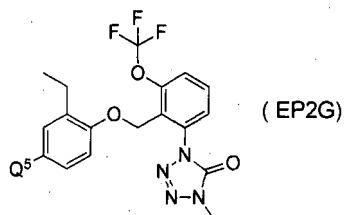
[en la fórmula (EP2E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2F-001~EP2F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



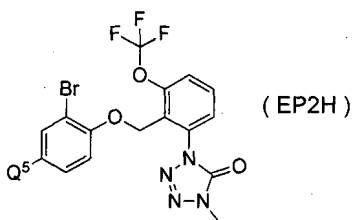
[en la fórmula (EP2F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2G-001~EP2G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



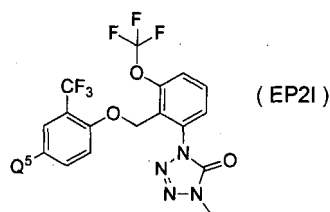
- 5 [en la fórmula (EP2G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2H-001~EP2H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



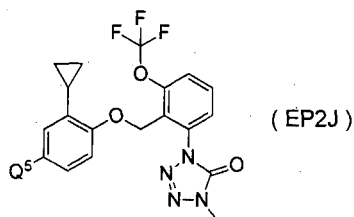
- 10 [en la fórmula (EP2H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

- 15 Los Compuestos EP2I-001~EP2I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



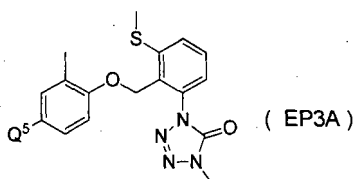
- 20 [en la fórmula (EP2I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP2J-001~EP2J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

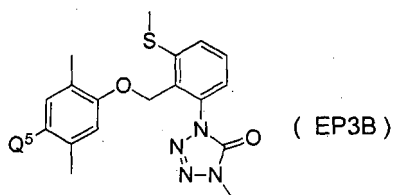


- 25 [en la fórmula (EP2J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3A-001~EP3A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



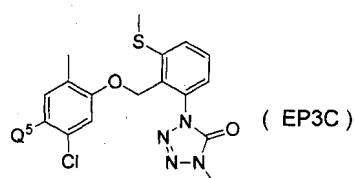
[en la fórmula (EP3A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];
Los Compuestos EP3B-001~EP3B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



5

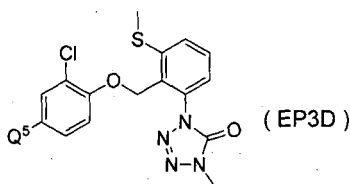
[en la fórmula (EP3B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EP3C-001~EP3C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



15 [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];

Los Compuestos EP3D-001~EP3D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

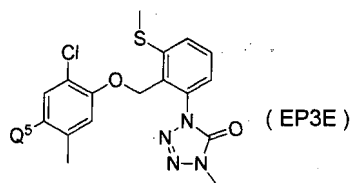


20

[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];

Los Compuestos EP3E-001~EP3E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

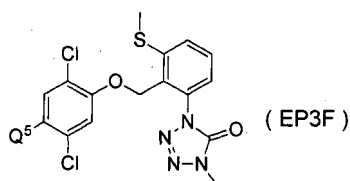
25



[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];

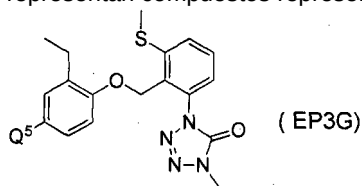
30

Los Compuestos EP3F-001~EP3F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



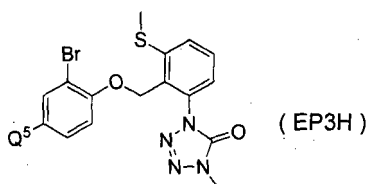
35 [en la fórmula (EP3F), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3G-001~EP3G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



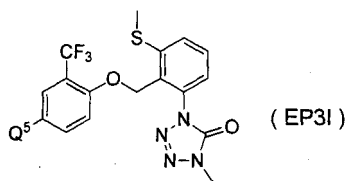
[en la fórmula (EP3G), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3H-001~EP3H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



