

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 824 119**

51 Int. Cl.:

C07D 403/14	(2006.01)	C07D 239/72	(2006.01)
C07D 403/12	(2006.01)	C07D 487/04	(2006.01)
C07D 495/04	(2006.01)	C07D 498/04	(2006.01)
A01N 43/54	(2006.01)	C07D 513/04	(2006.01)
A01P 3/00	(2006.01)		
A01P 7/02	(2006.01)		
A01P 7/04	(2006.01)		
A01P 1/00	(2006.01)		
A01P 5/00	(2006.01)		
C07D 409/14	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **17.05.2016 PCT/CN2016/082291**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **24.11.2016 WO16184378**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **17.05.2016 E 16795865 (1)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **09.09.2020 EP 3299366**

54 Título: **Compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidina, y método de preparación y uso de los mismos como pesticidas**

30 Prioridad:

18.05.2015 CN 201510252832

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
11.05.2021

73 Titular/es:

SHENYANG SINOCEM AGROCHEMICALS R & D CO., LTD. (100.0%)
No.8-1 Shenliao Dong Road Tiexi District
Shenyang, Liaoning 110021, CN

72 Inventor/es:

LIU, CHANGLING;
GUAN, AIYING;
WANG, JUNFENG;
SUN, XUFENG;
LI, ZHINIAN;
ZHANG, JINBO;
BAN, LANFENG;
MA, SEN;
LAN, JIE;
XIA, XIAOLI y
YANG, JINLONG

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 824 119 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

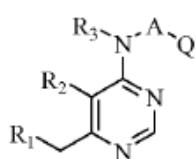
Compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidina, y método de preparación y uso de los mismos como pesticidas

Campo de la invención

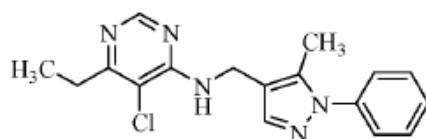
La invención se refiere a fungicidas, insecticidas y acaricidas. Más específicamente, a la preparación de compuestos de pirazol sustituidos novedosos que contienen pirimidinilo y a la aplicación de los mismos.

Antecedentes de la invención

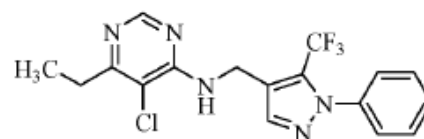
En la patente WO9507278 se divulgaron los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo que tienen fórmula general y los compuestos específicos CK1 y CK2 aplicados como fungicida, insecticida y acaricida en agricultura.



fórmula general

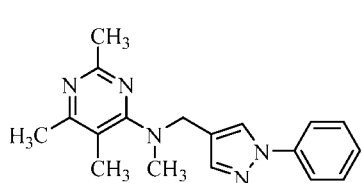


CK1

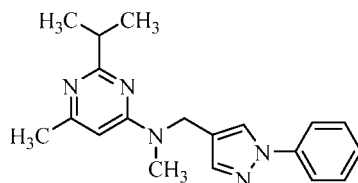


CK2

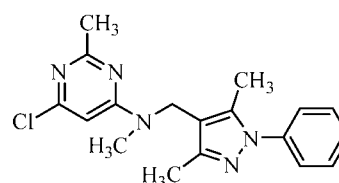
Los siguientes compuestos CK3, CK4 y CK5 se recuperaron a través de la base de datos SciFinder sin bibliografía específica divulgada.



CK3



CK4



CK5

Sin embargo, los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo representados por la fórmula general I de la presente invención no se han notificado en la bibliografía anterior.

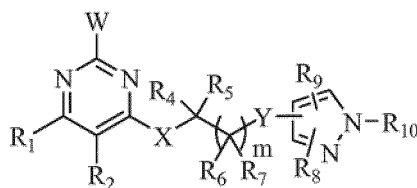
El documento WO 2006/071988 A1 divulga derivados de tienopirimidina particulares para inhibir enzimas PDE10 y, por lo tanto, para el tratamiento de síndromes neurológicos y psiquiátricos o un estado patológico modulado por la actividad de PDE10.

Sumario de la invención

Un objetivo de la presente invención es proporcionar compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo y una aplicación de los mismos, que se pueden usar para preparar fungicidas, insecticidas y acaricidas frente a hongos, bacterias, insectos y ácaros dañinos en el campo agrícola u otros campos.

Con el fin de alcanzar el fin anterior, las descripciones detalladas de la divulgación son como sigue:

La presente divulgación proporciona un tipo de compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo que tienen una estructura como se representa por la fórmula general I:



I

en donde:

R₁ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, cicloalquilo

C₃-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquenilo C₂-C₁₂, haloalquenilo C₂-C₁₂, alquinilo C₂-C₁₂, haloalquinilo C₂-C₁₂, alquenoxi C₃-C₁₂, haloalquenoxi C₃-C₁₂, alquinox C₃-C₁₂, haloalquinox C₃-C₁₂, alquilamino C₁-C₁₂, di(alquilo C₁-C₁₂)amino, alquilaminocarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilaminocarbonilo C₁-C₁₂, alcocixarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxixarbonilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂ o alquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂;

R₂ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, CHO, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂;

R₁, R₂ y su anillo de pirimidina conjunto también pueden formar un anillo de cinco miembros, anillo de seis miembros, anillo de siete miembros o anillo de ocho miembros que contiene un átomo de carbono, átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre;

X se selecciona entre NR₃, O o S;

Y se selecciona entre NR₃, O o S;

R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂, alqueniltio C₂-C₁₂, alquenilo C₂-C₁₂, alquinilo C₂-C₁₂, haloalquenilo C₂-C₁₂, haloalquinilo C₂-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₂, di(alquil C₁-C₁₂)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₁₂, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₁₂, cicloalquiloalcoxixarbonilo C₃-C₁₂, alquilcarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilcarbonilo C₁-C₁₂, alcocixarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxixarbonilo C₁-C₁₂, alquilcarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alcocixarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquilaminocarbonilo C₁-C₁₂, di(alquil C₁-C₁₂)aminocarbonilo, alquenoxixarbonilo C₂-C₁₂, alquinoxixarbonilo C₂-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alcocixarbonilo C₁-C₁₂, alquilaminotio C₁-C₁₂, di(alquil C₁-C₁₂)aminotio, (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₆, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxixarbonilo, (hetero)aril-alquiloalcoxixarbonilo C₁-C₆ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 grupos siguientes: halo, nitro, ciano, alquilo C₁-C₆ haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₈;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₈; el número entero m se selecciona entre 0 y 5;

R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcocixarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxixarbonilo C₁-C₁₂, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxixarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcocixarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxixarbonilo C₁-C₁₂, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxixarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₁₀ se selecciona entre alquilo C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₈, haloalquilo C₁-C₁₂, alquilcarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilcarbonilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alcocixarbonilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alcocixarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxixarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₁₂, alquilamino C₁-C₁₂, haloalquilamino C₁-C₁₂, di(alquilo C₁-C₁₂)amino, halo-di(alquil C₁-C₁₂)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂, alquenilo C₂-C₁₂, alquinilo C₂-C₁₂, alquenoxi C₂-C₁₂, haloalquenoxi C₂-C₁₂, alquinox C₂-C₁₂, haloalquinox C₂-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilcarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilcarbonilo C₁-C₁₂, alcocixarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxixarbonilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alcocixarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalcoxixarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquiltiocarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalquiltiocarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquilcarboniloxi C₁-C₁₂, haloalquilcarboniloxi C₁-C₁₂, alcocixarboniloxi C₁-C₁₂, haloalcoxixarboniloxi C₁-C₁₂, alquilsulfoniloxi C₁-C₁₂, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂-alcoxi C₁-C₁₂;

R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₁₂ o haloalquilo C₁-C₁₂; W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂ o alquilsulfonilo C₁-C₁₂;

La posición de Y unido al anillo de pirazol es de entre la posición 3, la posición 4 o la posición 5. Cuando Y está unido a la posición 3 del pirazol, R₈ está en la posición 4, R₉ está en la posición 5; cuando Y está unido a la posición 4 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 5; cuando Y está unido a la posición 5 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 4; o las sales formadas a partir de los compuestos representados por la fórmula general I. La invención se define en las reivindicaciones 1 y 8 a 11. Se exponen rasgos preferidos en las reivindicaciones dependientes.

En los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de la presente divulgación, los compuestos preferidos incluyen: en la fórmula general I:

R₁ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alquenoxi C₃-C₆, haloalquenoxi C₃-C₆,

alquinox C₃-C₆, haloalquinox C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆)amino, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, haloalquilaminocarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ o alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆;

R₂ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, CHO, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

R₁, R₂ y su anillo de pirimidina conjunto también pueden formar un anillo de cinco miembros o anillo de seis miembros que contiene un átomo de carbono, átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre;

X se selecciona entre NR₃, O o S;

Y se selecciona entre NR₃, O o S;

R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, alqueniitio C₂-C₆, alqueniilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalqueniilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilaminosulfonilo C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilaminosulfonilaminosulfonilo C₁-C₆, cicloalquiloalcoxycarbonilo C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, alquinoxycarbonilo C₂-C₆, alquinoxycarbonilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilaminotio C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)aminotio, (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₆, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquiloalcoxycarbonilo C₁-C₆ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₆ no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 grupos siguientes: halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₆;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₆; el número entero m se selecciona entre 0 y 4;

R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₁₀ se selecciona entre alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, haloalquilamino C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆)amino, halodi(alquil C₁-C₆)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alqueniilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquenoxi C₂-C₆, haloalquenoxi C₂-C₆, alquinox C₂-C₆, haloalquinox C₂-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltiocarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilsulfoniloxi C₁-C₆, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₆, alcoxycarboniloxi C₁-C₆, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₆, alquilsulfoniloxi C₁-C₆, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆;

R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆ o alquilsulfonilo C₁-C₆;

la posición de Y unido al anillo de pirazol es de entre la posición 3, la posición 4 o la posición 5. Cuando Y está unido a la posición 3 del pirazol, R₈ está en la posición 4, R₉ está en la posición 5; cuando Y está unido a la posición 4 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 5; cuando Y está unido a la posición 5 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 4; o las sales formadas a partir de los compuestos preferidos representados por la fórmula general I anterior.

En los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de la presente divulgación, los compuestos más preferidos incluyen: en la fórmula general I:

R₁ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alqueniilo C₂-C₄, haloalqueniilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alquenoxi C₃-C₄, haloalquenoxi C₃-C₄, alquinox C₃-C₄, haloalquinox C₃-C₄, alquilamino C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)amino, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, haloalquilaminocarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄;

R₂ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, CHO, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R₁, R₂ y su anillo de pirimidina conjunto también pueden formar un anillo de cinco miembros o anillo de seis miembros que contiene un átomo de carbono, átomo de nitrógeno, átomo de oxígeno o átomo de azufre;

X se selecciona entre NR₃, O o S;

R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquiltio C₁-C₄, alqueniltio C₂-C₄, alqueniilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalqueniilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilaminosulfonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₄, cicloalquiloalquilo C₃-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminocarbonilo, alquinoxycarbonilo C₂-C₄, alquinoxycarbonilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilaminotio C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminotio, (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₄, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquiloalquilo C₁-C₄ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₄ no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 grupos siguientes: halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄; el número entero m se selecciona entre 0 y 3;

R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

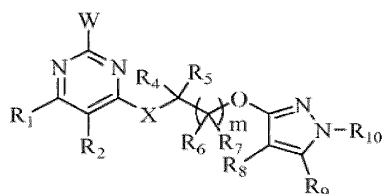
R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₁₀ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

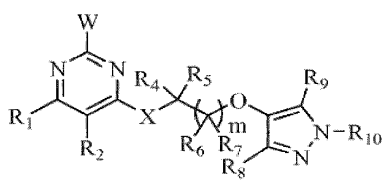
R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilamino C₁-C₄, haloalquilamino C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)amino, halodi(alquil C₁-C₄)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alqueniilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquenoxi C₂-C₄, haloalquenoxi C₂-C₄, alquinox C₂-C₄, haloalquinox C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₄, haloalquilcarboniloxi C₁-C₄, alcoxycarboniloxi C₁-C₄, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄;

R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o alquilsulfonilo C₁-C₄;

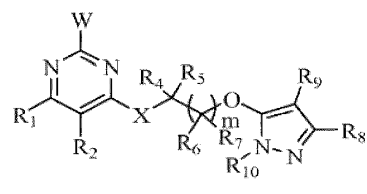
Y es O, la posición de Y unido al anillo de pirazol es de entre la posición 3, la posición 4 o la posición 5. Cuando O está unido a la posición 3 del pirazol, R₈ está en la posición 4, R₉ está en la posición 5, la fórmula general I se representa por la fórmula general I-1; cuando Y está unido a la posición 4 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 5, la fórmula general I se representa por la fórmula general 1-2; cuando Y está unido a la posición 5 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 4, la fórmula general I se representa por la fórmula general 1-3;



I-1



I-2



I-3

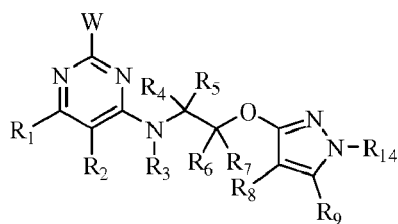
O las sales formadas a partir de los compuestos más preferidos representados por la fórmula general I anterior.

En los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de la presente divulgación, los compuestos más preferidos incluyen: en la fórmula general I:

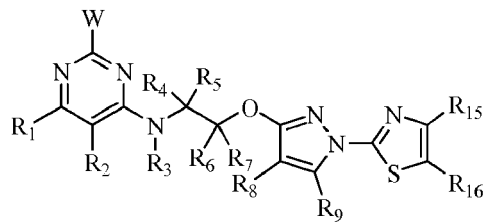
las estructuras de compuestos de fórmula general I-1 se representan por la fórmula general I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-4C, I-4F o I-4G; las estructuras de compuestos de fórmula

general 1-2 se representan por la fórmula general I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F o I-2G;

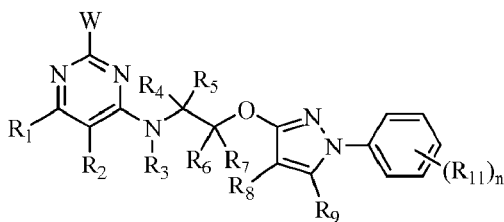
las estructuras de compuestos de fórmula general I-3 se representan por la fórmula general I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F o I-3G:



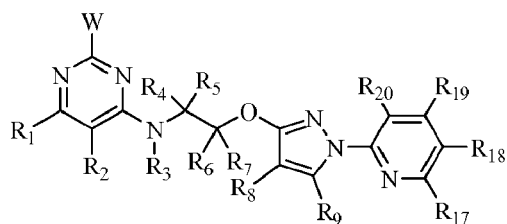
I-1A



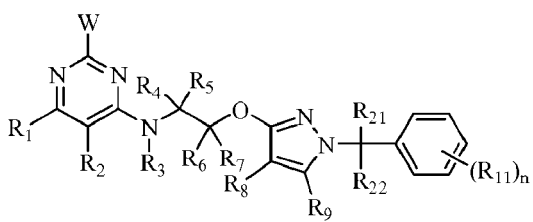
I-1B



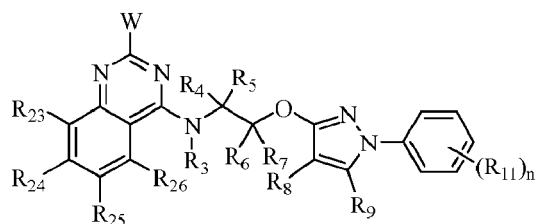
I-1C



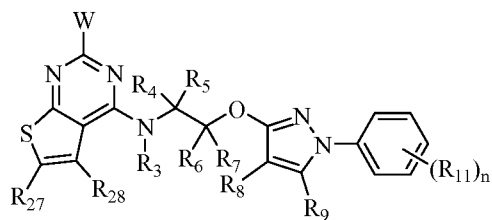
I-1D



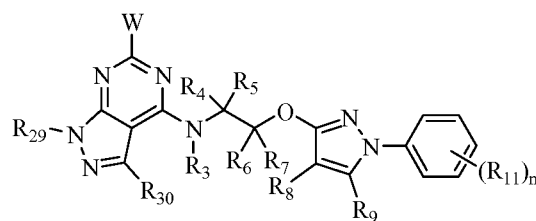
I-1E



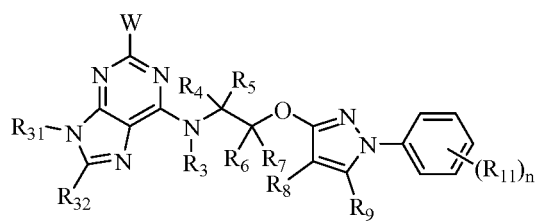
I-1F



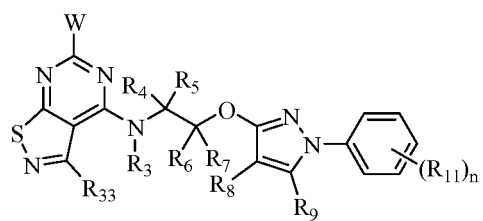
I-1G



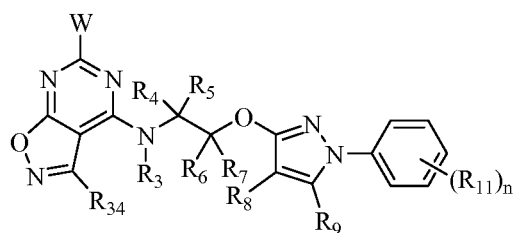
I-1H



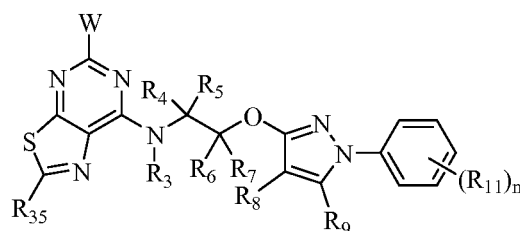
I-1I



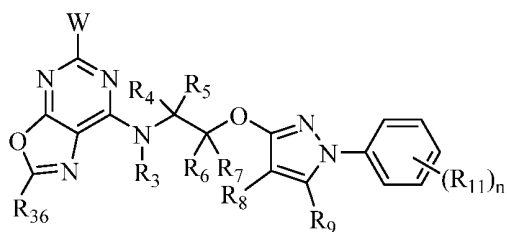
I-1J



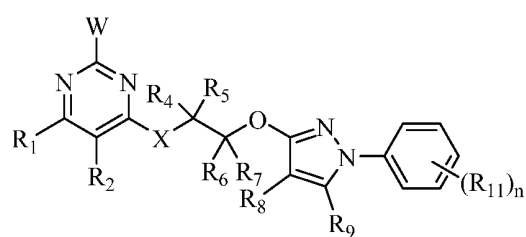
I-1K



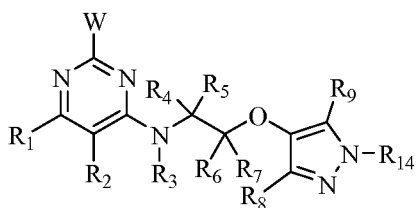
I-1L



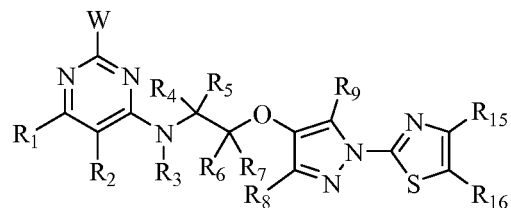
I-1M



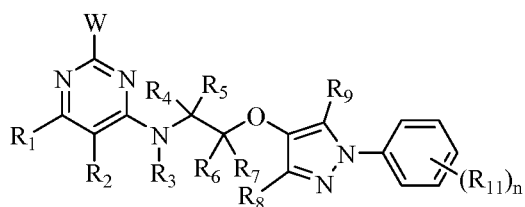
I-1N (X=O or S)



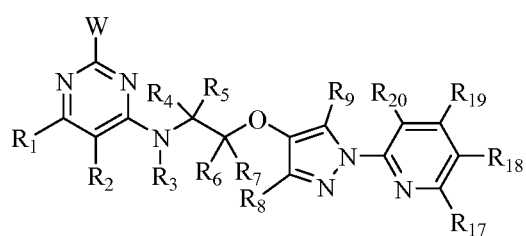
I-2A



I-2B

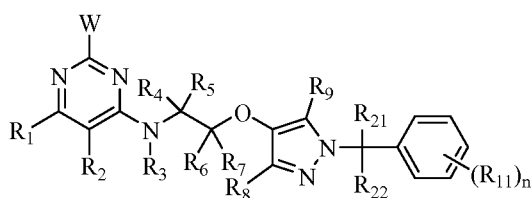


I-2C

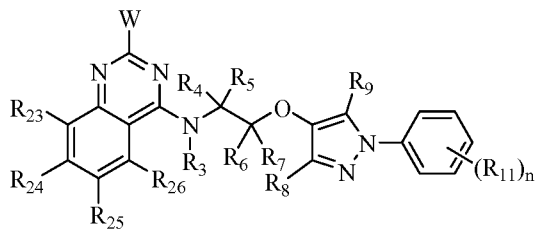


I-2D

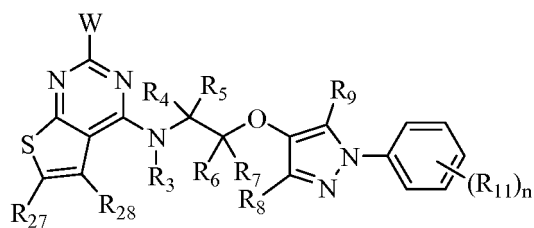
5



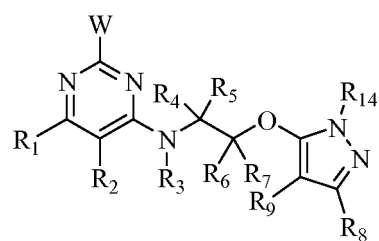
I-2E



I-2F

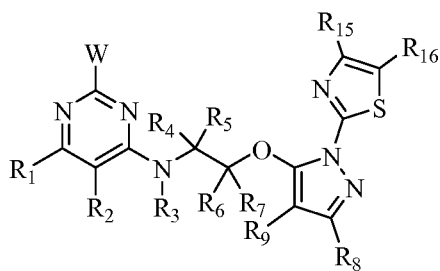
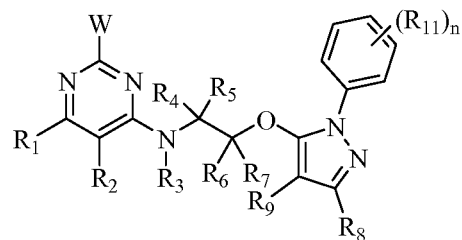
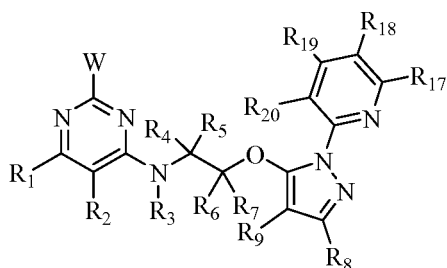
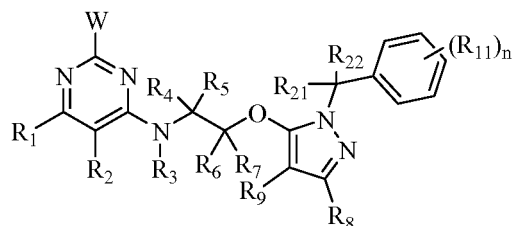
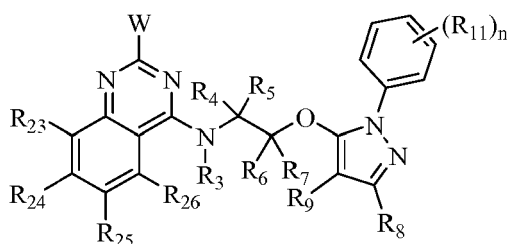
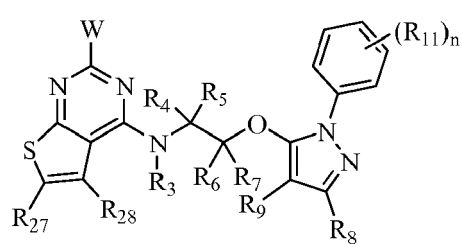
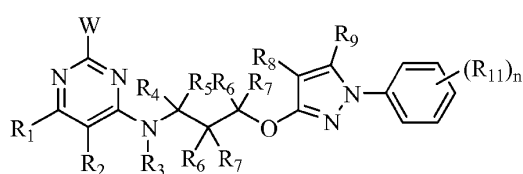
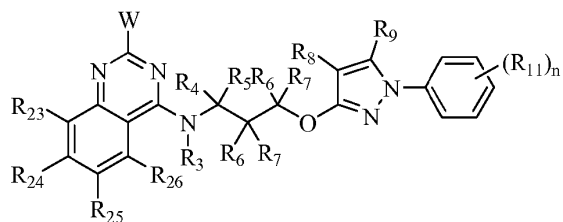
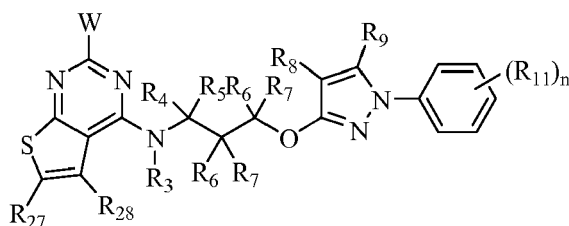


I-2G



I-3A

10

**I-3B****I-3C****I-3D****I-3E****I-3F****I-3G****I-4C****I-4F****I-4G**

5

10

En la fórmula general I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-4C, I-4F, I-4G, I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F, I-2G, I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F e I-3G, en donde:

R₁ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-

- C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alquenoxi C₃-C₄, haloalquenoxi C₃-C₄, alquinox C₃-C₄, haloalquinox C₃-C₄, alquilamino C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)amino, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, haloalquilaminocarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄;
- 5 R₂ se selecciona entre H, halógeno, ciano, nitro, amino, carboxilo, CHO, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;
- R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquiltio C₁-C₄, alqueniltio C₂-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilaminosulfonilo C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₄, cicloalquiloalcoxycarbonilo C₃-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)aminocarbonilo, alquenoxycarbonilo C₂-C₄, alquinoxycarbonilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilaminotio C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)aminotio, (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₄, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquiloalcoxycarbonilo C₁-C₄ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₄ no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 grupos siguientes: halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;
- 10 R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;
- R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;
- 15 R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
- 20 R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
- 25 R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilamino C₁-C₄, haloalquilamino C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)amino, halodi(alquilo C₁-C₄)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquenoxi C₂-C₄, haloalquenoxi C₂-C₄, alquinox C₂-C₄, haloalquinox C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₄, haloalquilcarboniloxi C₁-C₄, alcoxycarboniloxi C₁-C₄, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄;
- 30 el número entero n se selecciona entre 0 y 5, cuando n es 0, el anillo de benceno es fenilo no sustituido; cuando n es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;
- R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- R₁₄ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄;
- 35 R₁₅, R₁₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
- 40 R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;
- R₂₁, R₂₂ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, OH, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
- 45 R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₄;
- R₂₇, R₂₈ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
- 50 R₂₉ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
- 55 R₃₀ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄,

haloalcocixarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₁ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcocixarbonilo C₁-C₄, haloalcocixarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₂ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₃, R₃₄ se pueden seleccionar respectivamente entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcocixarbonilo C₁-C₄, haloalcocixarbonilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₅, R₃₆ se pueden seleccionar respectivamente entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o alquilsulfonilo C₁-C₄;

o las sales formadas a partir de los compuestos más preferidos representados por la fórmula general anterior, con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

