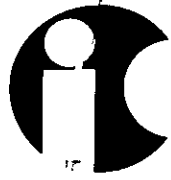


Q.Y.



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

[Handwritten signature]

PUT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

04-2808

21. EXPEDIENTE N°

54. TÍTULO

DERIVADOS DE DIAMINA, PROCESO PARA PRODUCIR LOS DERIVADOS DE DIAMINA,
Y FUNGICIDAS QUE CONTIENEN LOS DERIVADOS DE DIAMINA COMO INGREDIENTE ACTIVO.

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

COAC 271/20

71. SOLICITANTE

mitsui chemicals inc.

DOMICILIO

Tokyo, Japan

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

Código 1092

22. BOGOTÁ, D. C.

[Handwritten signature]

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

04 002808 00

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO

Radicación: 04002808 00000000

Folios: 285

5n

Fecha (MM): 2004-01-16 17:12:28

Trámite: 011 PCI-PRIMERA 3/9 FASE NACIONAL 411 PRESENTACION

Dependencia: 0020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

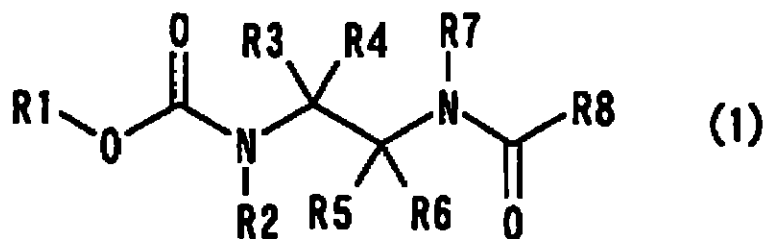
1	SOLICITUD DE:	
	☒ Patente de Invención. ☐ Patente de Modelo de Utilidad.	
	☐ Capítulo I. ☒ Capítulo II.	
2	SOLICITANTE (71) Nombre: MITSUI CHEMICALS INC. sociedad constituida y existente bajo las leyes de Japón. Dirección: 1-5-2, Higashi-Shimbashi Minato-ku, Tokyo 105-7117 Japón Domicilio: Tokyo, Japón.	IDENTIFICACION C.C. ☐ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: _____
3	REPRESENTANTE O APODERADO Nombre: EMILIO FERRERO Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35 Teléfono: 347 38 11 Fax: 217 92 11 E-mail: <u>clientes@camyp.com.</u> Domicilio: Bogotá, Colombia.	IDENTIFICACION C.C. ☒ NIT ☐ C.E. ☐ Otro ☐ Cual _____ Número: <u>438.019</u> T.P. <u>31.929</u>
4	INVENTOR (ES) (72) 1. CHIBA YUTAKA 1144, Togo, Mobara-shi, Chiba 297-0017 Japón 2. DAIDO, Hidenori 1144, Togo, Mobara-shi, Chiba 297-0017 Japón 3. AKASE Tomohisa 1-5-2, Higashi-Shimbashi, Minato-ku, Tokyo 105-7117 Japón 4. MATSUNO Hirozumi 1-5-2, Higashi-Shimbashi Minato-ku, Tokyo 105-7117 Japón 5. KISHI Junro 1-5-2, Higashi-Shimbashi Minato-Ku Tokyo 105-7117 Japón	
5	PCT (88) Solicitud Internacional No. <u>PCT/JP02/07319</u> Fecha: <u>Julio 18 de 2002</u> Publicación Internacional No. <u>WO 03/008372</u> Fecha: <u>Enero 30 de 2003</u>	
6	Título (54) <u>DERIVADOS DE DIAMINA, PROCESOS PARA PRODUCIR LOS DERIVADOS DE DIAMINA Y FUNGICIDAS QUE CONTIENEN LOS DERIVADOS DE DIAMINA C MO INGREDIENTE ACTIV.</u>	

7 Clasificación Internacional (51) <u>C07C 271/20</u> 2				
8 Prioridad SI ☒ NO ☐		(33) País de Origen <u>JP</u>	(32) Fecha <u>Julio 18 de 2001</u>	(31) Número de Solicitud <u>2001-218387</u>
9 Comprobante de pago No.: <u>04-690</u> Fecha: <u>Enero 6 de 2004</u>				
10 Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 422.000.00. ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad. ☐ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica. ☐ Poderes, si fuere el caso. ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante. ☐ Declaraciones. ☒ Copia de la solicitud Internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos) ☒ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA. ☐ De ser el caso, copia del contrato de accaso. ☐ De ser el caso, documento que acredita la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas. ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico. ☒ Arte final 12x12 ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud. ☐ Otros				

11

FIGURA CARACTERISTICA:

3



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: EMILIO FERRERO

FIRMA:

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

-MRE/lms



CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA
TOKIO-JAPON

111-11
0137

4

El Suscrito, Encargado de las Funciones Consulares en Tokio, vistos los siguientes documentos:

- 1) Certificado de Registro Mercantil de la Compañía;
- 2) Certificado auténtico sobre autorización para otorgar el poder;

CERTIFICA

Que la compañía **MITSUI CHEMICALS, INC.** está conformada de acuerdo con las leyes del Japón y cumple con su objeto social conforme a las mismas.