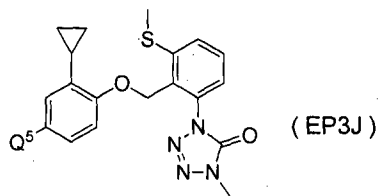
[en la fórmula (EP3H), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3I-001~EP3I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



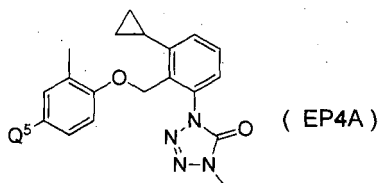
[en la fórmula (EP3I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP3J-001~EP3J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



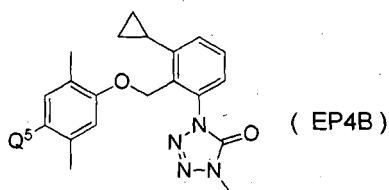
[en la fórmula (EP3J), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

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];

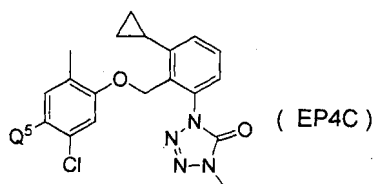
Los Compuestos EP4B-001~EP4B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[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];

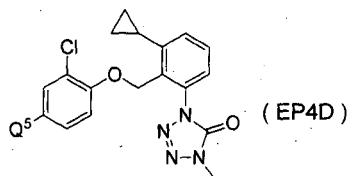
5

Los Compuestos EP4C-001~EP4C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



10 [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];

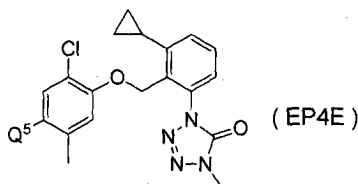
Los Compuestos EP4D-001~EP4D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



15

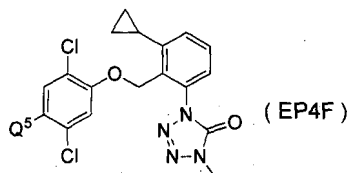
[en la fórmula (EP4D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EP4E-001~EP4E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [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];

Los Compuestos EP4F-001~EP4F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

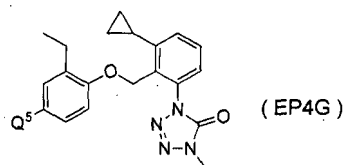


30

[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];

Los Compuestos EP4G-001~EP4G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:

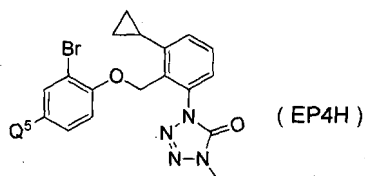
35



[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];

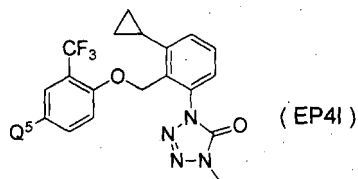
5

Los Compuestos EP4H-001~EP4H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



10 [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];

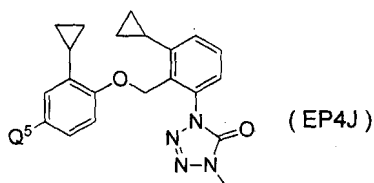
Los Compuestos EP4I-001~EP4I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



15

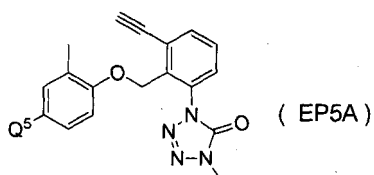
[en la fórmula (EP4I), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EP4J-001~EP4J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [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];

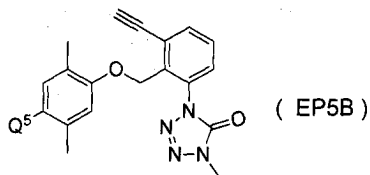
Los Compuestos EP5A-001~EP5A-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