En los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de la presente divulgación, los compuestos más preferidos incluyen: los compuestos representados por la fórmula general I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F, I-2G, I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F, I-3G, I-4C, I-4F o I-4G:

en donde:

R₁ se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, NH₂, carboxilo, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CF₃, CH₂OCH₃, CH₂OCH₂CH₃ o CH₂OCH₂CF₃;

R₂ se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, NH₂, carboxilo, CHO, CH₃, C₂H₅, OCH₃, OC₂H₅ u OCH₂CF₃;

R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, COCH₃, COC₂H₅, COC₃H₇, COCF₃, CPh, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉,

s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, OCH₂CF₃, , SCH₃, SC₂H₅, CH₂CH=CH₂, CH₂C≡CH, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, SO₂CH₂CF₃, SO₂NHCH₃, SO₂NHC₂H₅, SO₂N(CH₃)₂, SO₂N(C₂H₅)₂, CONHSO₂CH₃, COOCH₃, COOC₂H₅, COOC₃H₇-n, COOC₃H₇-i, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, COOCH=CH₂, COOC=CH, SNHCH₃, SNHC₂H₅ o SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, OCH₃, OC₂H₅, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O o t-C₄H₉O;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, OCH₃, OC₂H₅, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O o t-C₄H₉O;

R₈ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ o CF₃;

R₉ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ o CF₃;

R₁₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CN, NH₂, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, COOCH₃, COOC₂H₅, CONH₂, CONHCH₃, CONHC₂H₅ o CON(CH₃)₂;

el número entero n se selecciona entre 0 y 5, cuando n es 0, el anillo de benceno es fenilo no sustituido; cuando n es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;

R₁₄ se selecciona entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, ciclopropilo, ciclobutilo, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃ o CH₂CF₃;

R₁₅, R₁₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ u OCF₃;

R₂₁, R₂₂ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, OH, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃ u OCH₂CF₃;

R₂₇, R₂₈ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₂₉ se selecciona entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ciclopropilo, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, COC₂H₅, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₀ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₁ se selecciona entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ciclopropilo, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, COC₂H₅, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₂ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₃, R₃₄ se pueden seleccionar respectivamente entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ciclopropilo, COCH₃, COC₂H₅, COOCH₃, COOC₂H₅, COOCH₂CF₃, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₅, R₃₆ se pueden seleccionar respectivamente entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituido o sustituido adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

W se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, SCH₃, SC₂H₅, SO₂CH₃ o SO₂CH₂CH₃;

o las sales formadas a partir de los compuestos más preferidos representados por la fórmula general anterior, con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

En los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de la presente divulgación, los compuestos más preferidos incluyen: los compuestos representados por la fórmula general **I-1C**, **I-1F**, **I-1G**, **I-2C**, **I-2F**, **I-2G**, **I-4C**, **I-4F** o **I-4G**:

en donde:

R₁ se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ o CHF₂;

R₂ se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, NO₂, NH₂, CHO, CH₃, C₂H₅, OCH₃ u OC₂H₅;

R₃ se selecciona entre H, CH₃, COCH₃, COCF₃, OCH₃, SCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, SO₂NHCH₃, SO₂N(CH₃)₂, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, SNHCH₃ o SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br o CH₃;

R₆, R₇ son H;

R₈ es H;

R₉ es H;

R₁₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ u OCF₃;

el número entero n se selecciona entre 0 y 5, cuando n es 0, el anillo de benceno es fenilo no sustituido; cuando n es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I o CH₃;

R₂₇, R₂₈ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br o I;

W se selecciona entre H, F, Cl, Br, I o CH₃;

o las sales formadas a partir de los compuestos más preferidos representados por la fórmula general anterior, con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

En los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de la presente invención, los compuestos lo más preferidos incluyen: los compuestos representados por la fórmula general **I-1C**, **I-1F**, **I-1G**, **I-2C**, **I-2G**, **I-4C**, **I-4F** o **I-4G**:

en donde

R₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ o CHF₂;

R₂ se selecciona entre F, Cl, Br, I, NO₂, NH₂, CHO, CH₃ u OCH₃;

R₃ se selecciona entre H, CH₃, COCH₃, OCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂ o SN(CH₃)₂; R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente entre H o CH₃;

R₆, R₇ son H;

R₈ es H;

R₉ es H;

R₁₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ u OCF₃;
el número entero n se selecciona entre 1 y 5, cuando n es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ son H;

R₂₇ es H;

R₂₈ es H;

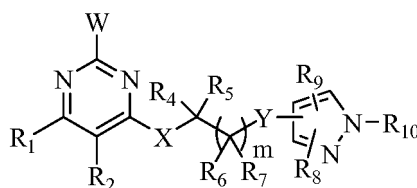
W se selecciona entre H, F, Cl, Br o I;

o las sales formadas a partir de los compuestos lo más preferidos representados por la fórmula general anterior, con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

Las expresiones usadas anteriormente para definir los compuestos de fórmula general I son como sigue:

El "halógeno" o "halo" es flúor, cloro, bromo o yodo. El "alquilo" representa alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, propilo, isopropilo o *tert*-butilo. El "cicloalquilo" es alquilo cíclico sustituido o no sustituido, tal como ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo. El sustituto o sustitutos es/son metilo, halógeno, etc. El "haloalquilo" representa alquilo de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, etc. El "alquilsulfonilo" significa un alquilo de cadena lineal o ramificado que está unido a la estructura por (-SO-), tal como metilsulfonilo. El "haloalquilsulfonilo" representa un alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificado, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "haloalquilsulfonilo" representa un alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificado, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "alquilaminotio" se refiere a -SNHCH₃, -SNHC₂H₅. El "dialquilaminotio" se refiere a -SN(CH₃)₂, -SN(C₂H₅)₂. El "alquilaminosulfonilo" se refiere a alquil-NH-SO₂-. El "dialquilaminosulfonilo" se refiere a (alquil)₂-N-SO₂-. El "alquilsulfonilaminocarbonilo" se refiere a alquil-SO₂-NH-CO-. El "alquilcarbonilaminosulfonilo" se refiere a alquil-CO-NH-SO₂-. El "alquilcarbonilalquilo" se refiere a alquil-CO-alquil-. El "alquilsulfoniloxi" tal como alquil-S(O)₂-O-. El "haloalquilsulfoniloxi" representa en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como CF₃-SO₂-O-. El "cicloalquiloxicarbonilo" significa ciclopropiloxicarbonilo, ciclohexiloicarbonilo, etc. El "alcoxi" se refiere a alquilo de cadena lineal o ramificada, que está unido a la estructura por un átomo de oxígeno. El "haloalcoxi" se refiere a alcoxi de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como clorometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, trifluoroetoxi, etc. El "haloalcoxicarbonilo" se refiere a alcoxicarbonilo de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como ClCH₂CH₂OCO-CF₃CH₂OCO-, etc. El "alcoxialquilo" significa alquil-O-alquil-, tal como -CH₂OCH₃. El "haloalcoxialquilo" se refiere a alcoxialquilo, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -CH₂OCH₂CH₂Cl, -CH₂OCH₂CF₃, etc. El "alcoxicarbonilalquilo" se refiere a alcoxicarbonil-alquil-, tal como -CH₂COOCH₃. El "haloalcoxicarbonilalquilo" se refiere a alcoxicarbonilalquilo, en el que los átomos de hidrógeno de alcoxicarbonilo pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -CH₂COOCH₂CF₃. El "alquilcarboniloxi": tal como -OCOCH₃, etc. El "haloalquilcarboniloxi" se refiere a alquilcarboniloxi, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -OCOCH₃, etc. El "alcoxicarboniloxi" se refiere a alcoxicarbonil-oxi, tal como -OCOCH₃. El "haloalcoxicarboniloxi" se refiere a alcoxicarboniloxi, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -OCOCH₃. El "alquiltiocarbonilalquilo" se refiere a alquiltiocarbonil-alquil-, tal como -CH₂COSCH₃. El "haloalquiltiocarbonilalquilo" se refiere a alquiltiocarbonilalquilo, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -CH₂COSCH₂CF₃. El "alcoxialcoxi" representa -OCH₂OCH₃, etc. El "haloalcoxialcoxi" se refiere a alcoxialcoxi, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -OCH₂OCH₃. El "alcoxialcoxicarbonilo": tal como -COOCH₂OCH₃, etc. El "alquiltio" se refiere a alquilo de cadena lineal o ramificada, que está unido a la estructura por un átomo de azufre. El "haloalquiltio" se refiere a alquiltio de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como clorometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, etc. El "alquiltioalquilo" significa alquil-S- alquil-, tal como -CH₂SCH₃. El "haloalquiltioalquilo" se refiere a alquiltioalquilo, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -CH₂SCH₂CH₂Cl, -CH₂SCH₂CF₃. El "alquilamino" se refiere a alquilo de cadena lineal o ramificada, que está unido a la estructura por un átomo de nitrógeno. El "haloalquilamino" se refiere a alquilamino de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "dialquilamino": tal como -N(CH₃)₂, -N(CH₃CH₂)₂. El "dihaloalquilamino" se refiere a dialquilamino, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como -N(CF₃)₂, -N(CH₂CF₃)₂. El "alquenilo" se refiere a alquenilo de cadena lineal o ramificada, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo y un isómero diferente de butenilo, pentenilo y hexenilo. Alquenilo también incluye polieno, tal como propa-1,2-dienilo y hexa-2,4-dienilo. El "haloalquenilo" representa alquenilo de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "alquenoxilo" se refiere a alquenilo de cadena lineal o ramificada que está unido a la estructura por oxígeno. El "haloalquenoxilo" representa un alquenoxilo de cadena lineal o ramificado, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "alquéniltio" se refiere a alquenilo de cadena lineal o ramificada, que está unido a la estructura por un átomo de azufre. Tal como -SCH₂CH=CH₂. El "alquenoxilcarbonilo" significa CH₂=CHCH₂OCO-, etc. El "alquinilo" se refiere a alquinilo de cadena lineal o ramificada, tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo y un isómero diferente de butenilo,

- pentinilo y hexinilo. Alquínilo también incluye grupos que incluyen más de un triple enlace, tales como hexa-2,5-diínilo. El "haloalquínilo" representa alquínilo de cadena lineal o ramificada, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "alquinoxilo" se refiere a alquino de cadena lineal o ramificada que está unido a la estructura por oxígeno. El "haloalquinoxilo" representa un alquinoxilo de cadena lineal o ramificado, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "alquinoxilcarbonilo" significa $-\text{COOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$, etc. El "alquilsulfonilo" significa un alquilo de cadena lineal o ramificado que está unido a la estructura por $(-\text{SO}_2-)$, tal como metilsulfonilo. El "haloalquilsulfonilo" representa un alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificado, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno. El "alquilcarbonilo" significa alquilo que está unido a la estructura por carbonilo, tal como $-\text{COCH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$. El "haloalquilcarbonilo" representa un alquilcarbonilo de cadena lineal o ramificado, en el que los átomos de hidrógeno pueden estar, todos o parcialmente, sustituidos con halógeno, tal como $-\text{COCF}_3$. El "alcoxycarbonilo" significa alcoxí que está unido a la estructura por carbonilo, tal como $-\text{COOCH}_3$, $-\text{COOCH}_2\text{CH}_3$. El "aminocarbonilo": tal como $\text{NH}_2\text{CO}-$. El "alquilaminocarbonilo" significa alquil- $\text{NH}-\text{CO}-$, tal como $-\text{CONHCH}_3$, $-\text{CONHCH}_2\text{CH}_3$. El "dialquilaminocarbonilo": tal como $-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CON}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$. El "arilo" en (hetero)arilo, (hetero)arilalquilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo, (hetero)arilcarbonilalquilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)arilalquiloxyoxycarbonilo incluye fenilo o naftilo, etc. El "heteroarilo" representa un anillo de cinco miembros o anillo de seis miembros que contiene uno o más heteroátomos de N, O, S, tales como furilo, pirazolilo, tiazolilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piridazinilo, triazinilo, quinolinilo, etc. "(Hetero)arilo" se refiere a fenilo, etc. "(Hetero)arilalquilo" significa bencilo, feniletilo, 4-clorobencilo, 2-cloro-piridin-5-ilmetilo, 2-cloro-tiazol-5-ilmetilo, etc. "(Hetero)arilcarbonilo" se refiere a benzoilo, 4-Cl-benzoilo, etc. "(Hetero) arilmetilcarbonilo" se refiere a $\text{PhCH}_2\text{CO}-$. "(Hetero)arilcarbonilalquilo" se refiere a PhCOCH_2- . "(Hetero)ariloxycarbonilo": tal como fenoxycarbonilo, *p*-clorofenoxycarbonilo, *p*-nitrofenoxycarbonilo, naftiloxycarbonilo, etc. Arilalquiloxyoxycarbonilo significa benciloxycarbonilo, *p*-clorobenciloxycarbonilo, *p*-trifluorometilbenciloxycarbonilo, etc. "(Hetero)arilalquiloxyoxycarbonilo" se refiere a $-\text{COOCH}_2\text{Ph}$, $-\text{COOCH}_2-4\text{-Cl-Ph}$, etc.
- En la fórmula general I, algunos de los sustituyentes preferidos de R_1 , R_2 , R_3 ($\text{X} = \text{NR}_3$), R_4 (R_5), R_6 (R_7), R_8 , R_9 , R_{10} y w se enumeran por separado en la tabla 1, la tabla 2, la tabla 3, la tabla 4, la tabla 5, la tabla 6, la tabla 7, la tabla 8 y la tabla 9, pero sin restringirse por ello.



I

Tabla 1 Sustituyentes R_1

R_1	R_1	R_1	R_1
H	F	Cl	Br
I	CH_3	C_2H_5	<i>n</i> - C_3H_7
<i>i</i> - C_3H_7	<i>n</i> - C_4H_9	<i>s</i> - C_4H_9	<i>i</i> - C_4H_9
<i>t</i> - C_4H_9	CF_3	CCl_3	CHF_2
CH_2Cl	CHBr_2	CF_3CH_2	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{F}$
$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{Cl}$	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{Br}$	$\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{F}$	$\text{CH}=\text{CH}_2$
$\text{C}=\text{CH}$	SCH_3	SOCH_3	SO_2CH_3
CN	NO_2	NH_2	COOH
COOCH_3	COOC_2H_5	CH_3NH	$\text{C}_2\text{H}_5\text{NH}$
OCH_3	OC_2H_5	OCF_3	$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
$\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CHCl}$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{C-I}$	$\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$
CONH_2	CONHCH_3	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	NHCH_3
NHC_2H_5	$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	$\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$	CH_2OCH_3
$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$			

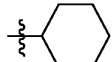
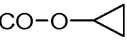
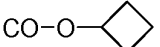
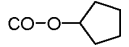
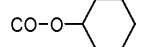
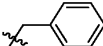
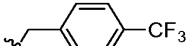
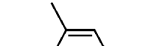
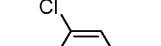
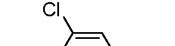
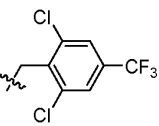
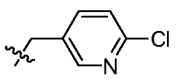
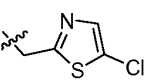
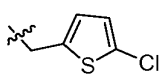
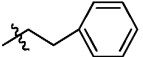
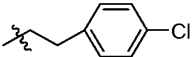
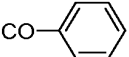
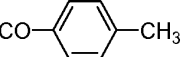
Tabla 2 Sustituyentes R_2

R_2	R_2	R_2	R_2
H	F	Cl	Br
I	CN	NO_2	NH_2
CHO	CH_3	C_2H_5	<i>n</i> - C_3H_7

(continuación)

R ₂	R ₂	R ₂	R ₂
<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉
<i>t</i> -C ₄ H ₉	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₃ H ₇ - <i>n</i>
OC ₃ H ₇ - <i>i</i>	OC ₄ H ₉ - <i>n</i>	OC ₄ H ₉ - <i>i</i>	OC ₄ H ₉ - <i>t</i>
OCH ₂ F	OCHF ₂	OCF ₃	OCH ₂ CF ₃

Tabla 3 Sustituyentes R₃

R ₃	R ₃	R ₃	R ₃
H	OH	-C(=O)H	CBr ₃
CH ₃	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇
<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CCl ₃
CH ₂ Br	CHF ₂	CHBr ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	CHCl ₂	CCl ₃	CH ₂ F
OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH(CH ₃) ₂	OC(CH ₃) ₃
OCF ₃	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ F	OCHF ₂
SCH ₃	SC ₂ H ₅	SCH ₂ CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CCl ₂	C≡CH	CH ₂ C≡CH
CH ₂ C≡C-I	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ Cl	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Cl
CH ₂ SCH ₃	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
CH ₂ SCH ₂ Cl	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ Cl	SOCH ₃
SOC ₂ H ₅	SOCF ₃	SOCH ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₃
SO ₂ C ₂ H ₅	SO ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₂ CF ₃	SO ₂ NHCOCH ₃
SO ₂ NHCH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₃	CONHSO ₂ CH ₃	COCH ₃
COC ₂ H ₅	CO- <i>n</i> -C ₃ H ₇	CO- <i>i</i> -C ₃ H ₇	CO- <i>n</i> -C ₄ H ₉
CO- <i>i</i> -C ₄ H ₉	CO- <i>t</i> -C ₄ H ₉	COCF ₃	COCH ₂ Cl
COOCH ₃	COOC ₂ H ₅	COO- <i>n</i> -C ₃ H ₇	COO- <i>t</i> -C ₄ H ₉
COOCF ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl	COOCH ₂ CF ₃	CH ₂ COOCH ₃
CH ₂ COOC ₂ H ₅	CH ₂ COCH ₃	CH ₂ COC ₂ H ₅	CONHCH ₃
CONHC ₂ H ₅	CONH- <i>t</i> -C ₄ H ₉	CON(CH ₃) ₂	CON(C ₂ H ₅) ₂
COOCH ₂ CH=CH ₂	COOCH ₂ C≡CH	COOCH ₂ OCH ₃	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₃
SNHCH ₃	SNHC ₂ H ₅	SN(CH ₃) ₂	SN(C ₂ H ₅) ₂
			
			
			
			
			
			

(continuación)

R ₃	R ₃	R ₃	R ₃

Tabla 4 Sustituyentes R₄ (R₅)

R ₄ (R ₅)	R ₄ (R ₅)	R ₄ (R ₅)	R ₄ (R ₅)
H	F	Cl	Br
I	CH ₃	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇
<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉
<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
OC ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	<i>n</i> -C ₄ H ₉ O
<i>s</i> -C ₄ H ₉ O	<i>i</i> -C ₄ H ₉ O	<i>t</i> -C ₄ H ₉ O	OCF ₃
OCH ₂ CF ₃			
CR₄R₅			

5

Tabla 5 Sustituyentes R₆ (R₇)

R ₆ (R ₇)	R ₆ (R ₇)	R ₆ (R ₇)	R ₆ (R ₇)
H	F	Cl	Br
I	CH ₃	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇
<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉
<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
OC ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	<i>n</i> -C ₄ H ₉ O
<i>s</i> -C ₄ H ₉ O	<i>i</i> -C ₄ H ₉ O	<i>t</i> -C ₄ H ₉ O	OCF ₃
OCH ₂ CF ₃			
CR₆R₇			

Tabla 6 Sustituyentes R₈

R ₈	R ₈	R ₈	R ₈
H	CN	CH ₃	C ₂ H ₅
<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉
<i>i</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃
CHF ₂	CH ₂ F	CH ₂ Cl	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	COOCH ₃	Ph	Ph-4-Cl

Tabla 7 Sustituyentes R₉

R ₉	R ₉	R ₉	R ₉
H	CN	CH ₃	C ₂ H ₅
<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉
<i>i</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃
CHF ₂	CH ₂ F	CH ₂ Cl	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	COOCH ₃	Ph	Ph-4-Cl

5

Tabla 8 Sustituyentes R₁₀

R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀
CH ₃	Et	<i>n</i> -Pr	<i>i</i> -Pr	<i>n</i> -Bu
<i>i</i> -Bu	<i>s</i> -Bu	<i>t</i> -Bu	CH ₂ F	CHF ₂
CF ₃	CH ₂ CF ₃	COCH ₃	COEt	CO- <i>n</i> -Pr
CO- <i>n</i> -Bu	CO- <i>t</i> -Bu	COCF ₃	CO ₂ CH ₃	CO ₂ Et
CO ₂ - <i>n</i> -Pr	CO ₂ - <i>i</i> -Pr	CO ₂ - <i>t</i> -Bu	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃

(continuación)

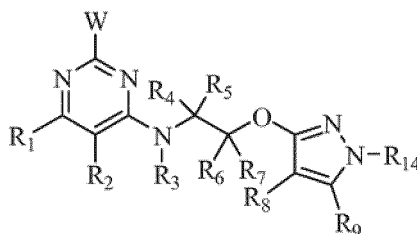
R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀

Tabla 9 Sustituyentes W

W	W	W	W	W
H	<i>i</i> -C ₃ H ₇	CHF ₂	OCH ₃	SCH ₃
F	<i>n</i> -C ₄ H ₉	CHBr ₂	OC ₂ H ₅	SC ₂ H ₅
Cl	<i>i</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	OC ₃ H _{7-n}	SC ₃ H _{7-n}
Br	CH ₃	CH(CH ₃)F	OC ₃ H _{7-i}	SC ₃ H _{7-i}
I	C ₂ H ₅	CH(CH ₃)Cl	OC ₄ H _{9-n}	SC ₄ H _{9-n}
	CHCl ₂	CH(CH ₃)Br	OC ₄ H _{9-i}	SC ₄ H _{9-i}
	CCl ₃	CH(<i>n</i> -C ₄ H ₉)F	OC ₄ H _{9-t}	SC ₄ H _{9-t}
		C(CH ₃) ₂ F	OCF ₃	SO ₂ CH ₃
		<i>n</i> -C ₃ H ₇	OCH ₂ CF ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉

5 En la fórmula general I, algunos de los compuestos de la presente divulgación también se explican mediante los siguientes compuestos enumerados de la tabla 10 a la tabla 128, pero sin restringirse por ello. En la fórmula general I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F, I-2G, I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F o I-3G, W = R₆ = R₇ = R₈ = R₉ = R₂₃ = R₂₄ = R₂₅ = R₂₆ = R₂₇ = H.

10 En la fórmula general I-1A,



I-1A

15 R₁ = Cl, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₄ se refieren a la tabla 10, los compuestos representativos se codifican como 10-1-10-15. Los grupos marcados con * están fuera de la reivindicación 1.

Tabla 10

N.º	R ₁₄	N.º	R ₁₄	N.º	R ₁₄
10-1	CH ₃ *	10-2	C ₂ H ₅ *	10-3	<i>n</i> -C ₃ H ₇ *
10-4	<i>i</i> -C ₃ H ₇ *	10-5	<i>n</i> -C ₄ H ₉ *	10-6	<i>s</i> -C ₄ H ₉ *
10-7	<i>i</i> -C ₄ H ₉ *	10-8	<i>t</i> -C ₄ H ₉ *	10-9	CF ₃
10-10	CH ₂ CF ₃	10-11	CF ₂ CF ₃	10-12	
10-13		10-14		10-15	

Tabla 11: en la fórmula general I-IA, R₁ = CH₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 11-1-11-15.

Tabla 12: en la fórmula general I-IA, R₁ = C₂H₅, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 12-1-12-15.

Tabla 13: en la fórmula general I-IA, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 13-1-13-15.

Tabla 14: en la fórmula general I-IA, R₁ = CF₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 14-1-14-15.

Tabla 15: en la fórmula general I-IA, R₁ = Cl, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 15-1-15-15.

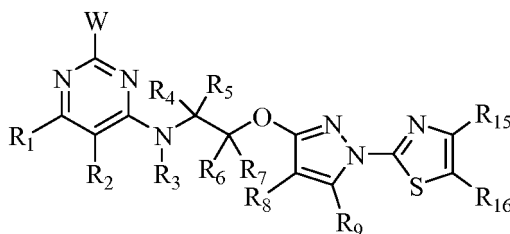
Tabla 16: en la fórmula general I-IA, R₁ = CH₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 16-1-16-15.

Tabla 17: en la fórmula general I-IA, R₁ = C₂H₅, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 17-1-17-15.

Tabla 18: en la fórmula general I-IA, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 18-1-18-15.

Tabla 19: en la fórmula general I-IA, R₁ = CF₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₄ son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a 10-1-10-15 en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como 19-1-19-15.

En la fórmula general I-IB,



I-1B

R₁ = Cl, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ se refieren a la tabla 20, los compuestos representativos se codifican como 20-1-20-10.

Tabla 20

N.º	R ₁₅	R ₁₆
20-1	H	H
20-2	H	Br
20-3	H	CH ₃
20-4	H	NO ₂
20-5	H	CN
20-6	H	CF ₃

(continuación)

N.º	R ₁₅	R ₁₆
20-7	Cl	H
20-8	CH ₃	H
20-9	CF ₃	H
20-10	CF ₃	CO ₂ CH ₃

Tabla 21: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = CH₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **21-1-21-10**.

Tabla 22: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = C₂H₅, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **22-1-22-10**.

Tabla 23: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **23-1-23-10**.

Tabla 24: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = CF₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **24-1-24-10**.

Tabla 25: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = Cl, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **25-1-25-10**.

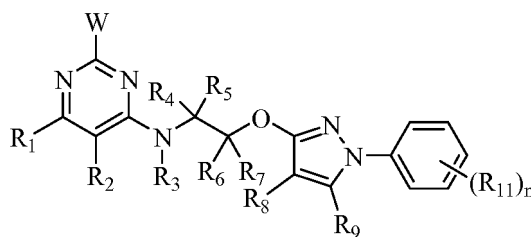
Tabla 26: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = CH₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **26-1-26-10**.

Tabla 27: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = C₂H₅, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **27-1-27-10**.

Tabla 28: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **28-1-28-10**.

Tabla 29: en la fórmula general **I-IB**, R₁ = CF₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes R₁₅ y R₁₆ son consistentes con los de la tabla 20 y correspondientes a **20-1-20-10** en la tabla 20 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **29-1-29-10**.

En la fórmula general **I-IC**,

**I-IC**

R₁ = Cl, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)_n se refieren a la tabla 30, los compuestos representativos se codifican como 30-1-30-279.