Que el señor **SHINICHI NAEMURA** en su carácter de **SENIOR DIRECTOR, INTELLECTUAL PROPERTY DIV.** de la citada compañía, está autorizado para conferir el poder adjunto.

Que el señor **TAKASHI SUZUKI**, quien autentica el mencionado documento, es funcionario autorizado de la División Consular del Ministerio de Relaciones Exteriores del Japón, y su firma coincide con la registrada en este Consulado.

El Encargado de las Funciones Consulares no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento adjunto.

Tokio, 14 de Diciembre de 1.998

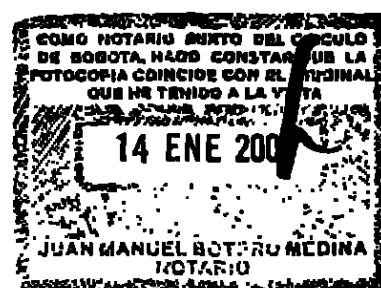


Juan Pablo Turbay
JUAN PABLO TURBAY
Segundo Secretario
Encargado de
las Funciones Consulares

Número: 1473

Derechos: US\$106 (Resolución 2570, Sep. 30 1992)
(Ciento seis dólares)

PAGADO IMPUESTO DE TIMBRE



MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

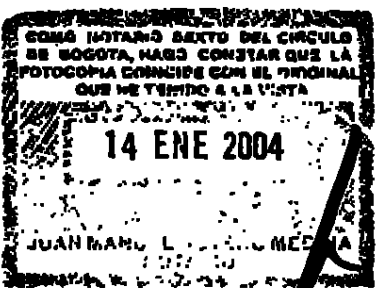
N.O. SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

204003
Juan Orday
COYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTIAGO HERNANDEZ

99 JAN 20 PM 12:14

Gerardo E. de Sotomayor
Traductores e Interpretes Oficiales
Traductores en Idioma Guaraní



Para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales.

REPRESENTATION AND POWER OF ATTORNEY

I (we), the undersigned / Yo (nosotros), abajo firmado (s)

Mitsui Chemicals, Inc.

of/domiciliado (s) en 2-5, Kasumigaseki 3-chome,
Chiyoda-ku, Tokyo, Japan

por el presente nombramos a GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciliados en la Carrera 4ª N° 72-35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el párrafo 1º del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad y diseños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas, defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales, enseñas, variedades vegetales y denominaciones de origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor, oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial, nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos relacionados con estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint GERMAN CAVELIER, tpa. 832; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; EMILIO FERRERO, tpa. 31929; and LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555; domiciled at Carrera 4ª Nª 72-35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a Power of Attorney in favor of the above-named attorneys-at-law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models and industrial designs; the registration of trademarks, collective, defensive and service marks, slogans, commercial names, trade emblems, vegetal varieties and denominations of origin; its renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Actions of unfair competition, protection to the consumer, oppositions or observations, administrative or Court cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, and administrative suits relating to those rights; actions and suits instituted by me (us) or against me (us). And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, recede, retract, and annul, and act and intervene by representatives without a power of attorney. STAR QUE LA E

Given and signed this/Dado y firmado hoy

In/en

Tokyo, Japan

October 27th 1991

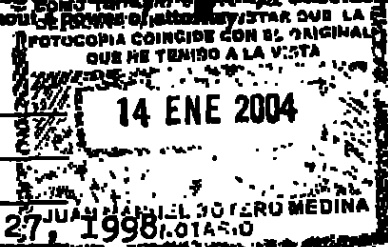
Signature

Shinichi Naemura

11

SHINICHI NAGAMURA
Senior Director, Intellectual Property Div.

CAYELIER ABOGADOS



CERTIFICADO NOTARIAL (INDIVIDUAL)

A los ____ días del mes de ____ de 19 ____
ante mí, Notario Público de ____
compareció(eron) personalmente ____

a quienes) doy fe de conocer y me consta que es(son) la(s)
persona(s) firmante(s) del documento que precede, y quien(es)
tiene(n) capacidad legal para otorgarlo.