30

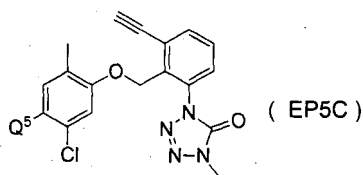
[en la fórmula (EP5A), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5B-001~EP5B-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



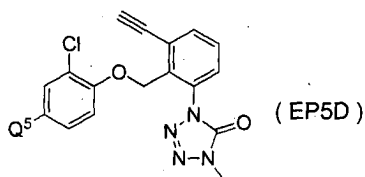
- 5 [en la fórmula (EP5B), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5C-001~EP5C-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



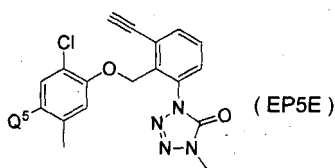
- 10 [en la fórmula (EP5C), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

- 15 Los Compuestos EP5D-001~EP5D-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



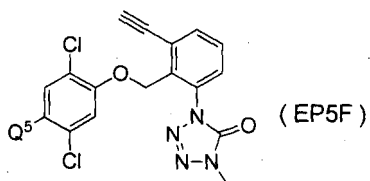
- 20 [en la fórmula (EP5D), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5E-001~EP5E-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



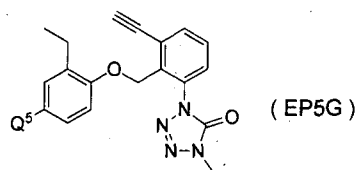
- 25 [en la fórmula (EP5E), Q⁵ representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 1023 indicado en la Tabla 1 a Tabla 54 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EP5F-001~EP5F-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



- 30 [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];

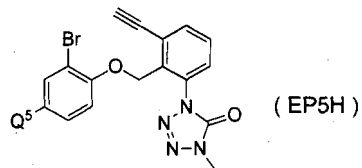
Los Compuestos EP5G-001~EP5G-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



[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];

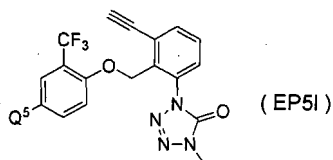
5

Los Compuestos EP5H-001~EP5H-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



10 [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];

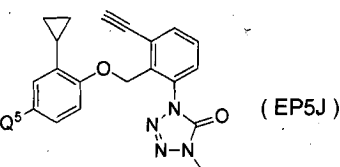
Los Compuestos EP5I-001~EP5I-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



15

[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]; y

20 Los Compuestos EP5J-001~EP5J-1023 representan compuestos representados por una fórmula:



25 [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].

[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
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-metil-pirazol-1-ilo
52	grupo 3-metil-4-propinil-pirazol-1-ilo
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-propinilo)-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
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-dimetil-pirazol-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-isobutil-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-bis-trifluorometil-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-butil)-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-butilil)-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
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-butilil)-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
254	grupo 5-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
255	grupo 1-(2-butilil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
256	grupo 1-ciclopropilmetil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
257	grupo 5-metil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
258	grupo 5-metil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
259	grupo 1-butil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
260	grupo 1-isobutil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
261	grupo 1-(3-metilbutil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 16]

sustituyentes n.º	Q ⁵
262	grupo 1-(4-metil-pentil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
263	grupo 1,4,5-trimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
264	grupo 1-etil-4,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
265	grupo 4,5-dimetil-1-isopropil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
266	grupo 1-(2,2-difluoroetil)-4,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
267	grupo 4,5-dimetil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
268	grupo 1-(2-butilil)-4,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
269	grupo 1-ciclopropilmetil-4,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
270	grupo 4,5-dimetil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
271	grupo 4,5-dimetil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
272	grupo 1-butil-4,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
273	grupo 4,5-dimetil-1-isobutil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
274	grupo 4,5-dimetil-1-(3-metilbutil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
275	grupo 4,5-dimetil-1-(4-metil-pentil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
276	grupo 4-etil-1,5-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