Tabla 30

N.º	(R ₁₁) _n	N.º	(R ₁₁) _n	N.º	(R ₁₁) _n
30-1	H	30-2	2-F	30-3	3-F
30-4	4-F	30-5	2,3-2F	30-6	2,4-2F
30-7	2,5-2F	30-8	2,6-2F	30-9	3,4-2F
30-10	3,5-2F	30-11	2,3,4-3F	30-12	2,3,5-3F
30-13	2,4,5-3F	30-14	2,3,6-3F	30-15	2,4,6-3F
30-16	3,4,5-3F	30-17	2-Cl	30-18	3-Cl
30-19	4-Cl	30-20	2,3-2Cl	30-21	2,4-2Cl
30-22	2,5-2Cl	30-23	2,6-2Cl	30-24	3,4-2Cl
30-25	3,5-2Cl	30-26	2,3,4-3Cl	30-27	2,3,5-3Cl
30-28	2,4,5-3Cl	30-29	2,3,6-3Cl	30-30	2,4,6-3Cl
30-31	3,4,5-3Cl	30-32	2-Br	30-33	3-Br
30-34	4-Br	30-35	2,3-Br	30-36	2,4-2Br

(continuación)

N.º	(R ₁₁)n	N.º	(R ₁₁)n	N.º	(R ₁₁)n
30-37	2,5-2Br	30-38	2,6-2Br	30-39	3,4-2Br
30-40	3,5-2Br	30-41	2,3,4-3Br	30-42	2,3,5-3Br
30-43	2,4,5-3Br	30-44	2,3,6-3Br	30-45	2,4,6-3Br
30-46	3,4,5-3Br	30-47	2-CN	30-48	3-CN
30-49	4-CN	30-50	2-NO ₂	30-51	3-NO ₂
30-52	4-NO ₂	30-53	2,4-2NO ₂	30-54	2,4,6-3NO ₂
30-55	2-CH ₃	30-56	3-CH ₃	30-57	4-CH ₃
30-58	2,3-2CH ₃	30-59	2,4-2CH ₃	30-60	2,5-2CH ₃
30-61	2,6-2CH ₃	30-62	3,4-2CH ₃	30-63	3,5-2CH ₃
30-64	2-C ₂ H ₅	30-65	3-C ₂ H ₅	30-66	4-C ₂ H ₅
30-67	2-CF ₃	30-68	3-CF ₃	30-69	4-CF ₃
30-70	2-OCH ₃	30-71	3-OCH ₃	30-72	4-OCH ₃
30-73	2-SCH ₃	30-74	3-SCH ₃	30-75	4-SCH ₃
30-76	2-OCF ₃	30-77	3-OCF ₃	30-78	4-OCF ₃
30-79	2-SCF ₃	30-80	3-SCF ₃	30-81	4-SCF ₃
30-82	2-OC ₂ H ₅	30-83	3-OC ₂ H ₅	30-84	4-OC ₂ H ₅
30-85	2-NHCH ₃	30-86	3-NHCH ₃	30-87	4-NHCH ₃
30-88	2-N(CH ₃) ₂	30-89	3-N(CH ₃) ₂	30-90	4-N(CH ₃) ₂
30-91	2-COCH ₃	30-92	3-COCH ₃	30-93	4-COCH ₃
30-94	2-COC ₂ H ₅	30-95	3-COC ₂ H ₅	30-96	4-COC ₂ H ₅
30-97	2-SO ₂ CH ₃	30-98	3-SO ₂ CH ₃	30-99	4-SO ₂ CH ₃
30-100	2-OCHF ₂	30-101	3-OCHF ₂	30-102	4-OCHF ₂
30-103	2-SO ₂ C ₂ H ₅	30-104	3-SO ₂ C ₂ H ₅	30-105	4-SO ₂ C ₂ H ₅
30-106	2-CO ₂ CH ₃	30-107	3-CO ₂ CH ₃	30-108	4-CO ₂ CH ₃
30-109	2-CO ₂ C ₂ H ₅	30-110	3-CO ₂ C ₂ H ₅	30-111	4-CO ₂ C ₂ H ₅
30-112	2-CH ₂ OCH ₃	30-113	3-CH ₂ OCH ₃	30-114	4-CH ₂ OCH ₃
30-115	2-OCOCH ₃	30-116	3-OCOCH ₃	30-117	4-OCOCH ₃
30-118	2-OCOCH ₂ CH ₃	30-119	3-OCOCH ₂ CH ₃	30-120	4-OCOCH ₂ CH ₃
30-121	2-OCO ₂ CH ₃	30-122	3-OCO ₂ CH ₃	30-123	4-OCO ₂ CH ₃
30-124	2-OCH ₂ OCH ₃	30-125	3-OCH ₂ OCH ₃	30-126	4-OCH ₂ OCH ₃
30-127	2-OCF ₂ OCF ₃	30-128	3-OCF ₂ OCF ₃	30-129	4-OCF ₂ OCF ₃
30-130	2-COPh	30-131	3-COPh	30-132	4-COPh
30-133	2-COCH ₂ Ph	30-134	3-COCH ₂ Ph	30-135	4-COCH ₂ Ph
30-136	2-NHPh	30-137	3-NHPh	30-138	4-NHPh
30-139	2-OPh	30-140	3-OPh	30-141	4-OPh
30-142	2-CONHPh	30-143	3-CONHPh	30-144	4-CONHPh
30-145	2-CO ₂ Ph	30-146	3-CO ₂ Ph	30-147	4-CO ₂ Ph
30-148	2-CONH ₂	30-149	3-CONH ₂	30-150	4-CONH ₂
30-151	2-Cl-4-F	30-152	2-Cl-4-Br	30-153	2-Cl-4-CH ₃
30-154	2-Cl-4-CF ₃	30-155	2-Cl-4-NO ₂	30-156	2-Cl-4-CN
30-157	2-Cl-4-OCF ₃	30-158	2-F-4-Cl	30-159	2-Br-4-Cl
30-160	2-CH ₃ -4-Cl	30-161	2-CF ₃ -4-Cl	30-162	2-NO ₂ -4-Cl
30-163	2-CN-4-Cl	30-164	2-OCF ₃ -4-Cl	30-165	2,6-2Cl-4-NO ₂
30-166	2,6-2Cl-4-CF ₃	30-167	2,6-2Cl-4-CN	30-168	2,6-2Cl-4-COCH ₃
30-169	2,6-2Cl-4-CONH ₂	30-170	2,4-2Cl-6-NO ₂	30-171	2,4-2Cl-6-CN
30-172	2,4-2Cl-6-CF ₃	30-173	2,4-2F-6-NO ₂	30-174	2,6-2F-4-NO ₂
30-175	2-NO ₂ -4-F	30-176	2-NO ₂ -4-Br	30-177	2-NO ₂ -4-CF ₃
30-178	2-NO ₂ -4-CN	30-179	2-NO ₂ -4-COCH ₃	30-180	2-NO ₂ -4-CONH ₂
30-181	2-NO ₂ -4-CH ₃	30-182	2-NO ₂ -4-OCH ₃	30-183	2-NO ₂ -4-SCH ₃
30-184	2-NO ₂ -4-NCH ₃	30-185	2-F-4-NO ₂	30-186	2-Br-4-NO ₂
30-187	2-CF ₃ -4-NO ₂	30-188	2-CN-4-NO ₂	30-189	2-COCH ₃ -4-NO ₂
30-190	2-CONH ₂ -4-NO ₂	30-191	2-CH ₃ -4-NO ₂	30-192	2-Cl-4-F-6-NO ₂
30-193	2-Cl-4-Br-6-NO ₂	30-194	2-Cl-4-CH ₃ -6-NO ₂	30-195	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂
30-196	2-Cl-4,6-2NO ₂	30-197	2-Cl-4-CN-6-NO ₂	30-198	2-Cl-4-OCF ₃ -6-NO ₂
30-199	2-F-4-Cl-6-NO ₂	30-200	2-Br-4-Cl-6-NO ₂	30-201	2-CH ₃ -4-Cl-6-NO ₂
30-202	2-CF ₃ -4-Cl-6-NO ₂	30-203	4-Cl-2,6-2NO ₂	30-204	2-CF ₃ -4-CN
30-205	2-CN-4-CF ₃	30-206	4-CF ₃ -2,6-2NO ₂	30-207	4-CN-2,6-2NO ₂
30-208	4-CH ₃ -2,6-2NO ₂	30-209	4-OCF ₃ -2,6-2NO ₂	30-210	4-OCH ₃ -2,6-2NO ₂
30-211	4-SCH ₃ -2,6-2NO ₂	30-212	4-NHCH ₃ -2,6-2NO ₂	30-213	4-F-2,6-2NO ₂
30-214	2-CF ₃ -4,6-2NO ₂	30-215	2-CN-4,6-2NO ₂	30-216	2-CH ₃ -4,6-2NO ₂

(continuación)

N.º	(R ₁₁)n	N.º	(R ₁₁)n	N.º	(R ₁₁)n
30-217	2-F-4,6-2NO ₂	30-218	2-OCF ₃ -4,6-2NO ₂	30-219	2-CF ₃ -4-Br
30-220	3-CF ₃ -4-NO ₂	30-221	2-CN-4-Cl-6-NO ₂	30-222	2-OCF ₃ -4-Cl-6-NO ₂
30-223	3-CF ₃ -4-CN	30-224	3-CN-4-CF ₃	30-225	2-CF ₃ -4-Br-6-NO ₂
30-226	3-NO ₂ -4-CF ₃	30-227	2-NO ₂ -4-CN-5-CF ₃	30-228	2-NO ₂ -4-CF ₃ -5-CN
30-229	4-OCF ₃ -2,6-2Br	30-230	2-CH ₃ -4-Cl-5-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	30-231	2,4-2Cl-3-CH ₃
30-232	2,4-2Cl-3-CH ₃ -6-NO ₂	30-233	2-Cl-3-CH ₃	30-234	2-CH ₃ -3-Cl
30-235	2-CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂	30-236	2-CH ₃ -3-Cl-4-NO ₂	30-237	2-CH ₃ -3-Cl-6-NO ₂
30-238	2-Cl-3-CH ₃ -4,6-2NO ₃	30-239	2-Cl-3-CH ₃ -4-NO ₂	30-240	2-Cl-3-CH ₃ -6-NO ₂
30-241	2-Br-4-NO ₂ -6-CN	30-242	3-Cl-4-CF ₃ -2,6-2NO ₂	30-243	2NO ₂ -4,5-2Cl
30-244	2-NO ₂ -3,5-2Cl	30-245	2,5-2Cl-4-NO ₂	30-246	2,5-2Cl-6-NO ₂
30-247	2,3-2Cl-4-NO ₂	30-248	2,3-2Cl-6-NO ₂	30-249	3,4-2Cl-2,6-2NO ₂
30-250	2,5-2Cl-4,6-2NO ₂	30-251	2,4,5-3Cl-6-NO ₂	30-252	2,3,4-3Cl-5-NO ₂
30-253	2,3,4-3Cl-6-NO ₂	30-254	2,3,5-3Cl-4,6-2CN	30-255	2,5-2Cl-4-OCF ₂ OCF ₃
30-256	2,6-2Br-4-NO ₂	30-257	2-F-4-NO ₂ -6-Cl	30-258	2-Cl-4-NO ₂ -6-SCN
30-259	2-Br-4-NO ₂ -6-Cl	30-260	2-Cl-4-NO ₂ -6-OCH ₃	30-261	2-Cl-4-NO ₂ -6-SCH ₃
30-262	2-Cl-4-NO ₂ -6-NHCH ₃	30-263	2-Cl-4-NO ₂ -6-SO ₂ CH ₃	30-264	2-Cl-4-SO ₂ CH ₃
30-265	2,6-2Cl-4-SO ₂ CH ₃	30-266	2,6-2Cl-4-CH ₃	30-267	2,6-2Cl-4-CO ₂ CH ₃
30-268	2,6-2Cl-4-CONHCH ₃	30-269	2,6-2Cl-4-CON(CH ₃) ₂	30-270	2,6-2Cl-4-CF(CF ₃) ₂
30-271	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Br	30-272	2-F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Br	30-273	2-F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Cl
30-274	2,6-2F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Cl	30-275	2,4,5-3Cl-3,6-2CN	30-276	2,3,5-3F-4,6-2CN
30-277	2-SO ₂ NH ₂	30-278	3-SO ₂ NH ₂	30-279	4-SO ₂ NH ₂

Tabla 30-1: en la fórmula general I-IC, R₁ = Cl, R₂ = CH₃, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **30-1-1-30-1-279**.

5 Tabla 30-2: en la fórmula general I-IC, R₁ = Cl, R₂ = OCH₃, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **30-2-1-30-2-279**.

10 Tabla 30-3: en la fórmula general I-IC, R₁ = Cl, R₂ = CHO, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **30-3-1-30-3-279**.

Tabla 30-4: en la fórmula general I-IC, R₁ = Cl, R₂ = Br, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **30-4-1-30-4-279**.

15 Tabla 31: en la fórmula general I-IC, R₁ = CH₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **31-1-31-279**.

Tabla 32: en la fórmula general I-IC, R₁ = C₂H₅, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **32-1-32-279**.

20 Tabla 33: en la fórmula general I-IC, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **33-1-33-279**.

25 Tabla 34: en la fórmula general I-IC, R₁ = CF₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **34-1-34-279**.

Tabla 35: en la fórmula general I-IC, R₁ = Cl, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **35-1-35-279**.

30 Tabla 36: en la fórmula general I-IC, R₁ = CH₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **36-1-36-279**.

Tabla 37: en la fórmula general I-IC, R₁ = C₂H₅, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **37-1-37-279**.

35 Tabla 38: en la fórmula general I-IC, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **38-1-38-279**.

Tabla 39: en la fórmula general I-IC, R₁ = CF₃, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **39-1-39-279**.

40 Tabla 40: en la fórmula general I-IF, R₃ = R₄ = R₅ = H, los sustituyentes (R₁₁)n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como

representativos se codifican como 62-1-62-279.

Tabla 63: en la fórmula general **I-2C**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **63-1-63-279**.

Tabla 64: en la fórmula general **I-2C**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = \text{H}$, $R_5 = \text{CH}_3$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **64-1-64-279**.

Tabla 65: en la fórmula general **I-2C**, $R_1 = CF_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **65-1-65-279**.

Tabla 66: en la fórmula general I-2F, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes (R_{11})n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **66-1-66-279**

Tabla 67: en la fórmula general **I-2F**, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **67-1-67-279**

Tabla 68: en la fórmula general **I-2G**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{28} = Cl$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **68-1-68-279**.

Tabla 69: en la fórmula general **I-2G**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{28} = CH_3$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **69-1-69-279**.

Tabla 70: en la fórmula general **I-2G**, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, $R_{28} = Cl$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **70-1-70-279**.

Tabla 71: en la fórmula general **I-2G**, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, $R_{28} = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **71-1-71-279**.

Tabla 72: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = Cl$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **72-1-72-15**.

Tabla 73: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **73-1-73-15**.

Tabla 74: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **74-1-74-15**.

Tabla 75: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **75-1-75-15**.

Tabla 76: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = CF_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **76-1-76-15**.

Tabla 77: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = Cl$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **77-1-77-15**.

Tabla 78: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **78-1-78-15**.

Tabla 79: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **79-1-79-15**.

Tabla 80: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = \text{H}$, $R_5 = \text{CH}_3$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **80-1-80-15**.

Tabla 81: en la fórmula general **I-3A**, $R_1 = CF_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes R_{14} son consistentes con los de la tabla 10 y correspondientes a **10-1-10-15** en la tabla 10 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **81-1-81-15**.

Tabla 82: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = Cl$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **82-1-82-279**.

Tabla 83: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **83-1-83-279**.

Tabla 84: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos

se codifican como 84-1-84-279.

Tabla 85: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **85-1-85-279**.

Tabla 86: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = CF_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **86-1-86-279**.

Tabla 87: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = Cl$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **87-1-87-279**.

Tabla 88: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **88-1-88-279**.

Tabla 89: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **89-1-89-279**

Tabla 90: en la fórmula general **1-3C**, R₁ = CHF₂, R₂ = Cl, R₃ = R₄ = H, R₅ = CH₃, los sustituyentes (R₁₁)_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **90-1-90-279**.

Tabla 91: en la fórmula general **I-3C**, $R_1 = CF_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **91-1-91-279**.

Tabla 92: en la fórmula general I-3F, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, los sustituyentes (R_{11})n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **92-1-92-279**

Tabla 93: en la fórmula general I-3F, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **93-1-93-279**

Tabla 94: en la fórmula general **I-3G**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{28} = Cl$, los sustituyentes (R_{11})n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **94-1-94-279**.

Tabla 95: en la fórmula general **I-3G**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{28} = CH_3$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **95-1-95-279**.

Tabla 96: en la fórmula general **I-3G**, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, $R_{28} = Cl$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **96-1-96-279**.

Tabla 97: en la fórmula general **I-3G**, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = CH_3$, $R_{28} = CH_3$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **97-1-97-279**.

Tabla 98: en la fórmula general **I-1C**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = F$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **98-1-98-279**.

Tabla 99: en la fórmula general **I-1C**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = H$, $R_5 = F$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **99-1-99-279**.

Tabla 100: en la fórmula general **I-1C**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = \text{H}$, $R_5 = \text{F}$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **100-1-100-279**.

Tabla 101: en la fórmula general **I-1C**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = F$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **101-1-101-279**.

Tabla 102: en la fórmula general **I-1C**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = F$, los sustituyentes (R_{11})_n son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **102-1-102-279**.

Tabla 103: en la fórmula general **I-1C**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{F}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **103-1-103-279**.

Tabla 104: en la fórmula general **I-1H**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{29} = CH_3$, $R_{30} = H$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **104-1-104-279**.

Tabla 105: en la fórmula general **I-11**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{31} = CH_3$, $R_{32} = H$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **105-1-105-279**.

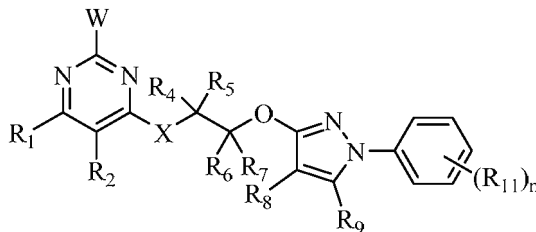
Tabla 106: en la fórmula general **I-1J**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{33} = H$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se

codifican como **106-1-106-279**.

Tabla 107: en la fórmula general **I-1K**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{34} = H$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **107-1-107-279**.

Tabla 108: en la fórmula general **I-1L**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{35} = H$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **108-1-108-279**.

Tabla 109: en la fórmula general **I-1M**, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $R_{36} = H$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **109-1-109-279**.



I-1N ($X=O$ o S)

Tabla 110: en la fórmula general **I-1N**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $X = O$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **110-1-110-279**.

Tabla 111: en la fórmula general **I-1N**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $X = O$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **111-1-111-279**.

Tabla 112: en la fórmula general **I-1N**, $R_1 = CHF_2$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $X = O$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **112-1-112-279**.

Tabla 113: en la fórmula general **I-1N**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $X = S$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **113-1-113-279**.

Tabla 114: en la fórmula general **I-1N**, $R_1 = C_2H_5$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $X = S$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **114-1-114-279**.

Tabla 115: en la fórmula general **I-1N**, $R_1 = CHF_2$, $R_2 = Cl$, $R_3 = R_4 = R_5 = H$, $X = S$, los sustituyentes $(R_{11})_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **115-1-115-279**.

En la fórmula general **I-1C**, $R_1 = CH_3$, $R_2 = Cl$, $R_4 = R_5 = H$, $(R_{11})_n = 4-CH_3$, los sustituyentes R_3 (excepto H) se refieren a la tabla 116, los compuestos representativos se codifican como **116-1-116-140**.

Tabla 116

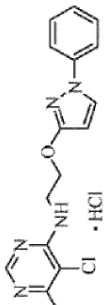
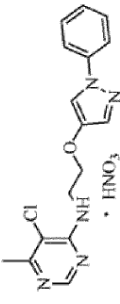
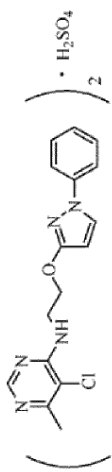
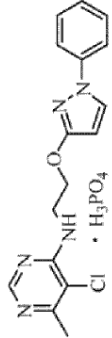
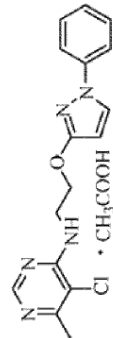
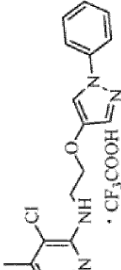
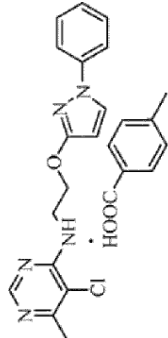
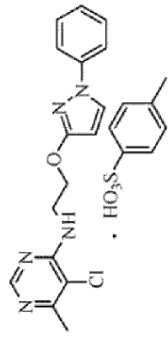
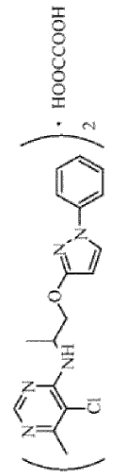
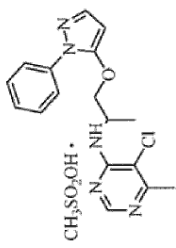
N.º	R ₃	N.º	R ₃	N.º	R ₃	N.º	R ₃
116-1	S- <i>i</i> -C ₃ H ₇	116-2	OH	116-3	-C(=O)H	116-4	CBF ₃
116-5	CH ₃	116-6	C ₂ H ₅	116-7	<i>n</i> -C ₃ H ₇	116-8	<i>i</i> -C ₃ H ₇
116-9	<i>n</i> -C ₄ H ₉	116-10	<i>i</i> -C ₄ H ₉	116-11	<i>t</i> -C ₄ H ₉	116-12	Cl ₃
116-13	CH ₂ Br	116-14	CHF ₂	116-15	CHBr ₂	116-16	CF ₃
116-17	CH ₂ Cl	116-18	CHCl ₂	116-19	CCl ₃	116-20	CH ₂ F
116-21	OCH ₃	116-22	OC ₂ H ₅	116-23	OCH(CH ₃) ₂	116-24	OC(CH ₃) ₃
116-25	OCF ₃	116-26	OCH ₂ CF ₃	116-27	OCH ₂ F	116-28	OCHF ₂
116-29	SCH ₃	116-30	SC ₂ H ₅	116-31	SCH ₂ CH=CH ₂	116-32	CH=CH ₂
116-33	CH ₂ CH=CH ₂	116-34	CH ₂ CH=CCl ₂	116-35	C≡CH	116-36	CH ₂ C≡CH
116-37	CH ₂ C≡C- <i>i</i>	116-38	CH ₂ OCH ₃	116-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	116-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
116-41	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	116-42	CH ₂ OCH ₂ Cl	116-43	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	116-44	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Cl
116-45	CH ₂ SCH ₃	116-46	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	116-47	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	116-48	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
116-49	CH ₂ SCH ₂ Cl	116-50	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ Cl	116-51	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ Cl	116-52	SOCH ₃
116-53	SOC ₂ H ₅	116-54	SOCF ₃	116-55	SOCH ₂ CF ₃	116-56	SO ₂ CH ₃
116-57	SO ₂ C ₂ H ₅	116-58	SO ₂ CF ₃	116-59	SO ₂ CH ₂ CF ₃	116-60	SO ₂ NHCOCH ₃
116-61	SO ₂ NHCH ₃	116-62	SO ₂ N(CH ₃) ₃	116-63	CONHSO ₂ CH ₃	116-64	COCH ₃
116-65	COC ₂ H ₅	116-66	CO- <i>n</i> -C ₃ H ₇	116-67	CO- <i>i</i> -C ₃ H ₇	116-68	CO- <i>n</i> -C ₄ H ₉
116-69	CO- <i>i</i> -C ₄ H ₉	116-70	CO- <i>t</i> -C ₄ H ₉	116-71	COCF ₃	116-72	COCH ₂ Cl
116-73	COOCH ₃	116-74	COOC ₂ H ₅	116-75	COO- <i>n</i> -C ₃ H ₇	116-76	COO- <i>t</i> -C ₄ H ₉
116-77	COOCF ₃	116-78	COOCH ₂ CH ₂ Cl	116-79	COOCH ₂ CF ₃	116-80	CH ₂ COOCH ₃
116-81	CH ₂ COOC ₂ H ₅	116-82	CH ₂ COCH ₃	116-83	CH ₂ COC ₂ H ₅	116-84	CONHCH ₃
116-85	CONHC ₂ H ₅	116-86	CONH- <i>t</i> -C ₄ H ₉	116-87	CON(CH ₃) ₂	116-88	CON(C ₂ H ₅) ₂
116-89	COOCH ₂ CH=CH ₂	116-90	COOCH ₂ C≡CH	116-91	COOCH ₂ OCH ₃	116-92	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₃
116-93	SNHCH ₃	116-94	SNHC ₂ H ₅	116-95	SN(CH ₃) ₂	116-96	SN(C ₂ H ₅) ₂
116-97		116-98		116-99		116-100	
116-101	CO-O- 	116-102	CO-O- 	116-103	CO-O- 	116-104	CO-O- 

(continuación)

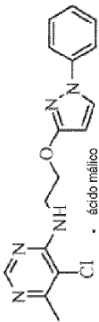
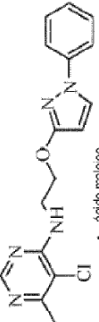
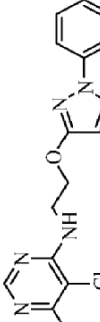
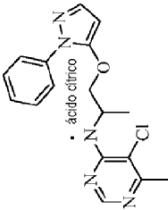
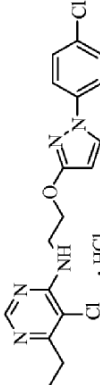
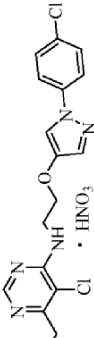
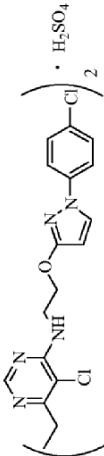
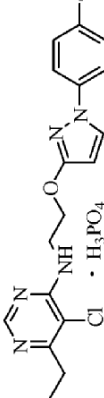
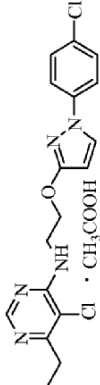
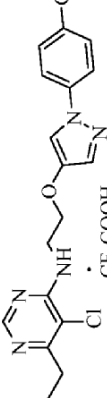
N.º	R ₃	N.º	R ₃	N.º	R ₃	N.º	R ₃
116-105		116-106		116-107		116-108	
116-109		116-110		116-111		116-112	
116-113		116-114		116-115		116-116	
116-117		116-118		116-119		116-120	
116-121		116-122		116-123		116-124	
116-125		116-126		116-127		116-128	
116-129		116-130		116-131		116-132	
116-133		116-134		116-135		116-136	
116-137		116-138		116-139		116-140	

Las sales de algunos compuestos que tienen una estructura como se representa por formula I de la presente divulgación se enumeran en la tabla 117, pero sin restringirse por ello.