[Tabla 17]

sustituyentes n.º	Q ⁵
277	grupo 1,4-dietil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
278	grupo 1-isopropil-4-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
279	grupo 4-etil-1-(2,2-difluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
280	grupo 4-etil-5-metil-1-(2-propinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo

281	grupo 1-(2-butilil)-4-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
282	grupo 1-ciclopropilmetil-4-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
283	grupo 4-etil-1-(2,2,2-trifluoroetil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
284	grupo 4-etil-1-propil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
285	grupo 1-butil-4-etil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
286	grupo 4-etil-1-isobutil-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
287	grupo 4-etil-1-(3-metilbutil)-5-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-ilo
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
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-metil-butil)-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-butilil)-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-butilil)-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-butilil)-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
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-butilil)-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-butilil)-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
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-butil)-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-butil)-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-butilil)-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
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-butilil)-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-butilil)-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
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>b</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
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
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 3,4-dimetil-4-fluoro-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
624	grupo 4-cloro-3,4-dimetil-1-propil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo

[Tabla 40]

sustituyentes n.º	Q ⁵
625	grupo 4-bromo-3,4-dimetil-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-3,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
629	grupo 1-butil-4-cloro-3,4-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-5-ilo
630	grupo 1-butil-4-bromo-3,4-dimetil-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	3-cloro-1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-5-ilo
678	1,3-dimetil-3-metoxi-1 <i>H</i> -pirazol-3-5-ilo
679	3-ciano-1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-3-5-ilo
680	4-cloro-3-ciano-1-metil-1 <i>H</i> -pirazol-3-5-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
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-1,4-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
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
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-trifluorometil-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
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-metilpirazol-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-metilpirazol-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
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-dimetilpirazol-1-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-bromo-3-metilpirazol-1-ilo
902	grupo 5-etoxi-3,4-dimetilpirazol-1-ilo
903	grupo 5-etoxi-4-etil-3-metilpirazol-1-ilo
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
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-metilpirazol-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-metil pirazol-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-metilpirazol-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
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]

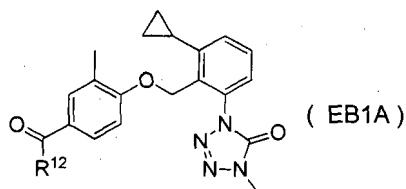
sustituyentes n.º	Q ⁵
1000	grupo 3-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo
1001	grupo 4-fluorometil-3-difluoro-5-metilpirazol-1-ilo
1002	grupo 4-cloro-3-difluorometil-5-metilpirazol-1-ilo

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:

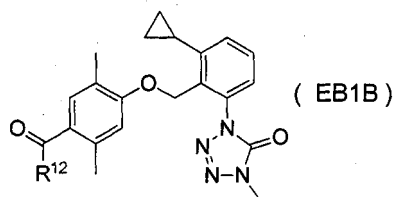
5 Compuestos EB1A-001-EB1A-20, EB1B-001-EB1B-20, EB1C-001-EB1C-20, EB1D-001-EB1D-20, EB1E-001-EB1E-20, EB2A-001-EB2A-20, EB2B-001-EB2B-20, EB2C-001-EB2C-20, EB3A-001-EB3A-20, EB3B-001-EB3B-20, EB3C-001-EB3C-20, EB4A-001-EB4A-20, EB4B-001-EB4B-20, EB5A-001-EB5A-20, EB5B-001-EB5B-20 y EB5C-001-EB5C-20.