Tabla 117 las sales de algunos compuestos

N.º	estructura	N.º	estructura
117-1		117-2	
117-3		117-4	
117-5		117-6	
117-7		117-8	
117-9		117-10	

(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-11	 • ácido málico	117-12	 • ácido málico
117-13	 • ácido fumáico	117-14	 • ácido clórico
117-15	 • HCl	117-16	 • HNO ₃
117-17	 • H ₂ SO ₄	117-18	 • H ₃ PO ₄
117-19	 • CH ₃ COOH	117-20	 • CF ₃ COOH

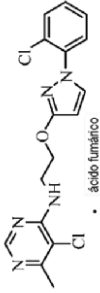
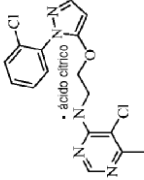
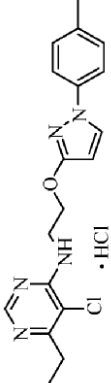
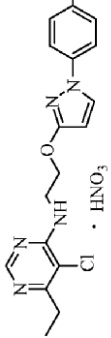
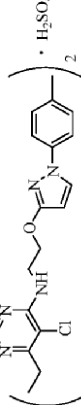
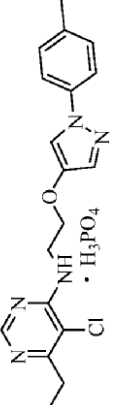
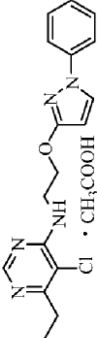
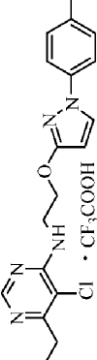
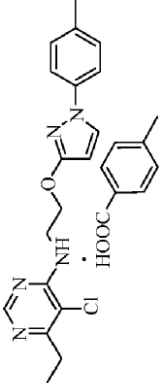
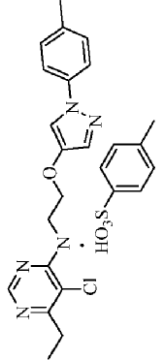
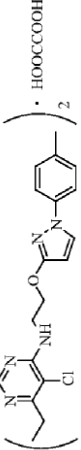
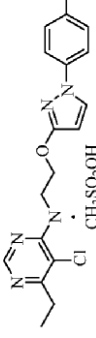
(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-21		117-22	
117-23		117-24	
117-25		117-26	
117-27		117-28	
117-29		117-30	

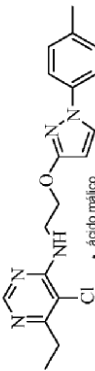
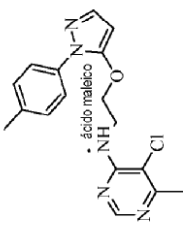
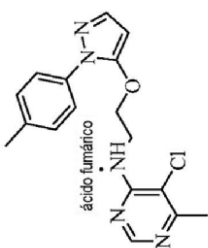
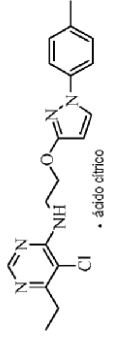
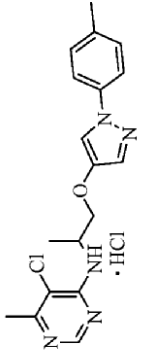
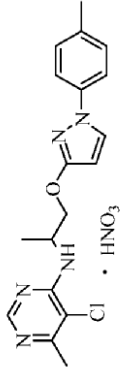
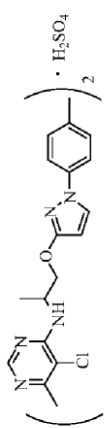
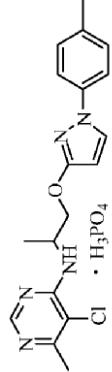
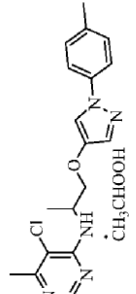
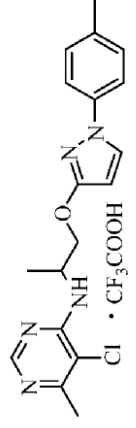
(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-31		117-32	
117-33		117-34	
117-35		117-36	
117-37		117-38	
117-39		117-40	

(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-41		117-42	
117-43		117-44	
117-45		117-46	
117-47		117-48	
117-49		117-50	
117-51		117-52	

(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-53		117-54	
117-55		117-56	
117-57		117-58	
117-59		117-60	
117-61		117-62	

(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-63		117-64	
117-65		117-66	
117-67		117-68	
117-69		117-70	
117-71		117-72	

(continuación)

N.º	estructura	N.º	estructura
117-73		117-74	
117-75		117-76	
117-77		117-78	
117-79		117-80	
117-81		117-82	

(continuación)

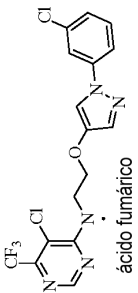
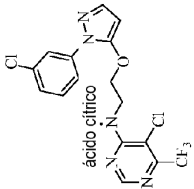
N.º	estructura	N.º	estructura
117-83	 ácido fumárico	117-84	 ácido cítrico

Tabla 118: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{Br}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **118-1-118-279**.

Tabla 119: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{NH}_2$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **119-1-119-279**.

Tabla 120: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{NO}_2$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **120-1-120-279**.

Tabla 121: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{CHO}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **121-1-121-279**.

Tabla 122: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{CH}_3$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **122-1-122-279**.

Tabla 123: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{Cl}$, $R_2 = \text{OCH}_3$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **123-1-123-279**.

Tabla 124: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{CH}_3$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **124-1-124-279**.

Tabla 125: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{C}_2\text{H}_5$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **125-1-125-279**.

Tabla 126: en la fórmula general **I-4C**, $R_1 = \text{CHF}_2$, $R_2 = \text{Cl}$, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **126-1-126-279**.

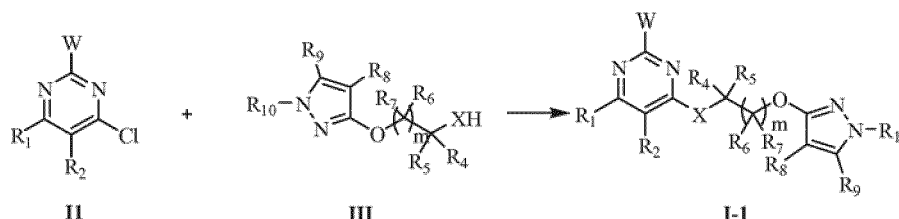
Tabla 127: en la fórmula general **I-4F**, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **127-1-127-279**.

Tabla 128: en la fórmula general **I-4G**, $R_3 = R_4 = R_5 = \text{H}$, $R_{28} = \text{Cl}$, los sustituyentes (R_{11}) $_n$ son consistentes con los de la tabla 30 y correspondientes a **30-1-30-279** en la tabla 30 a su vez, los compuestos representativos se codifican como **128-1-128-279**.

Los compuestos de la presente divulgación pueden prepararse de acuerdo con los siguientes métodos. La definición de cada sustituyente es como se ha definido anteriormente a menos que se indique otra cosa:

Los compuestos representados por la fórmula general I se pueden preparar mediante los siguientes dos métodos de acuerdo con la definición diferente de Y:

(1) Cuando Y es O, de acuerdo con la posición conjunta del átomo de oxígeno y en anillo de pirazol, los métodos para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-1**, **I-2** y **I-3** son como sigue: El método para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-1** es como sigue:



Los compuestos representados por la fórmula general **I-1** se pueden preparar por reacción de los productos intermedios **II** y **III** en presencia de una base y un disolvente apropiados.

La base apropiada mencionada puede seleccionarse entre hidróxido de potasio, hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, trietilamina, piridina, metóxido de sodio, etóxido de sodio, hidruro de sodio, *tert*-butóxido de potasio o *tert*-butóxido de sodio y así sucesivamente.

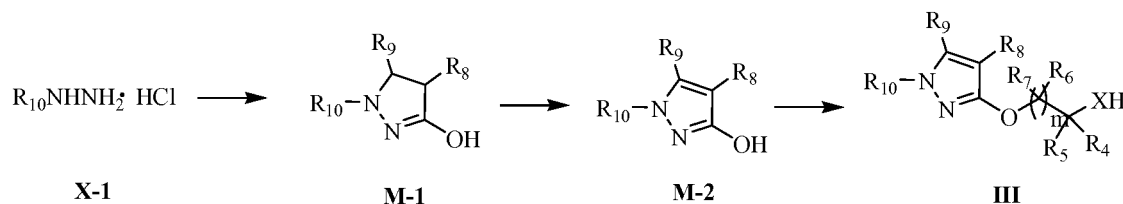
La reacción se realizó en un disolvente apropiado y el disolvente apropiado mencionado puede seleccionarse entre tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, acetonitrilo, tolueno, xileno, benceno, DMF, *N*-metil pirrolidona, DMSO, acetona o butanona y así sucesivamente.

La temperatura apropiada mencionada es desde temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente, la temperatura normal es de 20 a 100 °C.

El tiempo de reacción se encuentra normalmente en el intervalo de 30 minutos a 20 horas, siendo generalmente 1-10 horas.

Los productos intermedios **II** están disponibles en el mercado, o se preparan de acuerdo con los métodos descritos en los documentos JP2000007662, US4977264, US6090815, US20040092402, JP09124613, US5468751, US4985426, US4845097, Journal of the American Chemical Society (1957), 79, 1455 o Journal of Chemical Society (1955), p. 3478-3481.

El producto intermedio representado por la fórmula general **III** es el producto intermedio clave que se usa para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-1**. El método de preparación es como sigue:



Los productos intermedios representados por la fórmula general **M-1** se pueden preparar por reacción de los productos intermedios representados por la fórmula general **X-1** con acrilato de etilo (no) sustituido a la temperatura apropiada y en un disolvente apropiado. El tiempo de reacción se encuentra normalmente en el intervalo de 30 minutos a 20 horas, siendo generalmente 1-10 horas, los procedimientos de operación detallados se refieren a los métodos descritos en los documentos CN103588708, WO9703969 y Organic & Biomolecular Chemistry (2011), 9(5), 1443-1453; **M-2** se puede preparar a partir de los productos intermedios representados por la fórmula general **M-1** por una reacción de oxidación, la operación detallada se refiere a los métodos descritos en los documentos DE19652516, WO9703969 y Bulletin of the Korean Chemical Society (2010), 31(11), 3341-3347; los productos intermedios representados por la fórmula general **III** se pueden preparar por reacción de los productos intermedios representados por la fórmula general **M-2** y el haluro correspondiente, la operación detallada se refiere a los métodos descritos en los documentos US20100158860, WO2011133444 y Bioorganic & Medicinal Chemistry (2012), 20(20), 6109-6122.

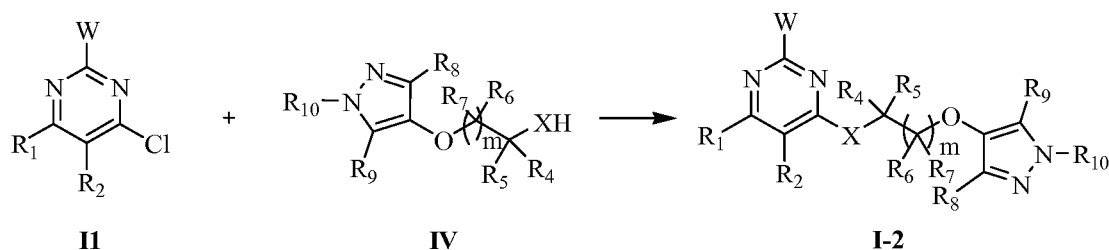
Las fuentes de los productos intermedios son como sigue: los productos intermedios representados por la fórmula general **X-1** están disponibles en el mercado, o pueden prepararse de acuerdo con el método convencional.

La temperatura de reacción apropiada es de 0 a 50 °C; el tiempo de reacción se encuentra normalmente en el intervalo de 30 minutos a 20 horas, siendo generalmente 0,5-10 horas.

El disolvente apropiado mencionado puede seleccionarse entre acetato de metilo, acetato de etilo, benceno, tolueno, xileno, cloroformo, diclorometano, agua, tetrahidrofurano, acetonitrilo, 1,4-dioxano, DMF, *N*-metil pirrolidona o DMSO y así sucesivamente.

El ácido apropiado mencionado puede seleccionarse entre ácido clorhídrico, ácido trifluoroacético, ácido sulfúrico, ácido acético, ácido propiónico, ácido butírico, ácido oxálico, ácido adípico, ácido 1,10-decanodicarboxílico, ácido láurico, ácido esteárico, ácido fumárico, ácido maleico, ácido benzoico o ácido alizárico.

El método para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-2** es como sigue:



Los compuestos representados por la fórmula general **I-2** se pueden preparar por reacción de los productos intermedios **II** y **IV** en presencia de una base y un disolvente apropiados.

La base apropiada mencionada puede seleccionarse entre hidróxido de potasio, hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, trietilamina, piridina, metóxido de sodio, etóxido de sodio, hidruro de sodio, *tert*-butoxido de potasio o *tert*-butoxido de sodio y así sucesivamente.

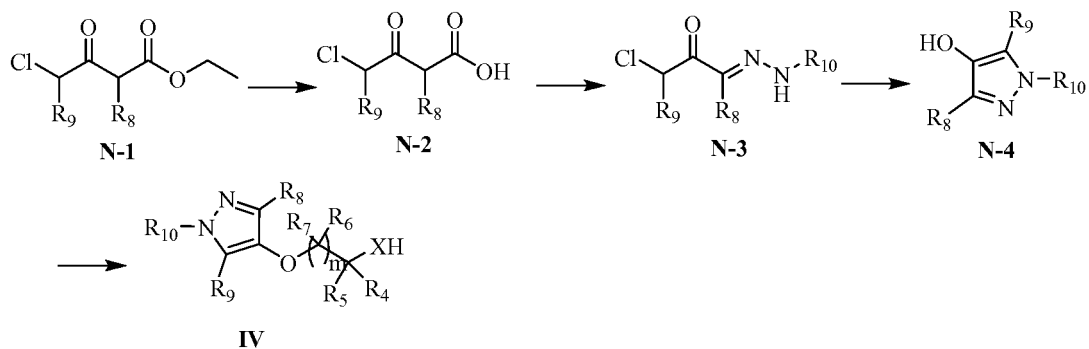
La reacción se realizó en un disolvente apropiado y el disolvente apropiado mencionado puede seleccionarse entre tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, acetonitrilo, tolueno, xileno, benceno, DMF, *N*-metil pirrolidona, DMSO, acetona o

butanona y así sucesivamente.

La temperatura apropiada mencionada es desde temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente, la temperatura normal es de 20 a 100 °C.

El tiempo de reacción se encuentra normalmente en el intervalo de 30 minutos a 20 horas, siendo generalmente 1-10 horas.

El producto intermedio representado por la fórmula general **IV** es el producto intermedio clave que se usa para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-2**. El método de preparación es como sigue:



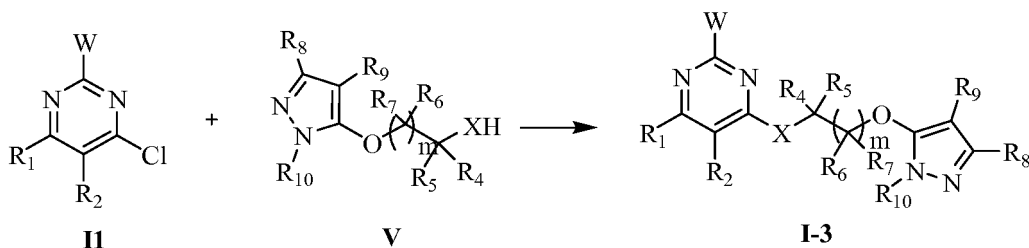
El producto intermedio **N-4** se puede preparar a partir del material de partida **N-1**, consúltense los métodos descritos en los documentos DE3012193, WO2010076553, Organic Preparations and Procedures International (2002), 34(1), 98-102 y Science of Synthesis (2002), 12, 15-225; Journal of Medicinal Chemistry (2016), 59(4), 1370-1387; el método de preparación de **N-4** a **IV** es igual que el de **M-2** a **III**.

El disolvente apropiado mencionado puede seleccionarse entre metanol, etanol, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, acetonitrilo, tolueno, xileno, benceno, DMF, DMSO, acetona o butanona.

El disolvente apropiado puede seleccionarse entre ácido clorhídrico, ácido sulfúrico o ácido nítrico.

La base apropiada mencionada puede seleccionarse entre hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butoxido de sodio o *tert*-butoxido de potasio y así sucesivamente.

El método para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-3** es como sigue:



Los compuestos representados por la fórmula general **I-3** se pueden preparar por reacción de los productos intermedios **II** y **V** en presencia de una base y un disolvente apropiados.

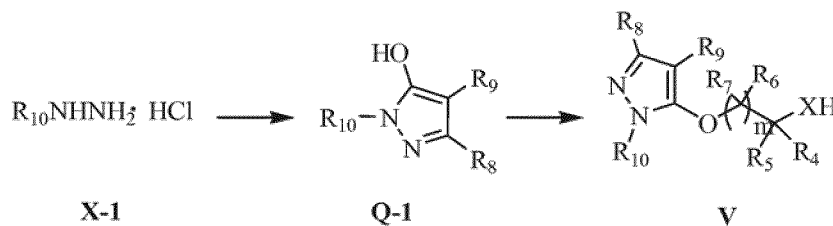
La base apropiada mencionada puede seleccionarse entre hidróxido de potasio, hidróxido de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de sodio, trietilamina, piridina, metóxido de sodio, etóxido de sodio, hidruro de sodio, *tert*-butoxido de potasio o *tert*-butoxido de sodio y así sucesivamente.

La reacción se realizó en un disolvente apropiado y el disolvente apropiado mencionado puede seleccionarse entre tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, acetonitrilo, tolueno, xileno, benceno, DMF, *N*-metil pirrolidona, DMSO, acetona o butanona y así sucesivamente.

La temperatura apropiada mencionada es desde temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente, la temperatura normal es de 20 a 100 °C.

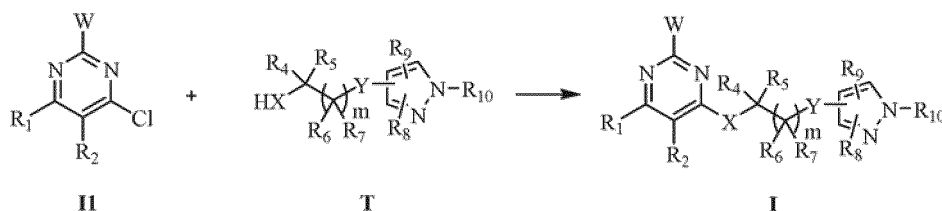
El tiempo de reacción se encuentra normalmente en el intervalo de 30 minutos a 20 horas, siendo generalmente 1-10 horas.

El producto intermedio representado por la fórmula general **V** es el producto intermedio clave que se usa para preparar los compuestos representados por la fórmula general **I-3**, el método de preparación es como sigue:



Los productos intermedios **Q-1** se pueden preparar a partir del material de partida **X-1**, consúltense los métodos descritos en los documentos WO2009069044, WO2000031042, WO2008059370, Bioorganic & Medicinal Chemistry (2006), 14(14), 5061-5071 y así sucesivamente; el método de preparación de **Q-1** a **V** es igual que el de **M-2** a **III**.

(2) La preparación de los compuestos representados por la fórmula general **I** es como sigue cuando **Y** es **NR3** o **S**. Los procedimientos de operación detallados del producto intermedio **T** se refieren a los métodos descritos en WO2003049739, WO2000031072 y así sucesivamente;



Aunque los compuestos representados por la fórmula general **I** y algunos compuestos notificados en la técnica anterior pertenecen ambos a compuestos de pirazol sustituidos con pirimidinilo, sigue habiendo algunas diferencias obvias en cuanto a la estructura entre los mismos. Es debido a estas diferencias que se llegó a compuestos de la presente divulgación con unas actividades fungicidas y/o insecticidas/acaricidas mejores.

Los compuestos representados por la fórmula general **I** muestran una actividad excelente tanto frente a muchos patógenos/enfermedades de plantas en el campo agrícola y otros campos como frente a insectos/ácaros. Por lo tanto, el esquema técnico de la presente divulgación también incluye los usos de los compuestos representados por la fórmula general **I** para preparar fungicidas, insecticidas/acaricidas en el campo agrícola u otros campos.

La presente divulgación se explica mediante los siguientes ejemplos de enfermedades de plantas, pero sin restringirse por ello.

Los compuestos representados por la fórmula general **I** pueden usarse para controlar estas enfermedades de plantas: enfermedades por Oomycete, tales como mildiú veloso (mildiú veloso del pepino, mildiú veloso de la colza, mildiú veloso de la soja, mildiú veloso de la remolacha, mildiú veloso de la caña de azúcar, mildiú veloso de tabaco, mildiú veloso del guisante, mildiú veloso de la esponja vegetal, mildiú veloso de la calabaza de cera china, mildiú veloso del melón almizclero, mildiú veloso de la col china, mildiú veloso de la espinaca, mildiú veloso del rábano, mildiú veloso de la uva, mildiú veloso de la cebolla), roya blanca (roya blanca de la colza, roya blanca de la col china), enfermedad de podredumbre (podredumbre de la colza, podredumbre del tabaco, podredumbre del tomate, podredumbre del pimiento, podredumbre de la berenjena, podredumbre del pepino, podredumbre del algodón), podredumbre por Pythium (enfermedad de la pimienta suave, fuga algodonosa de la esponja vegetal, fuga algodonosa de la calabaza de cera china), tizón (tizón por phytophthora del haba común, tizón por phytophthora del pepino, podredumbre por phytophthora de la calabaza, tizón por phytophthora de la calabaza de cera china, tizón por phytophthora de la sandía, tizón por phytophthora del melón almizclero, tizón por phytophthora del pimiento, tizón por phytophthora del cebollino chino, tizón por phytophthora del ajo, tizón por phytophthora del algodón), tizón tardío (tizón tardío de la patata, tizón tardío del tomate) y así sucesivamente; enfermedades causadas por Deuteromycotina, tal como marchitamiento (marchitamiento por fusarium de la batata, marchitamiento por fusarium del algodón, marchitamiento del sésamo, marchitamiento por fusarium del ricino, marchitamiento por fusarium del tomate, marchitamiento por fusarium de la judía, marchitamiento por fusarium del pepino, marchitamiento por fusarium de la esponja vegetal, marchitamiento por fusarium de la calabaza, marchitamiento por fusarium de la calabaza de cera china, marchitamiento por fusarium de la sandía, marchitamiento por fusarium del melón almizclero, marchitamiento por fusarium del pimiento, marchitamiento por fusarium del haba común, marchitamiento por fusarium de la colza, marchitamiento por fusarium de la soja), podredumbre de la raíz (podredumbre de la raíz del pimiento, podredumbre de la raíz de la berenjena, podredumbre de la raíz por fusarium de la judía, podredumbre de la raíz por fusarium del pepino, podredumbre de la raíz por fusarium de la balsamina, podredumbre de la raíz negra del algodón, podredumbre de la raíz por tielaviopsis del haba común), enfermedad de la caída (costra negra del algodón, costra negra del sésamo, podredumbre por rhizoctonia del pimiento, podredumbre por rhizoctonia del pepino, podredumbre por rhizoctonia de la col china), antracnosis (antracnosis del sorgo, antracnosis del algodón, antracnosis del kenaf, antracnosis del yute,

antracnosis de la linaza, antracnosis del tabaco, antracnosis de la mora, antracnosis del pimiento, antracnosis de la berenjena, antracnosis de la judía, antracnosis del pepino, antracnosis de la balsamina, antracnosis del zapallo de verano, antracnosis calabaza de cera china, antracnosis de la sandía, antracnosis del melón almizclero, antracnosis del lichi), marchitamiento por verticillium (marchitamiento por verticillium del algodón, marchitamiento por verticillium de girasol, marchitamiento por verticillium del tomate, marchitamiento por verticillium del pimiento, marchitamiento por verticillium de la berenjena), roña (roña del zapallo de verano, roña de la calabaza de cera china, roña del melón almizclero), moho gris (moho gris de la mata del algodón, moho gris de kenaf, moho gris del tomate, moho gris de la pimienta, moho gris de la judía, moho gris del apio, moho gris de la espinaca, moho gris-podredumbre del kiwi), mancha marrón (mancha marrón del algodón, mancha marrón del yute, mancha de la hoja por cercospora de remolacha, mancha marrón del cacahuete, mancha de la hoja marrón del pimiento, mancha de la hoja por corynespora de la calabaza de cera china, mancha marrón de la soja, mancha marrón del girasol, tizón por ascochyta del guisante, mancha marrón del haba común), mancha negra (mancha negra del lino, mancha de la hoja por alternaria de la colza, mancha negra del sésamo, mancha de la hoja por alternaria del girasol, mancha de la hoja por alternaria del ricino, mancha de cabeza de clavo del tomate, mancha de la fruta negra del pepino, mancha negra de la berenjena, mancha de la hoja de la judía, tizón por alternaria del pepino, mancha de la hoja negra por alternaria del apio, podredumbre negra por alternaria de la zanahoria, tizón de la hoja de la zanahoria, podredumbre por alternaria de la manzana, mancha marrón del cacahuete), mancha/tizón (mancha de la hoja por septoria del tomate, mancha de la hoja por septoria del pimiento, tizón tardío del apio), tizón temprano (tizón temprano del tomate, tizón temprano del pimiento, tizón temprano de la berenjena, tizón temprano de la patata, tizón temprano del apio), mancha anular (mancha por zonas de la soja, mancha anular del sésamo, mancha por zonas de la judía), tizón de la hoja (tizón de la hoja del sésamo, tizón de la hoja del girasol, tizón por alternaria de la sandía, mancha por alternaria del melón almizclero), podredumbre del tallo basal (podredumbre del tallo basal del tomate, podredumbre por rhizoctonia de la judía), y otras (mancha de la hoja del maíz del norte, podredumbre del kenaf, añublo del arroz, vaina negra del mijo, mancha de ojo de la caña de azúcar, podredumbre por aspergillus de la mata de algodón, podredumbre de corona del cacahuete, tizón del tallo de la soja, mancha negra de la soja, tizón de la hoja por alternaria del melón almizclero, mancha difusa del cacahuete, mancha de la hoja roja del té, tizón por phyllosticta del pimiento, mancha de la hoja por phyllosticta de la calabaza de cera china, podredumbre negra del apio, podredumbre del corazón de la espinaca, moho de la hoja del kenaf, mancha de la hoja marrón del kenaf, tizón del tallo del yute, mancha por cercospora de la soja, mancha de la hoja del sésamo, mancha de la hoja gris de ricino, mancha de la hoja marrón del té, mancha de la hoja por cercospora de la berenjena, mancha de la hoja por cercospora de la judía, mancha de la hoja por cercospora de la balsamina, mancha de la hoja por cercospora de la sandía, podredumbre seca del yute, podredumbre de la raíz y el tallo del girasol, podredumbre carbonosa de la judía, mancha de diana de la soja, mancha de la hoja por corynespora de la berenjena, mancha de la hoja de diana por corynespora del pepino, moho de la hoja del tomate, moho de la hoja por fulvia de la berenjena, mancha de chocolate del haba común) y así sucesivamente; enfermedades causadas por Basidiomycete, tal como roya (roya rayada del trigo, roya del tallo del trigo, roya de la hoja del trigo, roya del cacahuete, roya del girasol, roya de la caña de azúcar, roya del cebollino chino, roya de la cebolla, roya del mijo, roya de la soja), carbón (carbón de la cabeza del maíz, carbón del maíz, carbón de seda del sorgo, carbón del grano suelto del sorgo, carbón duro del sorgo, carbón del sorgo, carbón del grano del mijo, carbón de la caña de azúcar, roya de la judía), y otros (por ejemplo, tizón de la vaina del trigo y tizón de la vaina del arroz) y así sucesivamente; enfermedades causadas por Ascomycete, tales como mildiú pulverulento (mildiú pulverulento del trigo, mildiú pulverulento de la colza, mildiú pulverulento del sésamo, mildiú pulverulento del girasol, mildiú pulverulento de la remolacha, mildiú pulverulento de la berenjena, mildiú pulverulento del guisante, mildiú pulverulento de la esponja vegetal, mildiú pulverulento de la calabaza, mildiú pulverulento zapallo de verano, calabaza de cera china, mildiú pulverulento del melón almizclero, mildiú pulverulento de la uva, mildiú pulverulento del haba común), podredumbre por sclerotinia (esclerotiniosis del lino, esclerotiniosis de la colza, esclerotiniosis de la soja, esclerotiniosis del cacahuete, podredumbre por sclerotinia del tabaco, podredumbre por sclerotinia de la pimienta, podredumbre por sclerotinia de la berenjena, podredumbre por sclerotinia de la judía, podredumbre por sclerotinia del guisante, podredumbre por sclerotinia del pepino, podredumbre por sclerotinia de la balsamina, podredumbre por sclerotinia de la calabaza de cera china, esclerotiniosis de la sandía, podredumbre del tallo del apio), roña (roña de la manzana, roña de la pera) y así sucesivamente.

Los compuestos representados por la fórmula general I pueden usarse para controlar estos insectos: Coleoptera, tales como Acanthoscelides spp., Acanthoscelides obtectus, Agrilus planipennis, Agriotes spp., Anoplophora glabripennis, Anthonomus spp., Anthonomus grandis, Aphidius spp., Apion spp., Apogonia spp., Atacnius sprctulus, Atomaria linearis, escarabajo pigmeo de la remolacha forrajera, Aulacophore spp., Bothynoderes punctiventris, Bruchus spp., Bruchus pisorum, Cacoesia, Cacoesia spp., Callosobruchus maculatus, Carpophilus hemipteras, Cassida vittata, Cerosterna spp., Cerotoma, Cerotoma spp., Cerotoma trifurcata, Ceutorhynchus spp., Ceutorhynchus assimilis, gorgojo de la vaina de la semilla de la col, Ceutorhynchus napi, curculio de la col, Chaetocnema spp., Colaspis spp., Conoderus scalaris, Conoderus stigmus, Conotrachelus nenuphar, Cotinus nitidis, escarabajo verde de junio, Crioceris asparagi, Cryptolestes ferrugineus, escarabajo del grano plano, Cryptolestes pusillus, Cryptolestes turcicus, escarabajo turco del grano, Ctenicera spp., Curculio spp., Cyclocephala spp., Cyllindropterus adspersus, gorgojo del tallo del girasol, Deporaus marginatus, gorgojo cortador de hojas del mango, Dermestes lardarius, Dermestes maculatus, Diabrotica spp., Epilachna varivestis, raustinus cubae, Hylobius pales, gorgojo del pino, Hypera spp., Hypera postica, Hyperdoes spp., gorgojo Hyperodes, Hypothenemus hampei, Ips spp., descortezadores, Lasioderma serricorne, Leptinotarsa decemlineata, Liogenys fuscus, Liogenys suturalis, Lissorhoptrus oryzophilus, Lyctus spp., escarabajos pulverizadores, Maecolaspis jolivetii, Megascelus spp., Melanotus communis, Meligethes spp., Meligethes aeneus, escarabajo del polen, Melolontha melolontha, Oberea brevis, Oberea linearis, Oryctes rhinoceros, escarabajo

- rinoceronte, *Oryzaephilus mercator*, escarabajo mercante de los granos, *Oryzaephilus surinamensis*, carcoma dentada, *Otiorhynchus* spp., *Oulema melanopus*, escarabajo de las hojas de los cereales, *Oulema oryzae*, *Pantomorus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllophaga cuyabana*, *Phyllotreta* spp., *Phynchites* spp., *Popillia japonica*, *Prostephanus truncatus*, barrenador mayor de los granos, *Rhizopertha dominica*, barrenador menor de los granos, *Rhizotrogus* spp., roedor europeo, *Rhynchophorus* spp., *Scolytus* spp., *Shenophorus* spp. *Sitona lincatus*, gorgojo de la hoja del guisante, *Sitophilus* spp., *Sitophilus granarius*, gorgojo de los graneros, *Sitophilus oryzae*, gorgojo del arroz, *Stegobium paniceum*, escarabajo del pan, *Tribolium* spp., *Tribolium castaneum*, escarabajo rojo de la harina, *Tribolium confusum*, escarabajo confuso de la harina, *Trogoderma variabile*, escarabajo de los almacenes, *Zabrus tenebrioides*.
- 10 Dermaptera.
- Dictyoptera, tales como *Blattella germanica*, cucaracha alemana, *Blatta orientalis*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana*, cucaracha americana, *Periplaneta australasiae*, cucaracha australiana, *Periplaneta brunnea*, cucaracha marrón, *Periplaneta fuliginosa*, cucaracha café ahumada, *Pycnoselus suninamensis*, cucaracha del Surinam y *Supella longipalpa*, cucaracha de banda marrón.
- 15 Diptera, tales como *Aedes* spp., *Agromyza frontella*, minador de hojas de alfalfa, *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anastrepha suspensa*, mosca de la fruta del Caribe, *Anopheles* spp., *Batrocera* spp., *Batrocera cucurbitae*, *Batrocera dorsalis*, *Ceratitis* spp., *Ceratitis capitata*, *Chrysops* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Culex* spp., *Dasineura* spp., *Dasineura brassicae*, *Delia* spp., *Delia platura*, gusano de semilla de maíz, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Fannia canicularis*, mosca doméstica menor, *Fannia scalaris*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans*, *Hylemyia* spp., mosca de la cebolla, *Hypoderma lineatum*, rezno común, *Liriomyza* spp., *Liriomyza brassicae*, minador de las crucíferas, *Melophagus ovinus*, *Musca* spp., mosca muscida, *Musca autumnalis*, mosca de otoño, *Musca domestica*, mosca doméstica, *Oestrus ovis*, estro de la oveja, *Oscinella frit*, *Pegomyia betae*, minador de las hojas de la remolacha, *Phorbia* spp., *Psila rosae*, mosca de la zanahoria, *Rhagoletis cerasi*, mosca de la cereza, *Rhagoletis pomonella*, gusano de la manzana, *Sitodiplosis mosellana*, mosquito naranja del trigo, *Stomoxys calcitrans*, mosca del establo, *Tahanus* spp. y *Tipula* spp.
- 20 Hemiptera, tales como *Acrosternum hilare*, chinche hediondo verde, *Blissus leucopterus*, chinche de los pastos, *Calocoris norvegicus*, chinche de la patata, *Cimex hemipterus*, chinche tropical de las camas, *Cimex lectularius*, chinche de las camas, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Dysdercus suturellus*, chinche manchador del algodón, *Edessa meditabunda*, *Eurygaster maura*, chinche de los cereales, *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, chinche hediondo marrón, *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*, chinche marchitador del té, *Lagynotomus* spp., *Leptocoris oratorius*, *Leptocoris varicorni*, *Lygus* spp., chinche de las plantas, *Lygus hesperus*, chinche opaca de las plantas, *Maconellicoccus hirsutus*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula*, chinche hediondo verde meridional, *Phyllocoris* spp., *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildingi*, *Poecilocapsus lineatus*, chinche de cuatro líneas, *Psallus vaccinicola*, *Pseudocysta perseae*, *Scaptocoris castanea* y *Triatoma* spp., chinche chupadora de sangre, chinche besucona.
- 30 Homoptera, tales como *Acyrthosiphon pisum*, pulgón del guisante, *Adelges* spp., ádelgidos, *Aleurodes proletella*, *Aleurodicus disperses*, *Aleurothrixus flocosus*, mosca blanca de los cítricos, *Aluacaspis* spp., *Amrasca bigutella*, *Aphrophora* spp., chicharrita, *Aonidiella aurantii*, cochinilla roja de California, *Aphis* spp., *Aphis gossypii*, pulgón del algodón, *Aphis pomi*, pulgón de la manzana, *Aulacorthum solan*, pulgón de la dedalera, *Bemisia* spp., *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, mosca blanca del tabaco, *Brachycolus noxius*, pulgón ruso, *Brachycorynclia asparagi*, pulgón del espárrago, *Brevinnia rehi*, *Brevicoryne brassicae*, *Ceroplastes* spp., *Ceroplastes rubens*, cochinilla roja, *Chionaspis* spp., *Chrysomphalus* spp., *Coccus* spp., *Dysaphis plantaginea*, pulgón ceniciento del manzano, *Empoasca* spp., *Eriosoma lanigerum*, pulgón lanigero del manzano, *Icerya purchasi*, cochinilla acanalada, *Idioscopus nitidulus*, chicharrita del mango, *Laodelphax striatellus*, chicharrita parda menor, *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphum* spp., *Macrosiphum euphorbiae*, pulgón de la patata, *Macrosiphum granarium*, pulgón del grano inglés, *Macrosiphum rosae*, pulgón del rosal, *Macrosteles quadrilineatus*, chicharrita del aster, *Mahanarva frimbiolata*, *Metopolophium dirhodum*, pulgón del grano del rosal, *Midis longicornis*, *Myzus persicae*, pulgón verde del melocotonero, *Nephotettix* spp., *Nephotettix cinctipes*, chicharrita verde, *Nilaparvata lugens*, chicharrita parda, *Parlatoria pergandii*, cochinilla gris, *Parlatoria ziziphi*, cochinilla negra de los cítricos, *Peregrinus maidis*, delfácido del maíz, *Philaenus* spp., *Phylloxera vitifoliae*, filoxera de la vid, *Physokermes piceae*, cochinilla negra de la picea, *Planococcus* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudococcus brevipes*, chinche harinoso de la piña, *Quadraspidiotus perniciosus*, chinche de San José, *Rhaphalosiphum* spp., *Rhaphalosiphum maidis*, pulgón de la hoja del maíz, *Rhaphalosiphum padi*, pulgón de la avena, *Saissetia* spp., *Saissetia oleae*, *Schizaphis graminum*, chinche verde, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, chicharrita del arroz, *Therioaphis* spp., *Toumeyella* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, mosca blanca de los invernaderos, *Trialeurodes abutiloneus*, mosca blanca de alas listadas, *Unaspis* spp., *Unaspis yanonensis*, chinche verde y *Zulia entreriana*.
- 40 Hymenoptera, tales como *Acromyrmex* spp., *Athalia rosae*, *Atta* spp., hormigas cortadoras de hojas, *Camponotus* spp., hormiga carpintera, *Diprion* spp., mosca de sierra, *Formica* spp., *Iridomyrmex humilis*, hormiga argentina, *Monomorium* spp., *Monomorium minimum*, hormiga pequeña negra, *Monomorium pharaonis*, hormiga faraón, *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Polistes* spp., avispa cartonera, *Solenopsis* spp., *Tapinoma sessile*, hormiga doméstica olorosa, *Tetranomium* spp., hormiga del pavimento, *Vespula* spp., avispa amarilla y *Xylocopa* spp., abeja
- 65

carpintera.

Isoptera, tales como *Coptotermes* spp., *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchii*, *Coptotermes formosanus*, termita subterránea de Formosa, *Cornitermes* spp., termita nariguda, *Cryptotermes* spp., *Heterotermes* spp., termita subterránea del desierto, *Ileotertermes aureus*, *Kaloterms* spp., *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., termita que crece en hongos, *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp., termita recolectora, *Microtermes obesi*, *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp., *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes* spp. y *Zootermopsis* spp.

Lepidoptera, tales como *Achoea janata*, *Adoxophyes* spp., *Adoxophyes orana*, *Agrotis* spp., *Agrotis ipsilon*, *Alabama argillacea*, gusano de las hojas del algodón, *Amorbia cuneana*, *Amyelosis transitella*, gusano de la naranja navel, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella*, barrenador de las ramitas del melocotonero, *Anomis sabulijera*, lagarta del yute, *Anticarsia gemmatilis*, oruga del frijol terciopelo, *Archips argyrospila* (enrollador de las hojas de los frutales, *Archips rosana*, enrollador de las hojas del rosál, *Argyrotaenia* spp., tortricidos, *Argyrotaenia citrana*, tortricido de la naranja, *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodcs*, *Borbo cinnara*, plegador de las hojas del arroz, *Bucculatrix thurberiella*, perforador de las hojas del algodón, *Caloptilia* spp., *Capua reticulana*, *Carposina niponensis*, polilla del melocotón, *Chilo* spp., *Chlumetia transversa*, barrenador de los brotes del mango, *Choristoneura rosaceana*, enrollador de las hojas de bandas oblicuas, *Chrysodeixis* spp., *Cnaphalocerus medinalis*, enrollador de las hojas del césped, *Colias* spp., *Conpomorpha cramerella*, *Cossus cossus*, *Crambus* spp., palomillas, *Cydia funebrana*, polilla de la ciruela, *Cydia molesta*, polilla oriental de la fruta, *Cydia nigricana*, polilla del guisante, *Cydia pomonella*, polilla de la manzana, *Darna diducta*, *Diaphania* spp., barrenador de los tallos, *Diatraea* spp., barrenador de las ramas, *Diatraea saccharalis*, barrenador de la caña de azúcar, *Diatraea graniosella*, barrenador del maíz del sureste, *Earias* spp., *Earias insulata*, taladro del algodón, *Earias vitella*, gusano moteado, *Ecdytopopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus*, barrenador de los tallos de maíz menor, *Epiphysias postruttana*, polilla marrón claro del manzano, *Ephestia* spp., *Ephestia cautella*, polilla del almendro, *Ephestia elutella*, polilla del tabaco, *Ephestia kuehniella*, polilla mediterránea de la harina, *Epimeces* spp., *Epinotia aporema*, *Erionota thrax*, mosca del banano, *Eupoecilia ambiguella*, polilla de la uva, *Euxoa auxiliaris*, rosquilla cortadora, *Feltia* spp., *Gortyna* spp., *Grapholita molesta*, polilla oriental de la fruta, *Hedylepta indicata*, gusano pegahojas, *Helicoverpa* spp., *Helicoverpa armigera*, gusano de la mata del algodón, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., *Heliothis virescens*, gusano bellotero, *Hellula undalis*, gusano de los brotes de la col, *Indarbela* spp., *Keiferia lycopersicella*, gusano alfiler del tomate, *Leucinodes orbonalis*, barrenador de la berenjena, *Leucoptera malifoliella*, *Lithocolletis* spp., *Lobesia botrana*, polilla del fruto de la uva, *Loxagrotis* spp., *Loxagrotis albicosta*, noctuido de la judía occidental, *Lymantria dispar*, polilla gitana, *Lyoniataclerkella*, minador de las hojas del manzano, *Mahasena corbetti*, oruga del saquito de la palma, *Malacosoma* spp., orugas de tienda de campaña, *Mamestra brassicae*, gardama de la col, *Maruca testualis*, *Metisa plana*, *Mythimna unipuncta*, gardama africana, *Neoleucinodes elegantalis*, barrenador pequeño del tomate, *Nymphula depunetalis*, gusano del arroz, *Operophtera brumata*, polilla de invierno, *Ostrinia nubilalis*, barrenador europeo del maíz, *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana*, tortricido común, *Pandemis heparana*, tortricido pardo del manzano, *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella*, gusano rosado del algodón, *Peridroma* spp., *Peridroma saucia*, gusano cortador jaspeado, *Perileucoptera coffeella*, minador de la hoja del café, *Phthorimaea operculella*, polilla de la patata, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., *Pieris rapae*, blanquita de la col, *Plathypena scabra*, *Plodia interpunctella*, polilla india de la harina, *Plutella xylostella*, polilla de la col, *Polychrosis viteana*, polilla de la uva, *Prays endocarpis*, *Prays oleae*, polilla del olivo, *Pseudaletia* spp., *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, gusano falso medidor de la soja, *Rachiplusia* nu, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia* spp., *Sesamia inferens*, barrenador rosado de los tallos del arroz, *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella*, palomilla de los cereales, *Sparganothis pillariana*, *Spodoptera* spp., *Spodoptera exigua*, gardama de la remolacha, *Spodoptera fugiperda*, cogollero del maíz, *Spodoptera oridania*, gardama meridional, *Synanthedon* spp., *Thecla basilides*, *Thermisia gemmatilis*, *Tineola bisselliella*, polilla de la ropa, *Trichoplusia ni*, gusano medidor de la col, *Tuta absoluta*, *Yponomeuta* spp., *Zeuzeracoffeae*, barrenador rojo de las ramas y *Zeuzera pirina*, polilla leopardo.

Malófagos, piojos masticadores, tales como *Bovicola ovis*, piojo masticador ovino, *Menacanthus stramineus*, piojo corporal del pollo y *Menopon gallinae*, piojo común de la gallina, Orthoptera, tales como *Anabrus simplex*, grillo mormón, *Gryllotalpidae*, grillo topo, *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., *Microcentrum retinerve*, catidido de ala angular, *Pterophylla* spp., *histocerca gregaria*, *Scudderia furcata*, esperanza y *Valanga nigricornis*, piojo chupador, tal como *Haematopinus* spp., *Linognathus setosus*, piojo ovino, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus humanus* y *Phthirus pubis*, ladilla.

Siphonaptera, tales como *Ctenocephalides canis*, pulga del perro, *Ctenocephalides felis*, pulga del gato y *Pulex irritans*, pulga del ser humano.

Thysanoptera, tales como *Frankliniella fusca*, trips del tabaco, *Frankliniella occidentalis*, trips occidental de las flores, *Frankliniella shultzei*, *Frankliniella williamsi*, trips del maíz, *Ileiothrips haemorrhoidalis*, trips de invernadero, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Scirtothrips cirri*, trips de los cítricos, *Scirtothrips dorsalis*, trips amarillo del té, *Taeniothrips rhopalantennalis* y *Thrips* spp.

Thysanura, tisanuros, tales como *Lepisma saccharinum*, lepismas y *Thermobia domestica*.

Acarina, ácaro y garrapata, tal como *Acaropsis woodi*, ácaro traqueal de abejas de la miel, *Acarus* spp., *Acarus siro*, ácaro del grano, *Aceria mangiferae*, ácaro de las yemas del mango, *Aculops* spp., *Aculops lycopersici*, ácaro del bronceado del tomate, *Aculops pelekasi*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, ácaro de la roya del manzano, 5 *Amblyomma americanum*, garrapata de estrella solitaria, *Boophilus* spp., *Brevipalpus obovatus*, ácaro de la alheña, *Brevipalpus phoenicis*, falsa arañuela roja, *Demodex* spp., ácaros del mango, *Dermacentor*spp., *Dermacentor variabilis*, garrapata americana del perro, *Dermatophagoides pteronyssinus*, ácaro del polvo doméstico, *Eotetranychus*

spp., *Eotetranychus carpini*, arañuela amarilla, *Epitimerus* spp., *Eriophyes* spp., ^I ; odes spp., *Metatetranychus* spp., *Notoedres cati*, *Oligonychus* spp., *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus ilicus*, ácaro rojo meridional, *anonychus* spp., 10 *Panonychus citri*, ácaro rojo de los cítricos, *Panonychus ulmi*, ácaro rojo europeo, *Phyllocoptruta oleivora*, ácaro de la roya de los cítricos, *Polyphagotarsonemus latus*, ácaro blanco, *Rhipicephalus sanguineus*, ácaro pardo del perro, *Rhizoglyphus* spp., ácaro de los bulbos, *Sarcoptes scabiei*, arador de la sarna, *Tegolophus perseiflorae*, *Tetranychus* spp., *Tetranychus urticae*, arañuela bimoteada y *Varroa destructor*.

15 Nematoda, tales como *Aphelenchoides* spp., nematodo de las yemas y las hojas y la madera del pino, *Belonolaimus* spp., nematodos picadores, *Criconebella* spp., nematodos anillados, *Dirofilaria immitis*, gusano del corazón del perro, *Ditylenchus* spp., *Heterodera* spp., nematodo quístico, *Heterodera zeae*, nematodo del quiste del maíz, *Hirschmanniella* spp., nematodos de la raíz, *Hoplolaimus* spp., nematodos lanza, *Meloidogyne* spp., *Meloidogyne* incognita, *Onchocerca volvulus*, rodador, *PraLylenchus* spp., nematodo de las lesiones, *Radopholus* spp., nematodo 20 barrenador y *Rotylenchus reniformis*, nematodo reniforme.

Symphyla, tales como *Scutigerella immaculata*.

25 Gracias a sus características positivas, los compuestos mencionados anteriormente pueden usarse ventajosamente en la protección de cultivos agrícolas y jardinería, animales domésticos y de cría, así como entornos frecuentados por seres humanos de patógenos, insectos y ácaros de plagas.

30 Para obtener el efecto deseado, la dosis de los compuestos a aplicar puede variar con diversos factores, por ejemplo, el compuesto usado, el cultivo protegido, el tipo de organismo dañino, el grado de infestación, las condiciones climáticas, el método de aplicación y la formulación adoptada.

La dosis de compuestos en el intervalo de 10 g a 5 kg por hectárea puede proporcionar un control suficiente.

35 Otro objetivo de la presente divulgación también incluye composiciones fungicidas, insecticidas/acaricidas que contienen los compuestos que tienen la fórmula general I como principio activo, y el porcentaje en peso del principio activo en la composición es del 0,5-99 %. Las composiciones fungicidas, insecticidas/acaricidas también incluyen el vehículo que es aceptable en agricultura, silvicultura y salud pública.

40 Las composiciones de la presente divulgación pueden usarse en forma de diversas formulaciones. Habitualmente, los compuestos que tienen la fórmula general I como principio activo pueden disolverse en o dispersarse en vehículos o prepararse en una formulación de modo que pueden dispersarse fácilmente como un fungicida o insecticida. Por ejemplo: estas formulaciones químicas pueden prepararse en polvo humectable, suspensión acuosa fluida, miscible con aceite, emulsión acuosa, solución acuosa o concentrados emulsionables y así sucesivamente. Por lo tanto, en estas composiciones, se añade al menos un vehículo sólido o líquido y, cuando sea necesario, se pueden añadir 45 habitualmente un tensoactivo o tensoactivos adecuados.

Se proporcionan aún también por la presente invención los métodos de aplicación para controlar hongos fitopatógenos, insectos, ácaros de las plagas que es para aplicar las composiciones de la presente invención a los hongos fitopatógenos o sus locus de crecimiento. La dosificación eficaz adecuada de los compuestos de la presente invención 50 está normalmente dentro de un intervalo de 10 g/ha a 1000 g/ha, preferiblemente de 20 g/ha a 500 g/ha.

Para algunas aplicaciones, otros uno o más fungicidas, insecticidas/acaricidas, herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas o fertilizante pueden añadirse a las composiciones fungicidas, insecticidas/acaricidas de la presente invención para hacer méritos y efectos adicionales.

55 Cabe señalar que se permiten variaciones y cambios dentro de los alcances reivindicados en la presente invención.

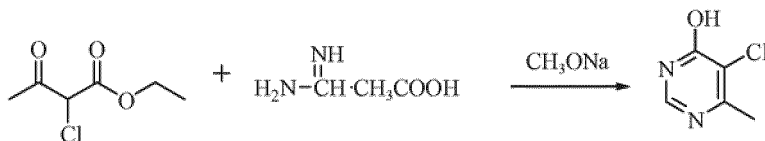
Descripción detallada de la invención

60 La presente invención se ilustra mediante los siguientes ejemplos, pero sin restringirse por ello (todos los materiales de partida están disponibles en el mercado a menos que se indique otra cosa).

Ejemplos de preparación

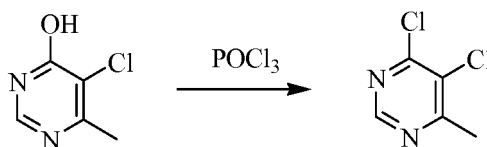
65 Ejemplo 1: La preparación del producto intermedio 4,5-dicloro-6-metilpirimidina (referencia)

1) La preparación de 4-hidroxil-5-cloro-6-metilpirimidina



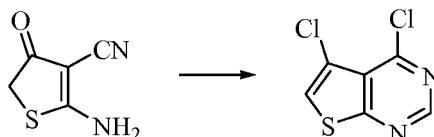
Una solución de 8,80 g (0,16 mol) de CH_3ONa en metanol se añadió lentamente a una solución de 11,30 g (0,11 mol) de acetato de formimidamida en 50 ml de metanol a temperatura ambiente con agitación, la mezcla se agitó durante otras 2 h después de la adición a temperatura ambiente. Seguido por la adición de 11,17 g (0,068 mol) de 2-cloro-3-oxobutanoato de etilo, la mezcla se siguió agitando durante otras 5-7 h a temperatura ambiente. Después de que la reacción hubiera terminado por supervisión de cromatografía en capa fina, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el pH se ajustó a 5-6 con HCl , y entonces se filtró para proporcionar un sólido de color amarillo-naranja, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 ml), se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y entonces se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en 50 ml de acetato de etilo, se dejó reposar durante una noche para obtener 6,48 g como un sólido de color naranja - amarillo con un rendimiento de 66 %. p.f. 181~184 °C.

2) La preparación del producto intermedio 4,5-dicloro-6-metilpirimidina



50 ml de POCl_3 se añadieron gota a gota a una solución de 14,5 g (0,1 mol) de 4-hidroxil-5-cloro-6-metilpirimidina en 50 ml de tolueno, la mezcla se calentó a reflujo durante 5-7h después de la adición. Después de que la reacción hubiera terminado por supervisión de cromatografía en capa fina, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida para retirar el tolueno y el POCl_3 adicional, y después se vertió en agua enfriada con hielo. La fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 50 ml), las fases orgánicas se combinaron, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y entonces se concentró a presión reducida. El residuo se purificó a través de columna de sílice (acetato de etilo/éter de petróleo = 1:5, como eluyente) para dar 14,43 g como un líquido de color amarillo con un rendimiento de 88,5 %.

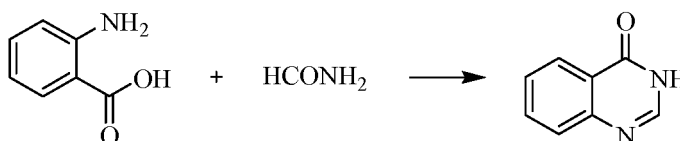
Ejemplo 2: La preparación del producto intermedio 4,5-diclorotieno[2,3-d]pirimidina



A una solución de 2-amino-4-oxo-4,5-dihidrotiofeno-3-carbonitrilo (70 g, 0,5 mol) disuelta en 250 ml de tricloruro de fosforilo en un baño de hielo se añadieron 38 ml de DMF durante aproximadamente 30 min, y se hizo reaccionar durante 1 h a la temperatura ambiente, entonces se calentó a 75 °C durante 3 h. Después de que la reacción hubiera terminado por supervisión de cromatografía en capa fina, la mezcla se enfrió a la temperatura ambiente y se vertió en agua enfriada con hielo, la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 x 80 ml), las fases orgánicas se combinaron, se filtraron para obtener 89,1 g de 4,5-diclorotieno[2,3-d]pirimidina como un sólido de color gris oscuro con un rendimiento de 86,9 %, el p.f. es 160-161 °C.

Ejemplo 3: La preparación del producto intermedio 4-cloroquinazolina

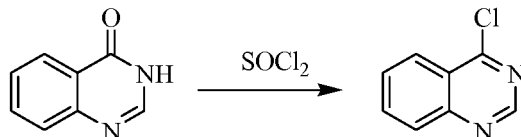
1) La preparación del producto intermedio quinazolin-4(3H)-ona



Ácido 2-aminobenzoico (13,7 g, 0,1 mol) y 20 ml de formamida se pusieron en un matraz de tres bocas de 250 ml, entonces se calentó a 140 °C y se hizo reaccionar durante 4-10 horas, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado. se añadieron 80 ml de agua en las condiciones de agitación cuando la solución se enfrió a 100 °C, entonces se enfrió a la temperatura ambiente, se filtró y se lavó el sólido con éter dietílico

anhidro para obtener 10,96 g de quinazolin-4(3H)-ona en forma de un sólido de color pardo con un rendimiento de 75,1 %.

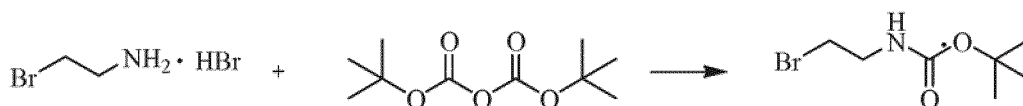
2) La preparación del producto intermedio 4-cloroquinazolina



Se disolvió quinazolin-4(3H)-ona (14,6 g, 0,1 mol) en 50 ml de dicloruro de sulfuro, y después se calentó a reflujo durante 4-6 h. Después de que la reacción hubiera terminado por supervisión de cromatografía en capa fina, la mezcla se vertió en agua enfriada con hielo y se agitó durante aproximadamente 30 min, se filtró y se lavó el sólido con éter dietílico anhidro para obtener 10,96 g de 4-cloroquinazolina en forma de un sólido de color pardo con un rendimiento de 92,7 %.