10 Los Compuestos EB1A-001-EB1A-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



15 [en la fórmula (EB1A), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

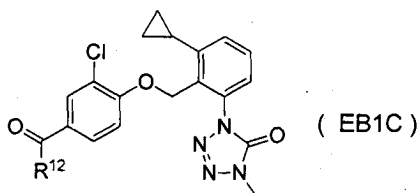
Los Compuestos EB1B-001-EB1B-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



[en la fórmula (EB1B), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

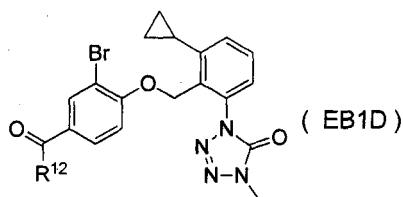
5

Los Compuestos EB1C-001~EB1C-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



10 [en la fórmula (EB1C), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

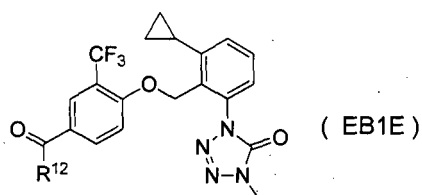
Los Compuestos EB1D-001~EB1D-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



15

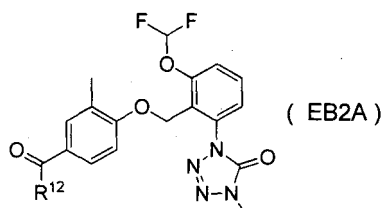
[en la fórmula (EB1D), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

20 Los Compuestos EB1E-001~EB1E-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



25 [en la fórmula (EB1E), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

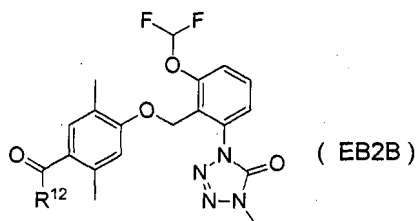
Los Compuestos EB2A-001~EB2A-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



30

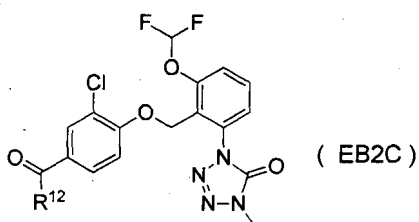
[en la fórmula (EB2A), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB2B-001-EB2B-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



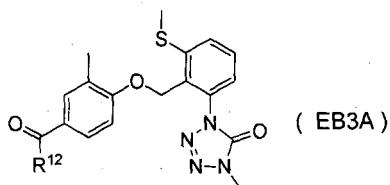
- 5 [en la fórmula (EB2B), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB2C-001-EB2C-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



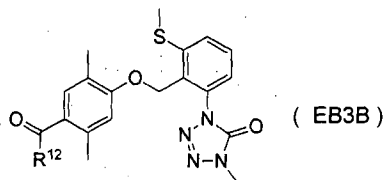
- 10 [en la fórmula (EB2C), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

- 15 Los Compuestos EB3A-001-EB3A-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



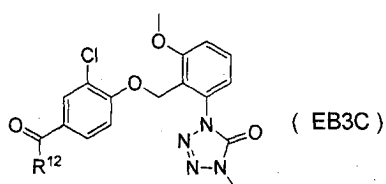
- 20 [en la fórmula (EB3A), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB3B-001-EB3B-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



- 25 [en la fórmula (EB3B), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

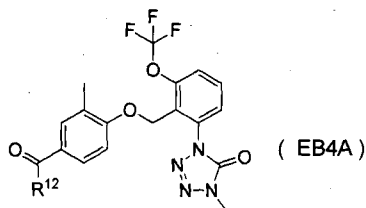
Los Compuestos EB3C-001-EB3C-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



- [en la fórmula (EB3C), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

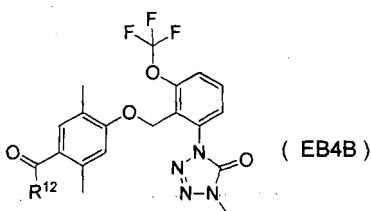
Los Compuestos EB4A-001-EB4A-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



5

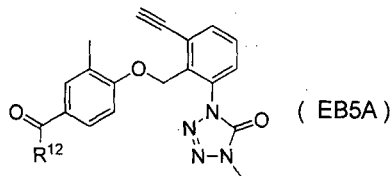
[en la fórmula (EB4A), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