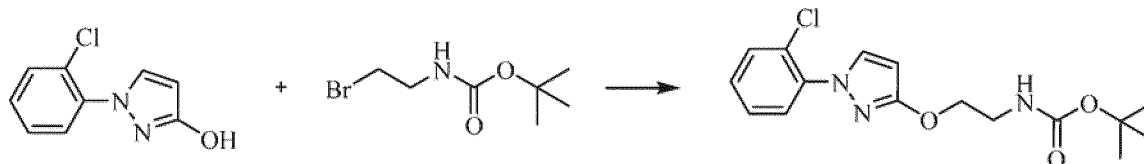
Ejemplo 4: La preparación del producto intermedio clorhidrato de 2-(1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etanamina

1) La preparación de *N*-Boc-2-bromoetilamina



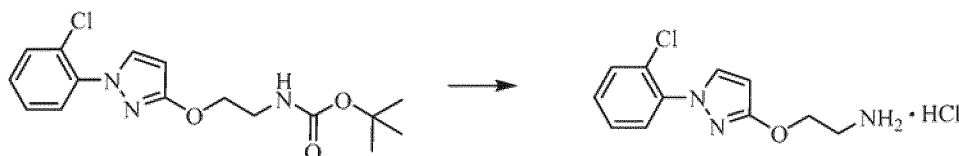
A una solución de 20,5 g (0,1 mol) de bromhidrato de 2-bromoetilamina y 10,08 g (0,12 mol) de bicarbonato de sodio en 80 ml de tetrahidrofurano y 50 ml de agua se añadieron gota a gota a gota 21,80 g (0,1 mol) de dicarbonato de di-*tert*-butilo a temperatura ambiente, entonces la mezcla de reacción se siguió agitando durante 4-10 h, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado, el disolvente excesivo se evaporó a presión reducida. Después, la mezcla se vertió en (3 x 50 ml) de acetato de etilo para separar la capa orgánica, la fase orgánica se lavó con 50 ml de salmuera, se secó y se evaporó a presión reducida para obtener 21,84 g del producto intermedio objetivo como un aceite incoloro con un rendimiento de 97,5 %.

2) La preparación de 2-(1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etilcarbamato de *tert*-butilo



A una solución de 2,24 g (0,01 mol) de 2-bromoetilcarbamato de *tert*-butilo y 1,94 g (0,01 mol) de 1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-3-ol (consultese el documento Organic Preparations and Procedures International, 34(1), 98-102; 2002) en 50 ml de butanona se añadieron 2,76 g (0,02 mol) de carbonato de potasio. La mezcla de reacción se siguió agitando y calentando a reflujo durante 4-10 horas, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado, el disolvente excesivo se evaporó a presión reducida. Después, la mezcla se vertió en (3 x 50 ml) de acetato de etilo para separar la capa orgánica, la fase orgánica se lavó con 50 ml de salmuera, se secó y se evaporó a presión reducida, el residuo se purificó a través de columna de sílice (acetato de etilo/éter de petróleo = 1:6, como eluyente) para obtener 2,73 g de 2-(1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etilcarbamato de *tert*-butilo en forma de un sólido de color amarillo con un rendimiento de 81,1 %.

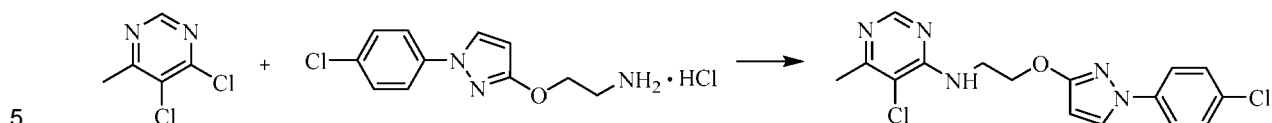
3) La preparación de clorhidrato de 2-(1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etanamina



A una solución de 3,37 g de 2-(1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etilcarbamato de *tert*-butilo (0,01 mol) en 50 ml de acetato de etilo se añadieron gota a gota a gota 6 ml de ácido clorhídrico concentrado. El sólido se disolvió, la mezcla de reacción se agitó durante 4-5 horas, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado, el disolvente excesivo se evaporó a presión reducida. Después, la mezcla se vertió en 10 ml de diclorometano para agitar durante media hora y se filtró para dar 2,16 g de producto intermedio objetivo en forma de

un sólido de color blanco.

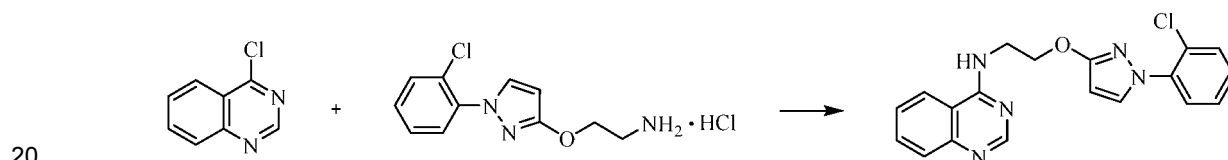
Ejemplo 5: La preparación del compuesto **31-19** (referencia)



A una solución de 1,62 g (0,01 mol) de 4,5-dicloro-6-metilpirimidina y 2,74 g (0,01 mol) de clorhidrato de 2-(1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etanamina en 50 ml de tolueno se añadieron 4,45 g (0,022 mol) de trietilamina. La mezcla de reacción se siguió agitando y calentando a reflujo durante 4-10 horas, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado, el disolvente excesivo se evaporó a presión reducida. Después, la mezcla se vertió en (3 x 50 ml) de acetato de etilo para separar la capa orgánica, la fase orgánica se lavó con 50 ml de salmuera, se secó y se evaporó a presión reducida, el residuo se purificó a través de columna de sílice (acetato de etilo/éter de petróleo = 1:4, como eluyente, intervalo de ebullición 60-90 °C) para obtener 2,90 g de compuesto **31-19** en forma de un sólido de color blanco con un rendimiento de 79,9 %.

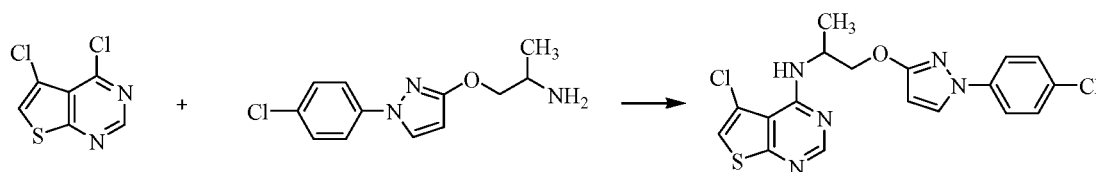
RMN ¹H (300 MHz, patrón interno: TMS, disolvente: CDCl₃) δ (ppm): 2,44 (3H, s), 3,90-3,98(2H, c), 4,48 (2H, t), 5,93 (1H, d), 5,94 (1H, t), 7,37 (2H, dd), 7,52 (2H, dd), 7,71 (1H, d), 8,39 (1H, s).

Ejemplo 6: La preparación del compuesto **40-17**



A una solución de 1,64 g (0,01 mol) de 4-cloroquinazolina y 2,74 g (0,01 mol) de clorhidrato de 2-(1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)etanamina en 50 ml de tolueno se añadieron 4,45 g (0,022 mol) de trietilamina. La mezcla de reacción se siguió agitando y calentando a reflujo durante 4-10 horas, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado, el disolvente excesivo se evaporó a presión reducida. Después, la mezcla se vertió en (3 x 50 ml) de acetato de etilo para separar la capa orgánica, la fase orgánica se lavó con 50 ml de salmuera, se secó y se evaporó a presión reducida, el residuo se purificó a través de columna de sílice (acetato de etilo/éter de petróleo = 1:4, como eluyente, intervalo de ebullición 60-90 °C) para obtener 2,61 g de compuesto **40-17** en forma de un sólido de color blanco con un rendimiento de 70,1 %. p.f. 186,6 °C. RMN ¹H (300 MHz, patrón interno: TMS, disolvente: CDCl₃) δ (ppm): 8,65 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,40-7,72 (m, 5H, Ph-3,4,5,6-5H), 7,40-7,72 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 5,97 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,90 (s, 1H, NH), 4,63 (t, 2H, O-CH₂), 4,06 (m, 2H, N-CH₂).

Ejemplo 7: La preparación del compuesto **44-19**



A una solución de 0,41 g (0,002 mol) de 4,5-diclorotieno[2,3-d]pirimidina y 0,51 g (0,002 mol) de 1-(1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-iloxi)propan-2-amina en 50 ml de tolueno se añadieron 0,45 g (0,011 mol) de trietilamina. La mezcla de reacción se siguió agitando y calentando a reflujo durante 4-10 horas, y se supervisó por TLC (cromatografía en capa fina) hasta que la reacción hubo terminado, el disolvente excesivo se evaporó a presión reducida. Después, la mezcla se vertió en (3 x 50 ml) de acetato de etilo para separar la capa orgánica, la fase orgánica se lavó con 50 ml de salmuera, se secó y se evaporó a presión reducida, el residuo se purificó a través de columna de sílice (acetato de etilo/éter de petróleo = 1:4, como eluyente, intervalo de ebullición 60-90 °C) para obtener 0,53 g de compuesto **44-19** en forma de un sólido de color blanco con un rendimiento de 63,7 %.

RMN ¹H (300 MHz, patrón interno: TMS, disolvente: CDCl₃) δ (ppm): 1,48 (3H, d), 4,40-4,46 (2H, m), 4,85 (1H, c), 5,95 (1H, d), 7,03 (1H, d), 7,26 (1H, s), 7,48 (2H, d), 7,51 (2H, d), 7,90 (1H, d), 8,47 (1H, s).

Otros compuestos de la presente invención y compuestos de referencia se prepararon de acuerdo con los ejemplos anteriores.

Propiedades físicas y espectro de RMN ¹H (RMN ¹H, 300 MHz, patrón interno: TMS, ppm) de algunos compuestos de esta divulgación son como sigue:

- Compuesto 30-1-4: p.f. 152,9 °C. δ (CDCl₃) 8,29 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,68 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,56 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,08-7,15 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 5,91 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,56 (s, 1H, NH), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,91-3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,05 (s, 3H, CH₃).
- 5 Compuesto 30-1-19: p.f. 156,1 °C. δ (CDCl₃) 8,30 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,52 (d, J = 9 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,39 (d, J = 9 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 5,93 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,50 (s, 1H, NH), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,94 (m, 2H, N-CH₂), 2,06 (s, 3H, CH₃).
- 10 Compuesto 30-1-21: p.f. 126,8 °C. δ (CDCl₃) 8,28 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,49-7,51 (m, 2H, Ph-3,6-H), 7,34 (d, 1H, Ph-5-H), 5,94 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,64 (s, 1H, NH), 4,47 (t, 2H, O-CH₂), 3,93 (m, 2H, N-CH₂), 2,04 (s, 3H, CH₃).
- 15 Compuesto 30-1-25: p.f. 172,7 °C. δ (CDCl₃) 8,31 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,50 (d, 2H, Ph-2,6-2H), 7,20 (s, 1H, Ph-4-H), 5,96 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,40 (s, 1H, NH), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,94-3,98 (m, 2H, N-CH₂), 2,11 (s, 3H, CH₃).
- 20 Compuesto 30-1-30: p.f. 175,9 °C. δ (CDCl₃) 8,27 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,47 (s, 2H, Ph-3,5-2H), 7,34 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 5,96 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,70 (s, 1H, NH), 4,45 (t, 2H, O-CH₂), 3,88-3,92 (m, 2H, N-CH₂), 2,06 (s, 3H, CH₃).
- 25 Compuesto 30-1-49: p.f. 170,8 °C. δ (CDCl₃) 8,31 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,82 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,73 (d, 4H, PhH), 6,00 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,34 (s, 1H, NH), 4,51 (t, 2H, O-CH₂), 3,93-3,99 (m, 2H, N-CH₂), 2,09 (s, 3H, CH₃).
- 30 Compuesto 30-1-57: p.f. 137,8 °C. δ (CDCl₃) 8,29 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,70 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,45 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,22 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 5,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,70 (s, 1H, NH), 4,51 (t, 2H, O-CH₂), 3,90-3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,37 (s, 3H, PhCH₃), 2,03 (s, 3H, CH₃).
- 35 Compuesto 30-1-78: aceite. δ (CDCl₃) 8,30 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,68 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,60 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,26-7,33 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 5,93 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,46 (s, 1H, NH), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,92-3,97 (m, 2H, N-CH₂), 2,07 (s, 3H, CH₃).
- 40 Compuesto 30-2-19: p.f. 111,9 °C. δ (CDCl₃) 8,17 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,53 (d, J = 6,9 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,38 (d, J = 7,9 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,07 (s, 1H, NH), 5,92 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,48 (t, 2H, O-CH₂), 3,92 (m, 2H, N-CH₂), 3,74 (s, 3H, CH₃).
- 45 Compuesto 30-3-19: aceite. δ (CDCl₃) 10,35 (s, 1H, CHO), 8,45 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,70 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51 (d, J = 9,3 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,37 (d, J = 9,3 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,00 (s, 1H, NH), 5,93 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,48 (t, 2H, O-CH₂), 4,05 (m, 2H, N-CH₂).
- 50 Compuesto 30-4-19: p.f. 143,7 °C. δ (CDCl₃) 8,30 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,52 (d, J = 8,7 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,38 (d, J = 8,7 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,29 (s, 1H, NH), 5,93 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,94 (m, 2H, N-CH₂).
- 55 Compuesto 31-4: p.f. 139,2 °C. δ (CDCl₃) 8,38 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,67 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,56 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,07-7,13 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 6,01 (s, 1H, NH), 5,91 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,48 (t, 2H, O-CH₂), 3,93-3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,43 (s, 3H, CH₃).
- 60 Compuesto 31-18: p.f. 146,7 °C. δ (CDCl₃) 8,39 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,63 (s, 1H, Ph-2-H), 7,43 (d, 1H, Ph-6-H), 7,33 (t, 1H, Ph-5-H), 7,19 (d, 1H, Ph-4-H), 5,96 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,44 (s, 3H, CH₃).
- 65 Compuesto 31-21: p.f. 155,6 °C. δ (CDCl₃) 8,37 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,53 (s, 1H, Ph-3-H), 7,50 (d, J = 1,8 Hz, 1H, Ph-6-H), 7,34 (d, J = 1,8 Hz, 1H, Ph-5-H), 6,09 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,46 (t, 2H, O-CH₂), 3,93 (m, 2H, N-CH₂), 2,44 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 31-23: aceite. δ (CDCl₃) 8,37 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,31-7,46 (m, 4H, Pirazol-5-H, PhH), 6,12 (s, 1H, NH), 5,96 (d, 1H, Pirazol-4-H), 4,45 (t, 2H, O-CH₂), 3,89-3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,45 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 31-25: p.f. 144,1 °C. δ (CDCl₃) 8,40 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,71 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,49-7,51 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,18 (s, 1H, Ph-4-H), 5,96 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,92 (s, 1H, NH), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,94-3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,45 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 31-30: aceite. δ (CDCl₃) 8,37 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,46 (s, 2H, Ph-3,5-2H), 7,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 6,06 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,89-3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,46 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 31-49: p.f. 187,0 °C. δ (CDCl₃) 8,39 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,80 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,69 (s, 4H, PhH), 6,00 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,91 (s, 1H, NH), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,92-3,98 (m, 2H, N-CH₂), 2,44 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 31-57: p.f. 127,3 °C. δ (CDCl₃) 8,38 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,69 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,46 (d, J = 8,7 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (d, J = 8,7 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,04 (s, 1H, NH), 5,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,48 (t, 2H, O-CH₂), 3,91-3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,43 (s, 3H, CH₃), 2,36 (s, 3H, PhCH₃).
- Compuesto 31-69: p.f. 171,0 °C. δ (CDCl₃) 8,39 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,62-7,70 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,98 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,95 (s, 1H, NH), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,43 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 31-78: p.f. 134,7 °C. δ (CDCl₃) 8,39 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,58-7,62 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,26-7,29 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 5,96 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,92-3,98 (m, 2H, N-CH₂), 2,44 (s, 3H, CH₃).
- Compuesto 32-1: p.f. 92,2 °C. δ (CDCl₃) 8,43 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,75 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,59 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,41 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 7,22 (m, 1H, Ph-4-H), 6,05 (s, 1H, NH), 5,92 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,76 (m, 2H, CH₂), 1,24 (t, 3H, CH₃).

- Compuesto 32-4: p.f. 123,9 °C. δ (CDCl₃) 8,43 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,67 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,56 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,07-7,13 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 6,01 (s, 1H, NH), 5,91 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,78 (t, 2H, O-CH₂), 3,91-3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,73-2,80 (m, 2H, CH₂), 1,24 (t, 3H, CH₃).
- 5 Compuesto 32-17: p.f. 75,4 °C. δ (CDCl₃) 8,42 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,57 (d, 1H, Ph-6-H), 7,48 (d, J = 1,5 Hz, 1H, Ph-3-H), 7,26-7,36 (m, 2H, Ph-4,5-2H), 6,09 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,47 (t, 2H, O-CH₂), 3,93 (m, 2H, N-CH₂), 2,77 (m, 2H, CH₂), 1,25 (t, 3H, CH₃).
- 10 Compuesto 32-18: p.f. 100,9 °C. δ (CDCl₃) 8,44 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,64 (s, 1H, Ph-2-H), 7,45 (d, 1H, Ph-6-H), 7,33 (t, 1H, Ph-5-H), 7,18 (d, 1H, Ph-4-H), 5,99 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,77 (m, 2H, CH₂), 1,27 (t, 3H, CH₃).
- Compuesto 32-19: p.f. 138,6 °C. δ (CDCl₃) 1,24 (3H, t), 2,71-2,82 (2H, c), 3,90-3,98 (2H, c), 4,49 (2H, t), 5,93 (1H, d), 6,01 (1H, t), 7,37 (2H, d), 7,53 (2H, d), 7,72 (1H, d), 8,44 (1H, s).
- Compuesto 32-21: p.f. 97,6 °C. δ (CDCl₃) 8,41 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51 (s, 1H, Ph-3-H), 7,49 (d, 1H, Ph-6-H), 7,28 (d, 1H, Ph-5-H), 6,09 (s, 1H, NH), 5,95 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,46 (t, 2H, O-CH₂), 3,94 (m, 2H, N-CH₂), 2,76 (m, 2H, CH₂), 1,25 (t, 3H, CH₃).
- 15 Compuesto 32-23: aceite. δ (CDCl₃) 8,41 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,27-7,46 (m, 4H, Pirazol-5-H, PhH), 6,12 (s, 1H, NH), 5,96 (d, 1H, Pirazol-4-H), 4,45 (t, 2H, O-CH₂), 3,90-3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,73-2,82 (m, 2H, CH₂), 1,22-1,28 (m, 3H, CH₃).
- Compuesto 32-25: p.f. 104,9 °C. δ (CDCl₃) 8,46 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,71 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,49 (s, 2H, Ph-2,6-2H), 7,17 (s, 1H, Ph-4-H), 5,98 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,93-3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,77-2,80 (m, 2H, CH₂), 1,25 (t, 3H, CH₃).
- 20 Compuesto 32-30: aceite. δ (CDCl₃) 8,42 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,46 (s, 2H, Ph-3,5-2H), 7,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 6,05 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,89-3,95 (m, 2H, N-CH₂), 2,74-2,82 (m, 2H, CH₂), 1,26 (t, 3H, CH₃).
- Compuesto 32-49: p.f. 145,1 °C. δ (CDCl₃) 8,44 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,80 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,69 (s, 4H, PhH), 6,00 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,91 (s, 1H, NH), 4,51 (t, 2H, O-CH₂), 3,93-3,98 (m, 2H, N-CH₂), 2,72-2,78 (m, 2H, CH₂), 1,21-1,28 (m, 3H, CH₃).
- 25 Compuesto 32-57: p.f. 112,5 °C. δ (CDCl₃) 8,43 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,69 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,46 (d, J = 8,7 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (d, J = 8,7 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,04 (s, 1H, NH), 5,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,48 (t, 2H, O-CH₂), 3,91-3,97 (m, 2H, N-CH₂), 2,72-2,80 (m, 2H, CH₂), 2,36 (s, 3H, CH₃), 1,24 (t, 3H, CH₃).
- 30 Compuesto 32-69: p.f. 119,9 °C. δ (CDCl₃) 8,44 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,64-7,68 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,98 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,95 (s, 1H, NH), 4,51 (t, 2H, O-CH₂), 3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,77 (m, 2H, CH₂), 1,24 (t, 3H, CH₃).
- Compuesto 32-78: p.f. 102,1 °C. δ (CDCl₃) 8,45 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,66 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,52-7,62 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,28-7,33 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 5,98 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,94-3,96 (m, 2H, N-CH₂), 2,75-2,78 (m, 2H, CH₂), 1,24 (t, 3H, CH₃).
- 35 Compuesto 33-1: p.f. 73,6 °C. δ (CDCl₃) 8,23 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,59 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,42 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 7,23 (m, 1H, Ph-4-H), 6,70 (t, 1H, CHF₂), 6,22 (s, 1H, NH), 5,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,36 (t, 2H, O-CH₂), 3,75 (m, 2H, N-CH₂).
- Compuesto 33-4: p.f. 115,2 °C. δ (CDCl₃) 8,56 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,67 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,56 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,07-7,14 (m, Ph-3,5-2H), 6,69 (t, J = 5,3, 4 Hz, 1H, CF₂H), 6,43 (s, 1H, NH), 5,91 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,52 (t, 2H, O-CH₂), 3,95-4,01 (m, 2H, N-CH₂).
- 40 Compuesto 33-18: p.f. 99,3 °C. δ (CDCl₃) 8,56 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,64 (s, 1H, Ph-2-H), 7,44 (d, 1H, Ph-6-H), 7,33 (t, 1H, Ph-5-H), 7,18 (d, 1H, Ph-4-H), 6,70 (t, 1H, CHF₂), 6,37 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,53 (t, 2H, O-CH₂), 3,99 (m, 2H, N-CH₂).
- 45 Compuesto 33-19: p.f. 142,8 °C. δ (CDCl₃) 4,00-4,05 (2H, c), 4,56 (2H, t), 5,96 (1H, s), 6,50 (1H, s), 6,75 (1H, t), 7,40 (2H, d), 7,51 (2H, d), 7,75 (1H, s), 8,60 (1H, s).
- Compuesto 33-21: p.f. 136,5 °C. δ (CDCl₃) 8,55 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51 (s, 1H, Ph-3-H), 7,49 (d, 1H, Ph-6-H), 7,35 (d, 1H, Ph-5-H), 6,70 (t, 1H, CHF₂), 6,39 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,49 (t, 2H, O-CH₂), 3,97 (m, 2H, N-CH₂).
- 50 Compuesto 33-25: p.f. 126,5 °C. δ (CDCl₃) 8,58 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,49-7,51 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (d, 1H, Ph-4-H), 6,72 (d, J = 53,40 Hz, 1H, CF₂H), 6,30 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,53 (t, 2H, O-CH₂), 3,97-4,03 (m, 2H, N-CH₂).
- Compuesto 33-30: p.f. 132,9 °C. δ (CDCl₃) 8,54 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,47 (s, 2H, Ph-3,5-2H), 7,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 6,73 (d, J = 53,7 Hz, 1H, CF₂H), 6,52 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,46 (t, 2H, O-CH₂), 3,94-3,99 (m, 2H, N-CH₂).
- 55 Compuesto 33-49: p.f. 151,7 °C. δ (CDCl₃) 8,57 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,82 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,70 (s, 4H, PhH), 6,70 (d, J = 53,70 Hz, 1H, CF₂H), 6,52 (s, 1H, NH), 6,01 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,54 (t, 2H, O-CH₂), 3,98-4,03 (m, 2H, N-CH₂).
- Compuesto 33-57: p.f. 106,6 °C. δ (CDCl₃) 8,56 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,46 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,21 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,69 (d, J = 54,00 Hz, 1H, CF₂H), 6,52 (s, 1H, NH), 5,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,53 (t, 2H, O-CH₂), 3,95-4,00 (m, 2H, N-CH₂), 2,37 (s, 3H, CH₃).
- 60 Compuesto 33-69: p.f. 122,3 °C. δ (CDCl₃) 8,57 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,01-7,64 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 6,70 (t, 1H, CHF₂), 6,31 (s, 1H, NH), 5,98 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,54 (t, 2H, O-CH₂), 4,00 (m, 2H, N-CH₂).
- 65 Compuesto 35-19: δ (CDCl₃) 1,42 (3H, d), 4,38 (2H, d), 4,65 (1H, s), 5,93 (1H, d), 6,06-6,08 (1H, m), 7,38 (2H, d), 7,51 (2H, d), 7,71 (1H, d), 8,28 (1H, s).

Compuesto 36-19: p.f. 80-82 °C. δ (CDCl₃) 1,42 (3H, d), 2,42 (3H, s), 4,37 (2H, d), 4,65-4,67 (1H, m), 5,91 (1H, s), 5,93 (1H, d), 7,36 (2H, d), 7,53 (2H, d), 7,70 (1H, d), 8,40 (1H, s).

Compuesto 37-19: δ (CDCl₃) 1,24 (3H, t), 1,42 (3H, d), 2,73-2,77 (2H, c), 4,37 (2H, d), 4,39 (1H, s), 5,78-5,82 (1H, m), 5,93 (1H, d), 7,38 (2H, d), 7,52 (2H, d), 7,70 (1H, d), 8,43 (1H, s).

Compuesto 40-1: aceite. δ (CDCl₃) 8,66 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,72-7,75 (m, 5H, Ph-2,3,4,5,6-5H), 7,72-7,75 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 6,22 (s, 1H, NH), 5,90 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,36 (t, 2H, O-CH₂), 3,75 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 40-4: p.f. 155,7 °C. δ (CDCl₃) 8,67 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,82 (d, 1H, Quinazolina-6-H), 7,67 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,53-7,65 (m, 4H, Ph-2,6-2H, Quinazolina-7,8-H), 7,10-7,19 (m, 3H, Ph-3,5-2H, Quinazolina-9-H), 6,95 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,7 Hz, 1H, =CH), 4,62 (t, 2H, CH₂), 4,05-4,10 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 40-18: p.f. 146,1 °C. δ (CDCl₃) 8,68 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,63-7,71 (m, 4H, Ph-2, 4,5,6-4H), 7,31-7,54 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 6,78 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,63 (t, 2H, O-CH₂), 4,10 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 40-19: p.f. 176,4 °C. δ (CDCl₃) 4,10-4,15 (2H, c), 4,67 (2H, t), 5,99 (1H, s), 7,11 (1H, s), 7,44 (2H, d), 7,58 (2H, d), 7,66 (1H, d), 7,71-7,76 (2H, d), 7,90 (1H, d), 8,70 (1H, s).

Compuesto 40-21: p.f. 141,7 °C. δ (CDCl₃) 8,66 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,72 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,80-7,83 (m, 3H, Ph-3,5,6-3H), 7,51-7,58 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 6,90 (s, 1H, NH), 5,97 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,59 (t, 2H, O-CH₂), 4,08 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 40-25: p.f. 199,9 °C. δ (CDCl₃) 8,69 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,83 (d, 1H, Quinazolina-6-H), 7,73 (d, J = 3,0 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,66 (m, 2H, Quinazolina-7,8-H), 7,51-7,52 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,30-7,36 (m, 1H, Quinazolina-7,8-H), 7,21-7,22 (m, 1H, Ph-4-H), 6,56 (s, 1H, NH), 5,99 (d, J = 3,0 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,62 (t, 2H, O-CH₂), 4,09-4,14 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 40-30: p.f. 170,5 °C. δ (CDCl₃) 8,66 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,52-7,84 (m, 3H, Quinazolina-6,7,9-3H), 7,46 (s, 2H, Ph-3,5-2H), 7,35 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,24 (t, 1H, Quinazolina-8-1H), 5,99 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,57 (t, 2H, O-CH₂), 4,04-4,09 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 40-49: aceite. δ (CDCl₃) 8,68 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,83 (d, 1H, Quinazolina-6-H), 7,81 (d, J = 3,0 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,64-7,76 (m, 5H, Quinazolina-7,8,9-H, Ph-2,6-2H), 7,31 (d, 2H, Ph-3,5-2H), 6,47 (s, 1H, NH), 6,02 (d, J = 3,0 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,62 (t, 2H, O-CH₂), 4,09-4,15 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 40-57: p.f. 178,7 °C. δ (CDCl₃) 8,66 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,78 (d, 1H, Quinazolina-6-H), 7,70 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,58-7,67 (m, 3H, Quinazolina-7,8,9-H), 7,50 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,10 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 5,92 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,64 (t, 2H, O-CH₂), 4,05-4,10 (m, 2H, N-CH₂), 2,40 (s, 3H, CH₃).

Compuesto 40-69: p.f. 170,1 °C. δ (CDCl₃) 8,68 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,81 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,62-7,71 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 7,62-7,71 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 6,62 (s, 1H, NH), 6,00 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,64 (t, 2H, O-CH₂), 4,11 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-1: p.f. 129,7 °C. δ (CDCl₃) 8,48 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,57 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,40 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 7,19 (m, 1H, Ph-4-H), 7,03 (s, 1H, Tieno-H), 6,98 (s, 1H, NH), 5,92 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,55 (t, 2H, O-CH₂), 4,08 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-4: p.f. 132,2 °C. δ (CDCl₃) 8,48 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,67 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,49-7,55 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,04-7,13 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 6,97 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,92 (s, 1H, NH), 5,92 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,53 (t, 2H, O-CH₂), 4,04-4,10 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-17: p.f. 122,4 °C. δ (CDCl₃) 8,47 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,54 (d, J = 7,5 Hz, 1H, Ph-6-H), 7,48 (d, J = 7,5 Hz, 1H, Ph-3-H), 7,31-7,36 (m, 2H, Ph-4,5-2H), 7,05 (s, 1H, Tieno-H), 7,01 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,1 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,53 (t, 2H, O-CH₂), 4,07 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-18: p.f. 100,1 °C. δ (CDCl₃) 8,48 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,72 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,61 (s, 1H, Ph-2-H), 7,43 (d, 1H, Ph-6-H), 7,31 (t, 1H, Ph-5-H), 7,17 (d, 1H, Ph-4-H), 7,04 (s, 1H, Tieno-H), 6,95 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,55 (t, 2H, O-CH₂), 4,08 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-21: p.f. 123,1 °C. δ (CDCl₃) 8,47 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,48-7,51 (m, 2H, Ph-3,6-2H), 7,32 (d, 1H, Ph-5-H), 7,05 (s, 1H, Tieno-H), 6,97 (s, 1H, NH), 5,94 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,51 (t, 2H, O-CH₂), 4,06 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-25: aceite. δ (CDCl₃) 8,49 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,43-7,49 (m, 2H, Ph 2,6-2H), 7,14-7,19 (m, 1H, Ph-4-H), 7,06 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,94 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,55 (t, 2H, O-CH₂), 4,05-4,11 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-30: aceite. δ (CDCl₃) 8,46 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,45 (s, 2H, Ph-3,5-2H), 7,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,06 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,98 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,47 (t, 2H, O-CH₂), 4,04-4,07 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-49: p.f. 164,9 °C. δ (CDCl₃) 8,49 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,80 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,63-7,67 (m, 4H, PhH), 7,04 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,90 (s, 1H, NH), 6,01 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,57 (t, 2H, O-CH₂), 4,07-4,10 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-57: p.f. 113,4 °C. δ (CDCl₃) 8,48 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,68 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,44 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (d, J = 8,4 Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 7,03 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,03 (s, 1H, NH), 5,89 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,54 (t, 2H, O-CH₂), 4,04-4,10 (m, 2H, N-CH₂), 2,36 (s, 3H, CH₃).

Compuesto 42-69: p.f. 149,7 °C. δ (CDCl₃) 8,48 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,79 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 7,03 (s, 1H, Tieno-H), 6,92 (s, 1H, NH), 5,98 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,57 (t, 2H, O-CH₂), 4,09 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 42-78: aceite. δ (CDCl₃) 8,49 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,96 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,71-7,74 (m,

2H, Ph-2,6-2H), 7,29-7,33 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 7,16 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,96 (s, 1H, NH), 5,94 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,55 (t, 2H, O-CH₂), 4,07-4,09 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 57-4: δ (CDCl₃) 2,47 (3H, s), 3,92 (2H, d), 4,14 (2H, t), 5,78 (1H, s), 7,13 (2H, t), 7,55 (1H, s), 7,56-7,59 (3H, m), 8,39 (1H, s).

Compuesto 57-19: p.f. 130,0 °C. δ (CDCl₃): 8,41 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,58 (s, 1H, Pirazol-5-H), 7,56 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,50 (s, 1H, Pirazol-3-H), 7,40 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 5,85 (s, 1H, NH), 4,14 (t, 2H, O-CH₂), 3,95-3,90 (m, 2H, N-CH₂), 2,46 (t, 3H, CH₃).

Compuesto 58-19: p.f. 134,7 °C. δ (CDCl₃): 8,45 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,60 (s, 1H, Pirazol-5-H), 7,56 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,50 (s, 1H, Pirazol-3-H), 7,40 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 5,82 (s, 1H, NH), 4,15 (t, 2H, O-CH₂), 3,95-3,90 (m, 2H, N-CH₂), 2,84-2,77 (m, 2H, CH₂), 1,27 (t, 3H, CH₃).

Compuesto 59-19: p.f. 125,7 °C. δ (CDCl₃): 8,58 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,58 (s, 1H, Pirazol-5-H), 7,56 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,50 (s, 1H, Pirazol-3-H), 7,40 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 6,74 (t, $J = 54$ Hz, 1H, CF₂H), 6,08 (s, 1H, NH), 4,16 (t, 2H, O-CH₂), 4,01-3,96 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 68-19: p.f. 119,2 °C. δ (CDCl₃): 8,49 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,60 (s, 1H, Pirazol-5-H), 7,55 (d, $J = 8,7$ Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,51 (s, 1H, Pirazol-3-H), 7,39 (d, $J = 8,7$ Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 7,01 (s, 1H, Tiofeno-H), 6,97 (s, 1H, NH), 4,22 (t, 2H, O-CH₂), 4,07-4,02 (m, 2H, N-CH₂).

Compuesto 59-21: aceite. δ (CDCl₃) 8,54 (s, 1H, Pirimidina-H), 8,01 (s, 1H, Ph-3-H), 7,57 (s, 1H, Pirazol-5-H), 7,49-7,52 (m, 2H, Ph-6-H, Pirazol-3-H), 7,35 (dd, 1H, Ph-5-H), 6,73 (d, $J = 53,7$ Hz, 1H, CF₂H), 6,25 (s, 1H, NH), 4,11 (t, 2H, O-CH₂), 3,75-3,81 (m, 2H, N-CH₂), 2,13-2,18 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 68-4: δ (CDCl₃) 4,03-4,04 (2H, c), 4,20 (2H, t), 7,10 (1H, s), 7,12-7,15 (2H, m), 7,25 (1H, d), 7,52-7,58 (4H, m), 8,48 (1H, s).

Compuesto 116-5: δ (CDCl₃) 8,43 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,68 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,49-7,54 (m, 2H, Ph 2,6-2H), 7,34-7,39 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 5,86 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,56 (t, 2H, O-CH₂), 4,03 (t, 2H, N-CH₂), 3,22 (s, 3H, NCH₃), 2,79-2,87 (m, 2H, CH₂), 1,26 (t, 3H, CH₃).

Compuesto 118-69: p.f. 83,5 °C. δ (CDCl₃) 8,28 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,72 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 6,15 (s, 1H, NH), 5,97 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,44 (t, 2H, O-CH₂), 3,75 (m, 2H, N-CH₂), 2,16 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 119-69: aceite. δ (CDCl₃) 8,07 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,72 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,98 (d, $J = 3$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,43 (s, 1H, NH), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,72 (m, 2H, N-CH₂), 3,44 (s, 2H, NH₂), 2,17 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 120-69: aceite. δ (CDCl₃) 8,10 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,80 (d, $J = 3$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,64-7,72 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 6,03 (d, $J = 3$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,99 (s, 1H, NH), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,84 (m, 2H, N-CH₂), 2,17 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 121-69: p.f. 96,0 °C. δ (CDCl₃) 10,38 (s, 1H, CHO), 9,47 (s, 1H, NH), 8,42 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,73 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 6,03 (d, 1H, Pirazol-4-H), 4,41 (t, 2H, O-CH₂), 3,84 (m, 2H, N-CH₂), 2,18 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 122-69: p.f. 94,1 °C. δ (CDCl₃) 8,28 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,82 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,72 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,95 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,35 (s, 1H, NH), 4,44 (t, 2H, O-CH₂), 3,74 (m, 2H, N-CH₂), 2,18 (m, 2H, CH₂), 2,14 (s, 3H, CH₃).

Compuesto 123-69: aceite. δ (CDCl₃) 8,15 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,68-7,73 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,96 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,89 (s, 1H, NH), 4,41 (t, 2H, O-CH₂), 3,85 (s, 3H, CH₃), 3,71 (m, 2H, N-CH₂), 2,16 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 124-19: p.f. 140,1 °C. δ (CDCl₃) 8,36 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,70 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,53 (d, $J = 9,0$ Hz, 2H, Ph-2,6-2H), 7,37 (d, $J = 9,3$ Hz, 2H, Ph-3,5-2H), 5,91 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,87 (s, 1H, NH), 4,41 (t, 2H, O-CH₂), 3,70-3,75 (m, 2H, N-CH₂), 2,45 (s, 3H), 2,12-2,17 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 125-19: δ (CDCl₃) 8,42 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,70 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,55 (m, 2H, Ph 2,6-2H), 7,35-7,39 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 5,91 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,88 (s, 1H, NH), 4,41 (t, 2H, O-CH₂), 3,69-3,75 (m, 2H, N-CH₂), 2,75-2,80 (m, 2H, CH₃-CH₂), 2,12-2,18 (m, 2H, CH₂), 1,26 (t, 3H, CH₃).

Compuesto 125-69: p.f. 94,3 °C. δ (CDCl₃) 8,42 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,73 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,97 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 5,89 (s, 1H, NH), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,73 (m, 2H, N-CH₂), 2,78 (m, 2H, CH₂ CH₃), 2,17 (m, 2H, CH₂), 1,26 (t, 3H, CH₃).

Compuesto 126-19: p.f. 132,9 °C. δ (CDCl₃) 8,54 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,70 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,51-7,55 (m, 2H, Ph-2,6-2H), 7,35-7,40 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 6,71 (t, 1H, CHF₂), 6,23 (s, 1H, NH), 5,91 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,73-3,79 (m, 2H, N-CH₂), 2,13-2,19 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 126-69: aceite. δ (CDCl₃) 8,54 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,82 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,73 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 6,74 (t, 1H, CHF₂), 6,29 (s, 1H, NH), 5,97 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,45 (t, 2H, O-CH₂), 3,79 (m, 2H, N-CH₂), 2,18 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 127-19: p.f. 165,7 °C. δ (CDCl₃) 8,66 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,81 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,70-7,78 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 7,52 (dd, 2H, Ph-2H), 7,37 (dd, 2H, Ph-2H), 6,07 (s, 1H, NH), 5,92 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,31 (t, 2H, O-CH₂), 3,43-3,53 (m, 2H, N-CH₂), 2,02-2,08 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 127-69: p.f. 149,7 °C. δ (CDCl₃) 8,67 (s, 1H, Quinazolina-3-H), 7,82 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,65-7,81 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 7,65-7,81 (m, 4H, Quinazolina-5,6,7,8-4H), 6,50 (s, 1H, NH), 5,98 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,50 (t, 2H, O-CH₂), 3,89 (m, 2H, N-CH₂), 2,26 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 128-19: δ (CDCl₃) 8,46 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,70 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,50-7,54 (m, 2H, Ph 2,6-2H), 7,34-7,40 (m, 2H, Ph-3,5-2H), 7,05 (s, 1H, Tiazol-H), 6,92 (s, 1H, NH), 5,91 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,43 (t, 2H, O-CH₂), 3,82-3,90 (m, 2H, N-CH₂), 2,17-2,27 (m, 2H, CH₂).

Compuesto 128-69: p.f. 123,5 °C. δ (CDCl₃) 8,46 (s, 1H, Pirimidina-H), 7,81 (d, J = 2,4 Hz, 1H, Pirazol-5-H), 7,64-7,71 (m, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 7,06 (s, 1H, Tieno-H), 6,92 (s, 1H, NH), 5,96 (d, J = 2,7 Hz, 1H, Pirazol-4-H), 4,46 (t, 2H, O-CH₂), 3,86 (m, 2H, N-CH₂), 2,23 (m, 2H, CH₂).

5 Prueba de actividad biológica

Los compuestos de la presente invención mostraron buena actividad frente a muchos patógenos, insectos y ácaros de las plagas en el campo agrícola.

10 Ejemplo 8: Pruebas fungicidas

Las muestras de compuesto de la presente divulgación se sometieron a prueba para determinar su actividad fungicida *in vitro* o actividad protectora *in vivo*. Los resultados de las pruebas fungicidas son como sigue.

15 (1) Determinación de actividad fungicida *in vitro*

El método es como sigue: En la prueba se usa alto rendimiento. El compuesto se disuelve en un disolvente apropiado para volverse una solución de prueba cuya concentración está designada. El disolvente se selecciona entre acetona, metanol, DMF y así sucesivamente de acuerdo con su capacidad disolvente para la muestra. En una condición sin

20 animáculo, la solución de prueba y suspensión de patógenos se añaden en las células de placa de cultivo celular de 96, que entonces se colocaría en la caja de temperatura constante. Después de 24 horas, la germinación o el crecimiento de patógenos puede investigarse mediante observación ocular, y la actividad *in vitro* del compuesto se evalúa basándose en la germinación o el crecimiento del tratamiento de control.

25 Las actividades *in vitro* (tasa de inhibición) de algunos compuestos son como sigue:

La tasa de inhibición frente a añublo del arroz:

A la dosis de 25 ppm, la tasa de inhibición de los compuestos 30-1-4, 31-4, 31-78, 32-1, 32-4, 32-21, 32-57, 32-78, 33-4, 33-18, 35-19, 36-19, 37-19, 40-4, 40-18, 40-57, 40-69, 42-1, 42-4, 42-18, 42-21, 42-57, 42-69, 42-78, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 y así sucesivamente fue de más de un 80 % frente a añublo del arroz. La tasa de inhibición de contraste

30 de los compuestos CK1, CK2, CK3, CK4 y CK5 fue 0; a la dosis de 8,3 ppm, la tasa de inhibición de los compuestos 31-4, 36-19, 40-4, 40-18, 40-57, 42-1, 42-18, 42-21, 42-57, 42-69, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4, 128-69 y así sucesivamente fue de más de un 80 % frente a añublo del arroz; a la dosis de 2,8 ppm, la tasa de inhibición de los compuestos 36-19, 42-1, 42-18, 42-21, 42-69, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 y así sucesivamente fue de más de un 80 % frente a añublo del arroz.

La tasa de inhibición frente a moho gris del pepino:

A la dosis de 25 ppm, la tasa de inhibición de los compuestos 36-19, 40-19, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 y así sucesivamente fue de más de un 80 % frente a moho gris del pepino. La tasa de inhibición de contraste de los compuestos CK1, CK2, CK3, CK4 y CK5 fue 0.

40 (2) La determinación de actividad protectora *in vivo*

El método es como sigue: En esta prueba se usa toda la planta. El compuesto se disuelve en un disolvente apropiado para obtener una solución madre. El disolvente apropiado se selecciona entre acetona, metanol, DMF y así

45 sucesivamente de acuerdo con su capacidad disolvente para la muestra. La tasa en volumen de disolvente y solución de prueba (v/v) es igual a o menor que un 5 %. La solución madre se diluye con agua que contiene 0,1 % de tween 80 para obtener la solución de prueba cuya concentración está designada. La solución de prueba se pulveriza en la planta hospedadora mediante un pulverizador de plantas especial. La planta se inocula con hongo después de 24 horas. De acuerdo con la característica infecciosa del hongo, la planta se almacena en una cámara de humedad y

50 entonces se transfiere a un invernadero después de que haya finalizado la infección. Y las otras plantas se colocan en el invernadero directamente. La actividad del compuesto se obtiene mediante observación visual después de 7 días en común.

Las actividades protectoras *in vivo* de algunos compuestos son como sigue:

La actividad protectora frente a mildiú vellosa del pepino *in vivo*:

A la dosis de 400 ppm, los compuestos 30-1-4, 30-1-49, 30-1-57, 31-4, 31-19, 31-18, 31-21, 31-49, 31-57, 31-69, 32-4, 32-18, 32-19, 32-21, 32-49, 33-18, 33-19, 33-21, 35-19, 36-19, 40-4, 40-18, 40-19, 40-21, 40-57, 42-1, 42-18, 42-21, 42-49, 42-57, 42-69, 42-78, 44-19, 57-4, 57-19, 58-19, 59-19, 66-19, 68-19, 68-4 y así sucesivamente mostraron

60 más de un 80 % de control frente a mildiú vellosa del pepino; a la dosis de 100 ppm, los compuestos 30-1-19, 30-1-21, 30-1-30, 30-2-19, 31-4, 31-18, 31-19, 31-21, 31-23, 31-30, 31-69, 32-4, 32-17, 32-18, 32-19, 32-21, 32-30, 33-18, 33-19, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19, 40-1, 40-4, 40-17, 40-18, 40-19, 40-21, 40-30, 42-1, 42-17, 42-18, 42-21, 42-69, 44-19, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú vellosa del pepino; a la dosis de 25 ppm, los compuestos 30-1-19, 30-1-21, 30-1-30, 30-2-19, 31-18, 31-19, 31-21, 31-23, 31-30, 31-69, 32-4, 32-19, 32-30, 33-18, 33-19, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19,

65 40-4, 40-17, 40-18, 40-19, 40-21, 40-30, 42-1, 42-17, 42-18, 42-21, 42-69, 44-19 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú vellosa del pepino; a la dosis de 12,5 ppm, los compuestos 30-2-19, 31-23, 32-

19, 32-30, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19, 40-4, 40-18, 40-19, 42-21 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú veloso del pepino; a la dosis de 6,25 ppm, los compuestos 30-2-19, 31-23, 32-19, 32-30, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 36-19, 40-4, 40-18, 40-19, 42-21 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú veloso del pepino.

5

La actividad protectora frente a mildiú pulverulento del trigo *in vivo*:

A la dosis de 400 ppm, los compuestos 30-1-57, 30-1-21, 30-2-19, 31-18, 31-21, 31-30, 31-49, 31-57, 31-69, 31-78, 32-1, 32-17, 32-18, 32-19, 32-21, 32-30, 32-49, 32-69, 32-78, 33-4, 33-19, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 33-69, 35-19, 36-19, 37-19, 40-19, 40-21, 40-69, 42-4, 42-17, 42-18, 42-21, 42-49, 42-57, 42-69, 42-78, 44-19, 57-19, 58-19, 59-19, 66-19, 68-19, 59-21, 118-69, 119-69, 122-69, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú pulverulento del trigo; a la dosis de 100 ppm, los compuestos 30-1-21, 30-2-19, 31-30, 31-69, 32-17, 32-19, 32-21, 32-30, 32-49, 32-69, 33-4, 33-19, 33-30, 33-49, 33-57, 33-69, 36-19, 37-19, 42-17, 42-57, 42-69, 44-19, 59-21, 118-69, 119-69, 122-69, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú pulverulento del trigo; a la dosis de 25 ppm, los compuestos 30-2-19, 31-30, 31-69, 32-21, 32-30, 32-69, 33-4, 33-19, 33-30, 33-49, 33-57, 33-69, 36-19, 37-19, 42-69, 44-19, 118-69, 119-69, 122-69, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú pulverulento del trigo; a la dosis de 6,25 ppm, los compuestos 30-2-19, 31-69, 32-69, 33-4, 33-19, 33-49, 33-57, 33-69, 36-19, 37-19, 42-69, 44-19, 118-69, 123-69, 126-69, 128-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a mildiú pulverulento del trigo.

20

La actividad protectora frente a roya del maíz *in vivo*:

A la dosis de 400 ppm, los compuestos 31-49, 31-57, 31-69, 32-4, 32-18, 32-19, 32-49, 32-57, 32-69, 32-78, 33-4, 33-19, 33-69, 36-19, 37-19, 40-18, 40-21, 42-18, 42-21, 42-4, 42-69, 42-78, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a roya del maíz; a la dosis de 100 ppm, los compuestos 31-69, 31-57, 32-49, 32-57, 32-69, 33-4, 33-69, 37-19, 42-18, 42-69, 44-19, 57-4 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a roya del maíz; a la dosis de 25 ppm, los compuestos 32-49, 32-57, 32-69, 37-19, 42-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a roya del maíz; a la dosis de 6,25 ppm, los compuestos 32-49, 37-19, 42-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a roya del maíz.

25

La actividad protectora frente a antracnosis del pepino *in vivo*:

A la dosis de 400 ppm, los compuestos 31-4, 31-19, 31-49, 31-57, 32-4, 32-18, 32-19, 32-49, 33-4, 33-19, 40-4, 40-19, 40-57, 42-1, 42-49, 42-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a antracnosis del pepino; a la dosis de 100 ppm, los compuestos 31-19, 31-49, 31-57, 32-4, 32-18, 32-19, 32-49, 33-4, 33-19, 40-4, 40-19, 40-57, 42-1, 42-49, 118-69, 122-69, 123-69, 126-69, 127-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a antracnosis del pepino; a la dosis de 25 ppm, los compuestos 31-19, 31-49, 31-57, 32-4, 32-49, 33-4, 32-19, 40-19, 40-57, 42-1, 42-49, 42-69, 122-69, 123-69, 126-69, 127-69 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a antracnosis del pepino; a la dosis de 6,25 ppm, los compuestos 31-57, 32-19, 32-49, 40-57 y 42-1 mostraron un 90 % de control frente a antracnosis del pepino.

35

40 (3) Los resultados de prueba de contraste de algunos compuestos y contrastes

Se realizaron pruebas de contraste entre algunos compuestos y contrastes. Los resultados de prueba se enumeran de tabla 129 a la tabla 132 ("///" en las siguientes tablas significa sin prueba).

Tabla 129 La prueba comparativa de actividad protectora frente a mildiú vellosa del pepino a 25 ml/

N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	actividad protectora (%)
30-1-19	95	32-17	70	35-19	100	42-18	100
30-1-21	100	32-18	60	36-19	100	42-21	100
30-1-30	98	32-19	100	40-1	70	42-69	80
30-2-19	98	32-21	70	40-4	100	44-19	100
31-18	95	32-30	100	40-17	70	126-69	70
31-19	100	33-18	85	40-18	100	127-69	70
31-21	90	33-19	95	40-19	96	CK1	20
31-23	100	33-21	100	40-21	100	CK2	20
31-30	100	33-30	100	40-30	100	CK3	0
31-69	100	33-49	100	42-1	100	CK4	0
32-4	95	33-57	100	42-17	100	CK5	0

Tabla 130 La prueba comparativa de actividad protectora frente a mildiú pulverulento del trigo a 100 mg/l

N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	actividad protectora (%)
30-2-19	100	33-49	100	122-69	100
31-30	98	33-57	100	123-69	100
31-69	100	33-69	100	125-69	100
32-19	100	35-19	70	126-69	100
32-21	100	36-19	100	127-69	100
32-30	100	37-19	95	128-69	100
32-69	100	42-69	100	CK2	50
33-4	100	44-19	100	CK3	0
33-19	100	118-69	100	CK4	0
33-30	100	119-69	100	CK5	0

Tabla 131 La prueba comparativa de actividad protectora frente a roya del maíz

N.º de Compuesto	efecto de control frente a roya del maíz (%)	
	100 mg/l	25 mg/l
32-57	98	85
32-69	90	85
37-19	100	90
42-69	90	85
CK3	20	0
CK4	0	0
CK5	70	60

5 Tabla 132 La prueba comparativa de actividad protectora frente a antracnosis del pepino a 100 mg/l

N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	actividad protectora (%)	N.º de Compuesto	(%) actividad protectora (%)
31-19	90	33-4	85	122-69	85
31-49	85	33-19	100	123-69	90
31-57	98	40-19	100	126-69	95
32-4	90	40-57	98	127-69	92
32-18	85	42-1	95	CK3	0
32-19	100	42-69	95	CK4	0
32-49	100	118-69	80	CK5	0

Ejemplo 9: Prueba de bioactividad frente a insectos y ácaros

La determinación de la actividad insecticida de compuestos de la presente divulgación frente a unos pocos insectos se realizó mediante los siguientes procedimientos:

Los compuestos se disolvieron en disolvente mixto (acetona:metanol = 1:1), y se diluyeron a la concentración requerida con agua que contenía 0,1 % de tween 80.

Se usaron polilla de la col, cogollero, pulgón del melocotonero y arañuela común como objetivos y se usó el método de pulverización mediante aerógrafo para la determinación de ensayos biológicos insecticidas.

(1) Prueba de bioactividad frente a polilla de la col

El método de pulverización mediante aerógrafo: Las hojas de col se dispusieron en placas de 2 cm de diámetro mediante el uso de punzón. Una solución de prueba (0,5 ml) se pulverizó mediante aerógrafo a la presión de 0,7 kg/cm² en ambos lados de cada placa. 10 larvas del segundo estadio se colocaron en las placas de Petri después de secarse al aire el disco de hoja y prepararse 3 réplicas para cada tratamiento. Entonces, los insectos se mantuvieron en una sala de observación (25 °C, 60~70 % de H. R.). Las puntuaciones se realizaron y las mortalidades se calcularon después de 72 h.

Algunos de los resultados de prueba frente a polilla de la col:

A la dosis de 600 ppm, los compuestos 33-19, 37-19 y así sucesivamente mostraron un 100 % de control frente a polilla de la col.

(2) Prueba de bioactividad frente a pulgón verde del melocotonero

Método: Se pusieron papeles de filtro en placas de cultivo (diámetro = 6 cm), y se vertió agua sobre los papeles de filtro para preservar la humedad. Los pulgones verdes del melocotonero (*Myzus Persicae* Sulzer) se mantuvieron sobre

la col. Se colocaron hojas (diámetro = 3 cm) de aproximadamente 15-30 pulgones en las placas de cultivo. Se usaron pruebas de bioactividad, el método de pulverización foliar con aerógrafo, presión = 10 psi (0,7 kg/cm²), volumen de pulverización = 0,5 ml. Los estudios se realizaron a tres temperaturas constantes 25 + 1 C en cabinas de incubador con 60 + 5 % de H.R. Estudio de los pulgones supervivientes después de 48 h y cálculo de las tasas de muerte.

A la dosis de 600 ppm, los compuestos 31-49, 32-17, 32-21, 32-30, 32-33, 32-57, 33-21, 33-57, 37-19, 42-1, 42-57, 59-21 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a pulgón verde del melocotonero; a la dosis de 100 ppm, los compuestos 32-21, 33-21, 37-19 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a pulgón verde del melocotonero; a la dosis de 5 ppm, el compuesto 33-21 mostró un 100 % de control frente a pulgón verde del melocotonero.

(3) Prueba de bioactividad frente a araña común

El método: Se tomaron brotes de haba con dos hojas verdaderas en maceta, los adultos sanos de araña común se inoculaban en las hojas. Los adultos se contaron y entonces se pulverizaron con aerógrafo a la presión de 0,7 kg/cm² y a una dosis de 0,5 ml. Se prepararon 3 réplicas para cada tratamiento. Y entonces estos se mantuvieron en una sala de observación convencional. Las puntuaciones se realizaron y las mortalidades se calcularon después de 72 h.

Prueba de bioactividad frente a araña común:

A la dosis de 600 ppm, los compuestos 30-1-57, 30-2-19, 31-23, 32-17, 32-21, 32-23, 32-30, 32-57, 32-78, 33-4, 33-57, 36-19, 37-19, 40-4, 42-17, 42-57, 42-78, 44-19, 59-21 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a araña común; a la dosis de 100 ppm, los compuestos 32-21, 32-57, 36-19, 37-19, 42-57, 44-19 y así sucesivamente mostraron más de un 80 % de control frente a araña común; a la dosis de 10 ppm, ambos compuestos 32-57 y 37-19 mostraron más de un 80 % de control frente a araña común.

(4) Los resultados de prueba de contraste de algunos compuestos y contrastes

Se realizaron pruebas de contraste entre algunos compuestos y contrastes. Los resultados de prueba se enumeran de la tabla 133 a la tabla 135 ("///" en las siguientes tablas significa sin prueba).