10 Los Compuestos EB4B-001-EB4B-20 representan Compuestos representados por una fórmula:



15 [en la fórmula (EB4B), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB5A-001-EB5A-20 representan Compuestos representados por una fórmula:

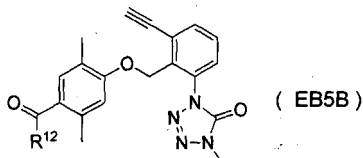


20

[en la fórmula (EB5A), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación];

Los Compuestos EB5B-001-EB5B-20 representan Compuestos representados por una fórmula:

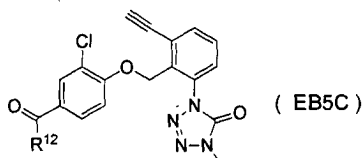
25



[en la fórmula (EB5B), R^{12} representa un sustituyente correspondiente a cada uno de los sustituyentes n.º 1 a 20 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación]; y

30

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 indicados en la Tabla B1 como se menciona a continuación].

[Tabla B1]

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>terc</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

5 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.

Ejemplo de formulación 1

10 Cincuenta (50) partes de uno cualquiera de los presenters Compuestos 1 a 53, 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.

Ejemplo de formulación 2

15 Veinte (20) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 53, 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
20 de una solución acuosa que contenía 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.

Ejemplo de formulación 3

25 Dos (2) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 53, 88 partes de arcilla de caolina y 10 partes de talco se muelen en mezcla para obtener una formulación.

Ejemplo de formulación 4

30 Cinco (5) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 53, 14 partes de polioxietilen estiril fenil éter, 6

partes de dodecibenceno sulfonato de calcio y 75 partes de xileno se muelen en mezcla para obtener una formulación.

Ejemplo de formulación 5

Dos (2) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 53, 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.

Ejemplo de formulación 6

Diez (10) partes de uno cualquiera de los presentes Compuestos 1 a 53, 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.

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

Una olla de plástico se llenó con tierra y al mismo tiempo el arroz (cv; Nipponbare) las semillas se sembraron y las plantas se cultivaron en un invernadero durante veinte días. A continuación, cada uno de los presentes Compuestos 2, 3, 6, 15, 17 y 24 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 y a 20 °C durante la noche en una alta humedad 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 2, 3, 6, 15, 17 y 24 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 2

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, 4, 5, 6, 7, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 18, 21, 22, 23, 24 y 25 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 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 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, 4, 5, 6, 7, 10, 11, 12, 13 14, 15, 18, 21, 22, 23, 24 y 25 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 3

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, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 21, 22, 23, 24 y 25 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 ° 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, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13 14, 15, 16, 17, 18, 21, 22, 23, 24 y 25 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, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 24, 37 y 39 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, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 24, 37 y 39 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 llevó 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 1, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 22, 23, 24 y 25 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. 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, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 22, 23, 24 y 25 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 6

Una maceta de plástico se llevó 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 1, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 22, 23, 24, 37 y 39 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, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 22, 23, 24, 37 y 39 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

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 1, 6, 7, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 18, 20, 21, 24, 25, 28, 33, 34, 36, 37, 42, 43, 44, 45 y 46 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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 a 20 °C durante la noche en una alta humedad 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 1, 6, 7, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 18, 20, 21, 24, 25, 28, 33, 34, 36, 37, 42, 43, 44, 45 y 46 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 8

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 2, 3, 4, 5, 6, 7, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 17, 18, 20, 25, 28, 33, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 43, 44, 45 y 46 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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 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 2, 3, 4, 5, 6, 7, 9, 10, 12, 13, 14 15, 17, 18, 20, 25, 28, 33, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 43, 44, 45 y 46 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, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 21, 25, 28, 33, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 43, 44, 46 y 52 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14 15, 16, 18, 21, 25, 28, 33, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 43, 44, 46 y 52 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 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 21, 22, 23, 25, 28, 34 35, 36 y 45 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 (*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 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 21, 22, 23, 25, 28, 34, 35, 36 y 45 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 llevó 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, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 21, 25, 28, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 44, 45, 46 y 52 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 21, 25, 28, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 44, 45, 46 y 52 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 12