Tabla 133 pruebas de contraste frente a polilla de la col

N.º de Compuesto	Actividad insecticida frente a polilla de la col (%)
	600 mg/l
33-19	100
37-19	100
CK1	43
CK2	20
CK3	0
CK4	0
CK5	0

Tabla 134 pruebas de contraste frente a pulgón del melocotonero

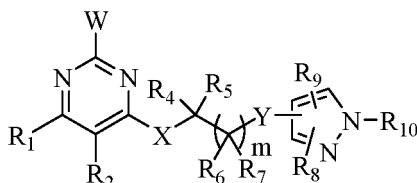
N.º de Compuesto	Actividad insecticida frente a pulgón del melocotonero (%)
	100 mg/l
33-21	100
37-19	84
CK1	0
CK3	30
CK4	0
CK5	22

Tabla 135 pruebas de contraste frente a araña común

N.º de Compuesto	Actividad insecticida frente a araña común (%)	
	600 mg/l	100 mg/l
32-57	100	100
36-19	100	98
37-19	100	100
44-19	100	100
CK3	56	///
CK4	59	///
CK5	58	///

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de pirazol sustituido que contiene pirimidinilo representado por la fórmula general I:



I

en donde:

R₁, R₂ y su anillo de pirimidina conjunto forman un anillo de cinco miembros, un anillo de seis miembros, un anillo de siete miembros o un anillo de ocho miembros que contienen un átomo de carbono, un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

X se selecciona entre NR₃, O o S;

Y se selecciona entre NR₃, O o S;

R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂, alqueniitio C₂-C₁₂, alqueniilo C₂-C₁₂, haloalqueniilo C₂-C₁₂, haloalquiniilo C₂-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilaminosulfonilo C₁-C₁₂, di(alquil C₁-C₁₂)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₁₂, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₁₂, cicloalquiloxicarbonilo C₃-C₁₂, alquilcarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilcarbonilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxycarbonilo C₁-C₁₂, alquilcarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquilaminocarbonilo C₁-C₁₂, di(alquil C₁-C₁₂)aminocarbonilo, alquinoxycarbonilo C₂-C₁₂, alquinoxycarbonilo C₂-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alcoxycarbonilo C₁-C₁₂, alquilaminotio C₁-C₁₂, di(alquil C₁-C₁₂)aminotio, (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₆, y (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquilo C₁-C₆ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₆ no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 grupos siguientes: halo, nitro, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₈;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₈;

el número entero m se selecciona entre 0 y 5;

R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxycarbonilo C₁-C₁₂, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxycarbonilo C₁-C₁₂, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₁₀ se selecciona entre cicloalquilo C₃-C₈, haloalquilo C₁-C₁₂, alquilcarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilcarbonilo C₁-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero)ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₁₂, alquilamino C₁-C₁₂, haloalquilamino C₁-C₁₂, di(alquilo C₁-C₁₂)amino, halo-di(alquil C₁-C₁₂)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂, alqueniilo C₂-C₁₂, alquiniilo C₂-C₁₂, alquenoxi C₂-C₁₂, haloalquenoxi C₂-C₁₂, alquinox C₂-C₁₂, haloalquinox C₂-C₁₂, alquilsulfonilo C₁-C₁₂, haloalquilsulfonilo C₁-C₁₂, alquilcarbonilo C₁-C₁₂, haloalquilcarbonilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonilo C₁-C₁₂, haloalcoxycarbonilo C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalcoxi C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalquiltio C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alcoxycarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalcoxycarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquiltiocarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, haloalquiltiocarbonil C₁-C₁₂-alquilo C₁-C₁₂, alquilcarboniloxi C₁-C₁₂, haloalquilcarboniloxi C₁-C₁₂, alcoxycarboniloxi C₁-C₁₂, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₁₂, alquilsulfoniloxi C₁-C₁₂, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₁₂, alcoxi C₁-C₁₂-alcoxi C₁-C₁₂ o haloalcoxi C₁-C₁₂-alcoxi C₁-C₁₂;

R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₁₂ o haloalquilo C₁-C₁₂; W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₁₂, haloalquilo C₁-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₁₂, alquiltio C₁-C₁₂ o alquilsulfonilo C₁-C₁₂;

la posición de Y unido al anillo de pirazol es de entre la posición 3, la posición 4 o la posición 5;

cuando Y está unido a la posición 3 del pirazol, R₈ está en la posición 4, R₉ está en la posición 5;

cuando Y está unido a la posición 4 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 5;

cuando Y está unido a la posición 5 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 4;

o las sales formadas a partir de los compuestos representados por la fórmula general I.

2. Los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados por que** en la fórmula general I:

- 5 R₁, R₂ y su anillo de pirimidina conjunto forman un anillo de cinco miembros o un anillo de seis miembros que contienen un átomo de carbono, un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
X se selecciona entre NR₃, O o S;
Y se selecciona entre NR₃, O o S;
R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, alqueniltio C₂-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆,
10 alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₆, haloalquilsulfinilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilaminosulfonilo C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₆, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₆, cicloalquiloalcoxycarbonilo C₃-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilcarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilaminocarbonilo C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo, alquinoxycarbonilo C₂-C₆, alquinoxycarbonilo C₂-C₆,
15 alcoxi C₁-C₆-alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilaminotio C₁-C₆, di(alquil C₁-C₆)aminotio, y (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₆, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquiloalcoxycarbonilo C₁-C₆ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₆ no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 grupos siguientes: halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;
20 R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₆;
R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₆; el número entero m se selecciona entre 0 y 4;
25 R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;
R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o
30 (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;
R₁₀ se selecciona entre cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;
35 R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquilamino C₁-C₆, haloalquilamino C₁-C₆, di(alquilo C₁-C₆)amino, halodi(alquil C₁-C₆)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquenoxi C₂-C₆, haloalquenoxi C₂-C₆, alquinox C₂-C₆, haloalquinox C₂-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxycarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltiocarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalquiltiocarbonil C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarboniloxi C₁-C₆, haloalquilcarboniloxi C₁-C₆, alcoxycarboniloxi C₁-C₆, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₆, alquilsulfoniloxi C₁-C₆, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆;
40 R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;
W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆ o alquilsulfonilo C₁-C₆;
la posición de Y unido al anillo de pirazol es de entre la posición 3, la posición 4 o la posición 5;
cuando Y está unido a la posición 3 del pirazol, R₈ está en la posición 4, R₉ está en la posición 5;
50 cuando Y está unido a la posición 4 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 5;
cuando Y está unido a la posición 5 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 4.

3. Los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 2, **caracterizados por que** en la fórmula general I:

- 55 R₁, R₂ y su anillo de pirimidina conjunto forman un anillo de cinco miembros o un anillo de seis miembros que contienen un átomo de carbono, un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
X se selecciona entre NR₃, O o S;
R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquiltio C₁-C₄, alqueniltio C₂-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄,
60 alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilaminosulfonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₄, cicloalquiloalcoxycarbonilo C₃-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminocarbonilo, alquinoxycarbonilo C₂-C₄, alquinoxycarbonilo C₂-C₄,
65 C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminocarbonilo, alquinoxycarbonilo C₂-C₄, alquinoxycarbonilo C₂-C₄,

alcoxi C₁-C₄-alcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilaminotio C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminotio, y (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₄, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquiloalcoxycarbonilo C₁-C₄ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₄ no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 grupos siguientes: halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;

el número entero m se selecciona entre 0 y 3;

R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

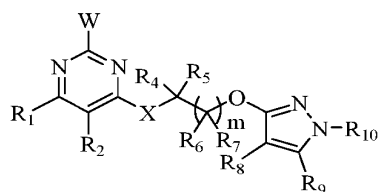
R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₁₀ se selecciona entre cicloalquilo C₃-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

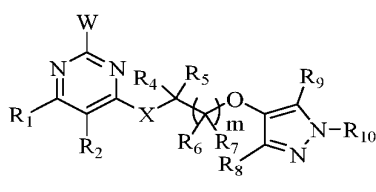
R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilamino C₁-C₄, haloalquilamino C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)amino, halo-di(alquil C₁-C₄)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquénilo C₂-C₄, alquínilo C₂-C₄, alquénoxi C₂-C₄, haloalquénoxi C₂-C₄, alquínoxi C₂-C₄, haloalquínoxi C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₄, haloalquilcarboniloxi C₁-C₄, alcoxycarboniloxi C₁-C₄, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄;

R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o alquilsulfonilo C₁-C₄;

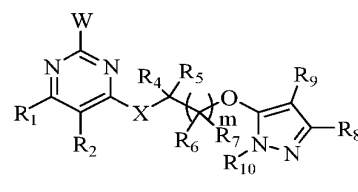
Y es O, la posición de Y unido al anillo de pirazol es de entre la posición 3, la posición 4 o la posición 5; cuando Y está unido a la posición 3 del pirazol, R₈ está en la posición 4, R₉ está en la posición 5, la fórmula general I se representa por la fórmula general I-1; cuando Y está unido a la posición 4 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 5, la fórmula general I se representa por la fórmula general I-2; cuando Y está unido a la posición 5 del pirazol, R₈ está en la posición 3, R₉ está en la posición 4, la fórmula general I se representa por la fórmula general I-3;



I-1

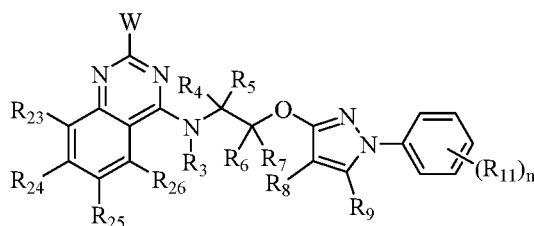


I-2

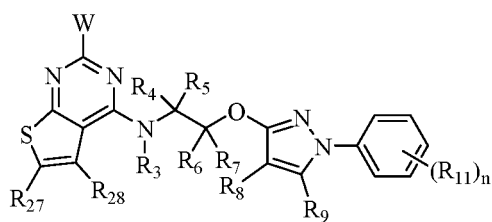
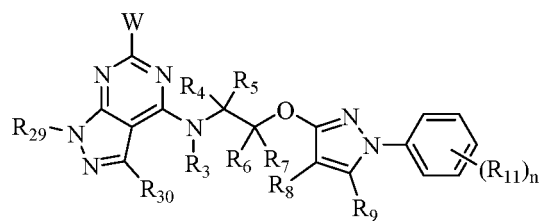
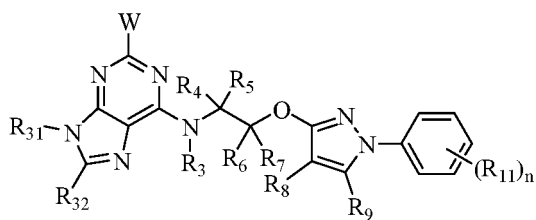
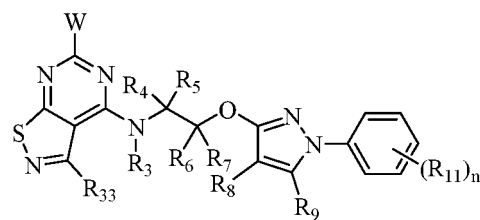
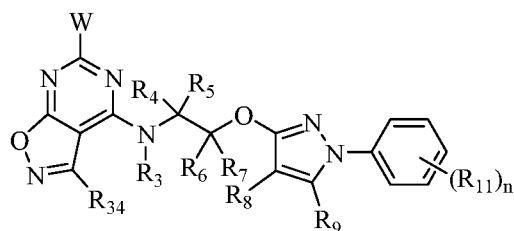
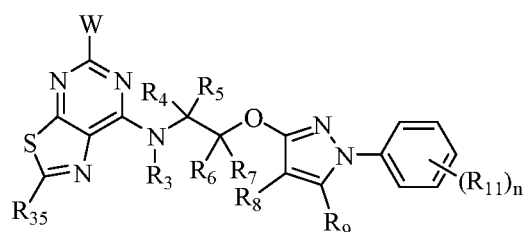
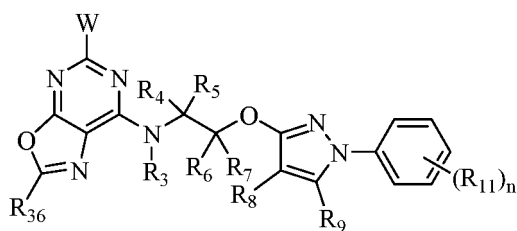
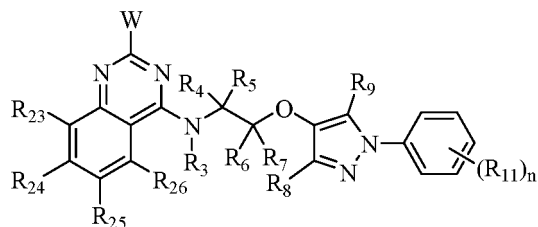
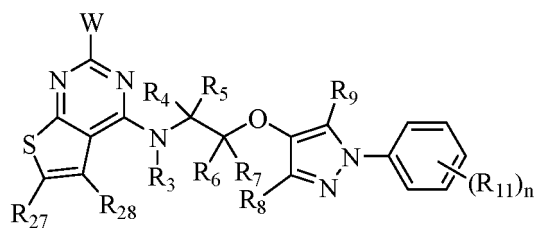
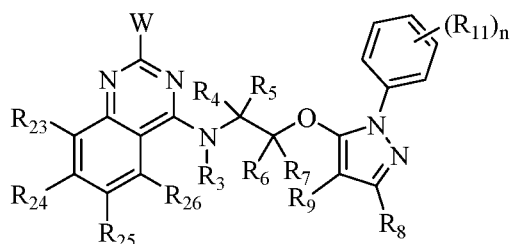
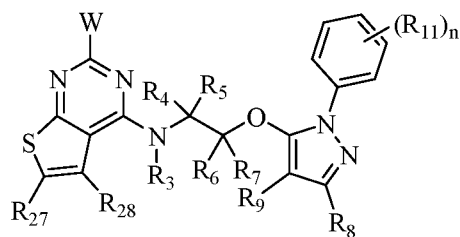


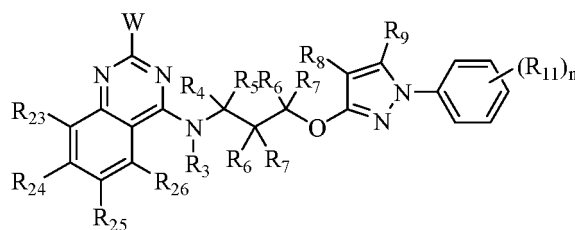
I-3

4. Los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 3, **caracterizados por que** en donde las estructuras de compuestos de fórmula general I-1 se representan por las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-4F o I-4G; las estructuras de compuestos de fórmula general I-2 se representan por las fórmulas generales I-2F o I-2G; las estructuras de compuestos de fórmula general I-3 se representan por las fórmulas generales I-3F o I-3G;

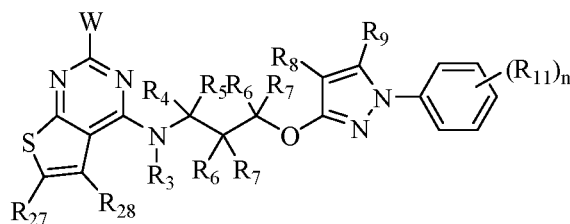


I-1F

**I-1G****I-1H****I-1I****I-1J****I-1K****I-1L****I-1M****I-2F****I-2G****I-3F****I-3G**



I-4F



I-4G

5 en donde:

- R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquiltio C₁-C₄, alqueniltio C₂-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄,
 10 alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄,
 alquilaminosulfonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminosulfonilo, alquilsulfonilaminocarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonilaminosulfonilo C₁-C₄, cicloalquiloxycarbonilo C₃-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄,
 15 alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilcarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminocarbonilo, alquenoxycarbonilo C₂-C₄, alquinoxycarbonilo C₂-C₄,
 alcoxi C₁-C₄-alcoxycarbonilo C₁-C₄, alquilaminotio C₁-C₄, di(alquil C₁-C₄)aminotio, y (hetero)arilcarbonil-alquilo C₁-C₄, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)ariloxycarbonilo, (hetero)aril-alquilo C₁-C₄ o (hetero)aril-alquilo C₁-C₄ no
 20 sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 grupos siguientes: halógeno, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;
 R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₄, R₅ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;
 R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄; o R₆, R₇ y su carbono conjunto también pueden formar un ciclo C₃-C₄;
 25 R₈ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o
 (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;
 R₉ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o
 30 (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;
 R₁₁ se selecciona entre halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilamino C₁-C₄, haloalquilamino C₁-C₄, di(alquilo C₁-C₄)amino, halo-di(alquil C₁-C₄)amino, C(=O)NR₁₂R₁₃, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquenoxi C₂-C₄,
 haloalquenoxi C₂-C₄, alquinox C₂-C₄, haloalquinox C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-
 35 alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄,
 haloalquiltiocarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₄, haloalquilcarboniloxi C₁-C₄, alcoxycarboniloxi C₁-C₄, haloalcoxycarboniloxi C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, haloalquilsulfoniloxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄ o
 haloalcoxi C₁-C₄-alcoxi C₁-C₄;
 el número entero n se selecciona entre 0 y 5, cuando n es 0, el anillo de benceno es fenilo no sustituido; cuando n
 40 es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;
 R₁₂, R₁₃ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
 R₁₄ se selecciona entre cicloalquilo C₃-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o alcoxycarbonil C₁-C₄-alquilo C₁-C₄;
 45 R₁₅, R₁₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxycarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;
 R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, ciano, nitro,

alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R₂₁, R₂₂ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, OH, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no

sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, OH, amino, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₄;

R₂₇, R₂₈ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o

sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₂₉ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no

sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₀ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₁ se selecciona entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no

sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₂ se selecciona entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos

adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₃, R₃₄ se pueden seleccionar respectivamente entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄, haloalcoxicarbonilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₅, R₃₆ se pueden seleccionar respectivamente entre H, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

W se selecciona entre H, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o alquilsulfonilo C₁-C₄;

las sales representadas por la fórmula general I son: las sales formadas a partir de los compuestos representados por las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-2F, I-2G, I-3F, I-3G, I-4F o I-4G con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

5. Los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 4, **caracterizados por que** en las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-2F, I-2G, I-3F, I-3G, I-4F o I-4G: en donde:

R₃ se selecciona entre H, OH, CHO, COCH₃, COC₂H₅, COC₃H₇, COCF₃, COPh, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉,

s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, OCH₂CF₃, , SCH₃, SC₂H₅, CH₂CH=CH₂, CH₂C≡CH, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, SO₂CH₂CF₃, SO₂NHCH₃, SO₂NHC₂H₅, SO₂N(CH₃)₂, SO₂N(C₂H₅)₂, CONHSO₂CH₃, COOCH₃, COOC₂H₅, COOC₃H_{7-n}, COOC₃H_{7-i}, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, COOCH=CH₂, COOC=CH, SNHCH₃, SNHC₂H₅ o SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, OCH₃, OC₂H₅, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O o t-C₄H₉O;

R₆, R₇ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, OCH₃, OC₂H₅, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O o t-C₄H₉O;

R₈ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ o CF₃;

R₉ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ o CF₃;

R₁₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CN, NH₂, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, COOCH₃, COOC₂H₅, CONH₂, CONHCH₃, CONHC₂H₅ o CON(CH₃)₂;

el número entero n se selecciona entre 0 y 5, cuando n es 0, el anillo de benceno es fenilo no sustituido; cuando n es mayor 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;

R₁₄ se selecciona entre ciclopropilo, ciclobutilo, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃ o CH₂CF₃;

R₁₅, R₁₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos

adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ u OCF₃;

R₂₁, R₂₂ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, OH, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃ u OCH₂CF₃;

R₂₇, R₂₈ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, n-C₃H₇O, i-C₃H₇O, n-C₄H₉O, s-C₄H₉O, i-C₄H₉O, t-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₂₉ se selecciona entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ciclopropilo, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, COC₂H₅, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₀ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₁ se selecciona entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ciclopropilo, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, COC₂H₅, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₂ se selecciona entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente por 1 a 5 R₁₁;

R₃₃, R₃₄ se pueden seleccionar respectivamente entre CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ciclopropilo, COCH₃, COC₂H₅, COOCH₃, COOC₂H₅, COOCH₂CF₃, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

R₃₅, R₃₆ se pueden seleccionar respectivamente entre H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, y (hetero)arilo, (hetero)arilmetilo, (hetero)arilcarbonilo, (hetero)arilmetilcarbonilo o (hetero) ariloxicarbonilo no sustituidos o sustituidos adicionalmente con 1 a 5 R₁₁;

W se selecciona entre H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, n-C₃H₇, i-C₃H₇, n-C₄H₉, s-C₄H₉, i-C₄H₉, t-C₄H₉, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, SCH₃, SC₂H₅, SO₂CH₃ o SO₂CH₂CH₃;

las sales representadas por la fórmula general I son: las sales formadas a partir de los compuestos representados por las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-2F, I-2G, I-3F, I-3G, I-4F o I-4G con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

6. Los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 5, **caracterizados por que** en las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-2F, I-2G, I-4F o I-4G:

R₃ se selecciona entre H, CH₃, COCH₃, COCF₃, OCH₃, SCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, SO₂NHCH₃, SO₂N(CH₃)₂, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, SNHCH₃ o SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br o CH₃;

R₆, R₇ son H;

R₈ es H;

R₉ es H;

R₁₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ u OCF₃;

el número entero n se selecciona entre 0 y 5, cuando n es 0, el anillo de benceno es fenilo no sustituido; cuando n es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br, I o CH₃;

R₂₇, R₂₈ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente de H, F, Cl, Br o I;

W se selecciona entre H, F, Cl, Br, I o CH₃;

las sales representadas por la fórmula general I son: las sales formadas a partir de los compuestos representados por las fórmulas generaes I-1F, I-1G, I-2F, I-2G, I-4F o I-4G con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

7. Los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 5, **caracterizados por que** en las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-2G, I-4F o I-4G:

R₃ se selecciona entre H, CH₃, COCH₃, OCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂ o

SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ pueden ser iguales o diferentes, seleccionados respectivamente entre H o CH₃;

R₆, R₇ son H;

R₈ es H;

R₉ es H;

R₁₁ se selecciona entre F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ u OCF₃;

el número entero n se selecciona entre 1 y 5, cuando n es mayor de 1, R₁₁ puede ser igual o diferente;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ son H;

R₂₇ es H;

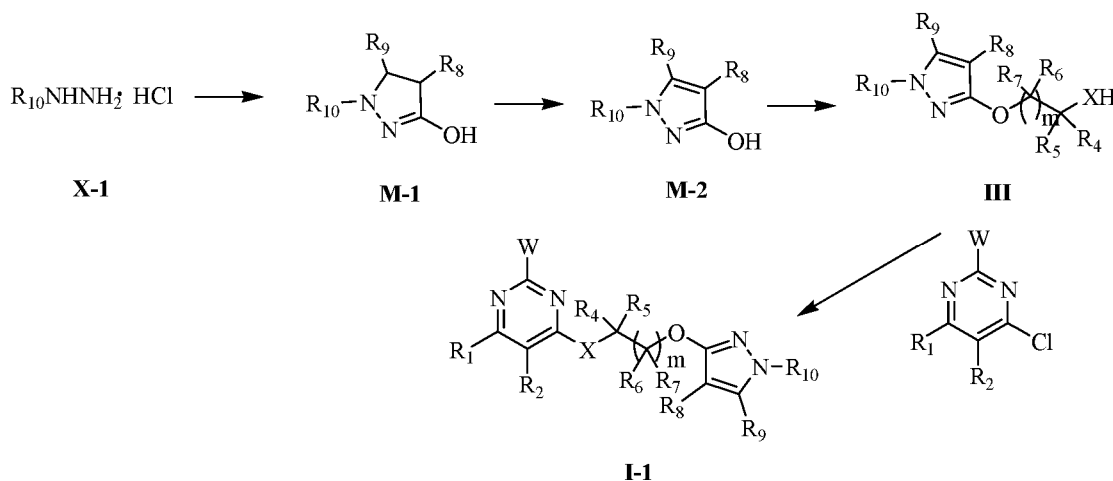
R₂₈ es Cl;

W se selecciona entre H, F, Cl, Br o I;

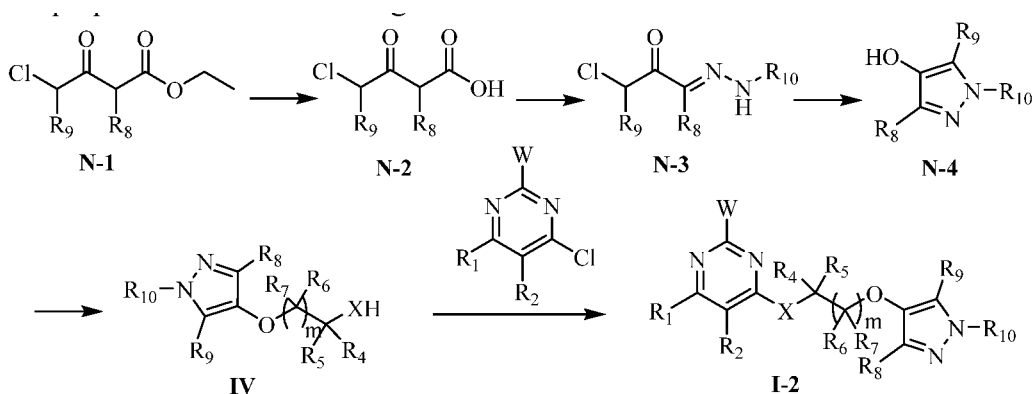
las sales representadas por la fórmula general I son: las sales formadas a partir de los compuestos representados por las fórmulas generales I-1F, I-1G, I-2G, I-4F o I-4G con ácido clorhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido oxálico, ácido metilsulfónico, ácido *p*-toluenosulfónico, ácido benzoico, ácido alizárico, ácido maleico, ácido fumárico, ácido sórbico, ácido málico o ácido cítrico.

8. Un método de preparación de los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con la reivindicación 3, **caracterizado por que:**

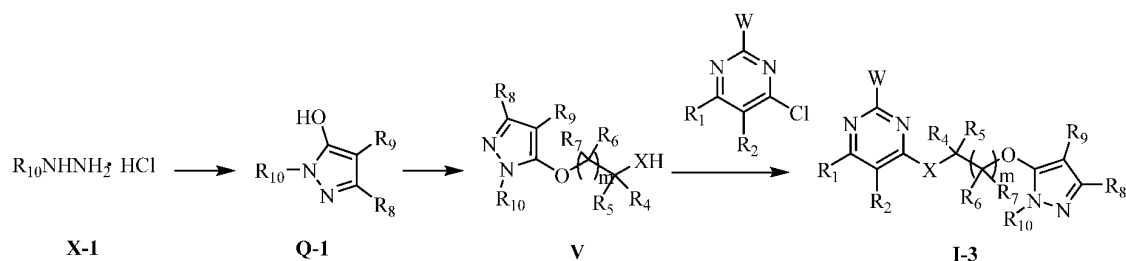
el método de preparación de la fórmula general I-1 es como sigue:



el método de preparación de la fórmula general I-2 es como sigue:



el método de preparación de la fórmula general I-3 es como sigue:



9. Un uso de compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-7 para preparar fungicidas, insecticidas/acaricidas en el campo agrícola u otros campos.

10. Una composición de fungicidas, insecticidas/acaricidas, **caracterizada por** contener los compuestos de pirazol sustituidos que contienen pirimidinilo representados por la fórmula general I de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-7 como un principio activo y un vehículo aceptable, en donde el porcentaje en peso del principio activo en la composición es de un 0,1-99 %.

11. Un uso de la composición de acuerdo con la reivindicación 10 para preparar fungicidas, insecticidas/acaricidas en el campo agrícola u otro campo.