Una maceta de plástico se llevó 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, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 20, 25, 28, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 43, 44, 45 y 46 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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 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 2, 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 20, 25, 28, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 43, 44, 45 y 46 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

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, 5, 6, 7, 11, 12, 13, 14, 15, 18, 21, 22, 24, 25, 28, 34, 36, 37, 39, 43, 44, 45 y 46 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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 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 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, 5, 6, 7, 11, 12, 13, 14, 15, 18, 21, 22, 24, 25, 28, 34, 36, 37, 39, 43, 44, 45 y 46 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 14

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, 4, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 28, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 44, 43, 44, 45, 46 y 52 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente 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 (*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 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, 4, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 13, 14 15, 16, 17, 18, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 28, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 44, 43, 44, 45, 46 y 52 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 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 6 y 7 se prepararon a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación anteriormente mencionados y después se diluyeron 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 6 y 7 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 16

Una maceta de plástico se llevó 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 uno de los presentes Compuestos 35, 37, 39, 42, 43 y 44 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 35, 37, 39, 42, 43 y 44 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

Ejemplo de prueba 17

Una maceta de plástico se llevó 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 uno de los presentes compuestos 13, 14, 18, 22, 23, 24, 25, 28, 33, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 43, 44, 45 y 46 se preparó a una formulación de acuerdo con los ejemplos de formulación antes mencionados y después se diluyó con agua para obtener una concentración

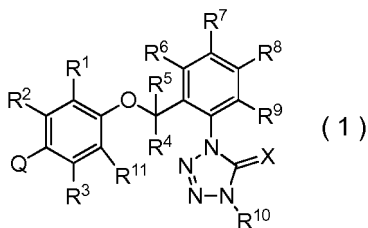
predeterminada (200 ppm). Las diluciones se pulverizaron a partes foliares para adherirse adecuadamente sobre las hojas del pepino anteriormente mencionado. Después de pulverizar las diluciones, las plantas se secaron al aire y después de 1 día, se inoculó por pulverización una suspensión acuosa de esporas 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 13, 14, 18, 22, 23, 24, 25, 28, 33, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 43, 44, 45 y 46 mostraron un 30 % o menos en comparación con el área de la lesión en plantas no tratadas.

10 Ejemplo de Prueba Comparativo

Una maceta de plástico se llenó con tierra y se sembró trigo (cv; Shirogane) y las plantas se sembraron 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 el ejemplo de formulación 2 anteriormente mencionado 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 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 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.

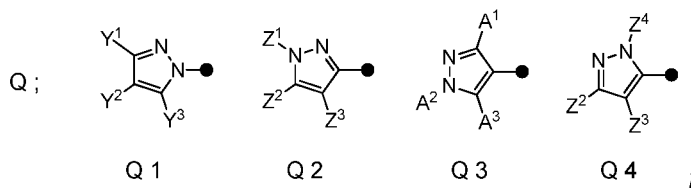
REIVINDICACIONES

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 pentafluorosulfonilo, 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquino C2-C4, un grupo haloalquino C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo alquilsulfino C1-C4, un grupo alquilsulfonilo C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4, un grupo haloalquilsulfino C1-C4, un grupo haloalquilsulfonilo C1-C4, un grupo alquilamino C1-C6, un grupo haloalquilamino C1-C6 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

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 pentafluorosulfonilo, 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 cicloalquilmétilo 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 alquenoilo C3-C6, un grupo haloalquenoilo C3-C6, un grupo alquinoilo C3-C6, un grupo haloalquinoilo C3-C6, un grupo alquenoil C3-C6, un grupo haloalquenoil C3-C6, un grupo alquinoil C3-C6, un grupo haloalquinoil C3-C6, un grupo alquilamino C1-C8, un grupo haloalquilamino C1-C8, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo 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 C2-C8, un grupo pentafluorosulfonilo, un grupo alquilalquilsililo C3-C9, un grupo alquilalquilsililo C2-C6, un grupo alcoxycarbonilo C2-C6, un grupo aminocarbonilo, 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; 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, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más 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

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, dicho anillo saturado puede contener opcionalmente uno o más 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

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, seis o siete miembros, dicho 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 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, dicho 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 sustituyentes seleccionados entre el Grupo P¹); y

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 alquiltio C1-C4 o un grupo haloalquiltio C1-C4].

2. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 1 en el que Q representa Q1.

3. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 1 en el que Q representa Q2.

4. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 1 en el que Q representa Q3.

5. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 1 en el que Q representa Q4.

6. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 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;

$R^2, R^4, R^5, R^7, R^8, R^9$ y R^{11} 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 cicloalquilo C3-C6, un grupo alquinilo C2-C4, un grupo haloalquinilo C2-C4, un grupo haloalcoxi C1-C4, un grupo alquiltio C1-C4, un grupo haloalquiltio C1-C4 o un grupo halocicloalquilo C3-C6;

R¹⁰ representa un grupo metilo; y

X representa un átomo de oxígeno.

7. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 6, en el que

Y^1 e Y^2 pueden combinarse entre sí junto con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo saturado de cinco o seis miembros:

Y^2 e Y^3 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 Y^1 , Y^2 e Y^3 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 alquililo 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 las reivindicaciones 1, 3 o 6, en el que

Z^1 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;

Z^2 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,

Z^1 y Z^2 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

Z^3 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

Y^1 e Y^2 están conectados entre sí para representar $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, que se combina junto con los átomos de carbono a los que Y^1 e Y^2 están unidos para formar un anillo de seis miembros;

Y^2 e Y^3 están conectados entre sí para representar $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, que se combina junto con los átomos de carbono a los que Y^2 e Y^3 están unidos para formar un anillo de seis miembros;

cuando cada uno de Y^1 , Y^2 e Y^3 no forman el anillo saturado de seis miembros,

Y^1 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3 o un grupo ciclopropilo;

Y^2 representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo ciano o un grupo alcoxi C1-C3; y

Y^3 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

Z^1 representa un grupo alquilo C1-C6;

Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo alquilo C1-C6, un grupo haloalquilo C1-C6, un grupo ciano, un grupo alcoxi C1-C6 o un grupo alquiltio C1-C6; y

Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C4.

11. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3 o 6, en el que

Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3;

Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo metiltio, un grupo ciano, un grupo trifluorometilo o un grupo alquilo C1-C3; y

Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo metilo.

12. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 6 u 8, en el que

Z^1 representa un grupo alquilo C1-C3;

Z^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metoxi, un grupo metiltio, un grupo trifluorometilo, un grupo ciano o un grupo alquilo C1-C3; y

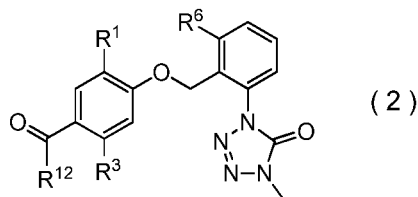
Z^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un grupo metilo.

13. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 12, en el que

R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo o un grupo trifluorometilo;

R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo; y R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo etinilo, un grupo difluorometoxi o un grupo metiltio.

14. Un compuesto de tetrazolinona de una fórmula (2):



[en la que

R^1 representa un grupo metilo, un grupo etilo, un átomo de cloro, un átomo de bromo, un grupo trifluorometilo o un grupo ciclopropilo;

R^3 representa un átomo de hidrógeno o un grupo metilo;

R^6 representa un grupo ciclopropilo, un grupo difluorometoxi, un grupo etinilo o un grupo metiltio; y

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

- 5 15. El compuesto de tetrazolinona de acuerdo con la reivindicación 14,
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 ciclopropilo; y
R¹² representa un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo ciclopropilo.
- 10 16. Un agente para controlar plagas que comprende el compuesto de tetrazolinona de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15.
- 15 17. 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 15.
18. Uso del compuesto de tetrazolinona según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 15 para controlar plagas en plantas o en el suelo.