Notario Público — Notary Public

CERTIFICADO NOTARIAL (SOCIEDAD)

Hoy, ____ de ____ de 19 ____
compareció(eron) ante mí

a quienes) conozco personalmente y que firma(n) este documen
to en representación de la Sociedad/compañía

denominada ____

Certifico:

1. Que he visto los siguientes documentos:*

2. Que dichos documentos prueban lo siguiente:

2.1. Que ____
es una Sociedad/Compañía legalmente constituida y existente
de acuerdo con las leyes de ____

2.2. Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es

2.3. Que el objeto u objeto para los cuales se otorga el presente
poder están comprendidos dentro del objeto social de la
mencionada Sociedad/Compañía.

2.4. Que el(los) Sr.(Sres.) ____

está(n) autorizado(s) para otorgar el presente Poder.

Ciudad

Estado

Hoy

de 19

Notario Público — Notary Public

* Los documentos deben identificarse con fecha y origen.

NOTARIAL CERTIFICATE (INDIVIDUAL)

On this ____ day of ____ 19 ____
before me, a Notary Public of ____
personally appeared ____

to me known, and known to me to be the person(s) who
executed that foregoing document, and who has(have) legal
capacity to execute it.

NOTARIAL CERTIFICATE (CORPORATION)

On this ____ day of ____ 19 ____
appeared before me

who(m) I know personally and who(m) signed this document as
representative(s) of the Corporation/Company

named ____

I Certify:

1. That I have seen the following documents:*

2. That the above documents duly prove the following:

2.1. That ____
is a Corporation/Company legally constituted and in existence
in accordance with the laws of ____

2.2. That the domicile of said Corporation/Company is

2.3. That the purpose of purposes for which the present Power of
Attorney is granted are comprised within the corporation
purposes set forth in the charter of the mentioned
Corporation/Company.

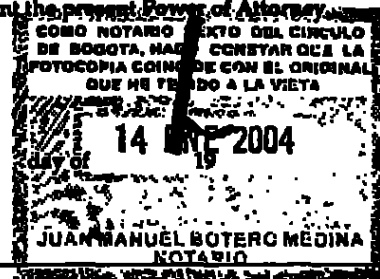
2.4. That Mr.(Messrs.) ____

is(are) authorized to grant the present Power of Attorney.

City

State

This



* Documents must be identified with date and origin.

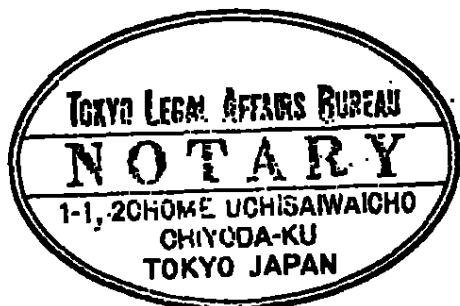
NOTARIAL CERTIFICATE

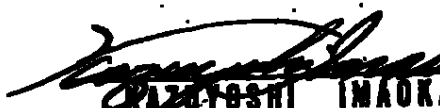
I, NOTARY, duly authorized, admitted and practising
at Tokyo, Japan, DO HEREBY CERTIFY THAT:

The signature that appears at the foot of foregoing
document is the genuine and authentic signature of
Shinichi Naemura, Senior Director, Intellectual Property Div.
of Mitsui Chemicals, Inc. located at 2-5, Kasumigaseki 3-chome,
Chiyoda-ku, Tokyo, Japan
, a corporation existing and organized under the laws of Japan
who has produced sufficient proof of his power to execute
the said instrument on behalf of the above-mentioned
corporation.

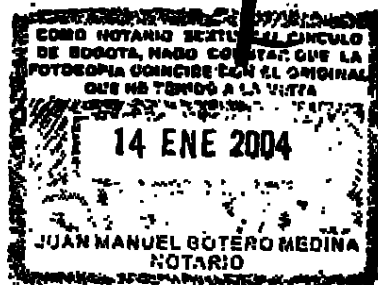
IN TESTIMONY WHEREOF, I have hereto subscribed my
name and affixed my seal of office.

OCT 27 1998




KAZUYOSHI INAOKA
NOTARY

NO. 1-1, 2-CHOME UCHISAIWAICHO
CHIYODAKU TOKYO JAPAN





平成 10 年 登 録 第 1760 号

認 証

囑託人 三井化学株式会社 知的財産部長 苗村 新一
の代理人 城野 喬 は、本公証人に対し、囑託人が、
別添文書に署名したことを自認している旨陳述した。



よって、これを認証する。

平成 10 年 10 月 27 日、本公証人役場において

東京都千代田区内幸町 2 丁目 1 番 1 号 霞ヶ関公証役場

東京法務局所属

公証人

今岡一春



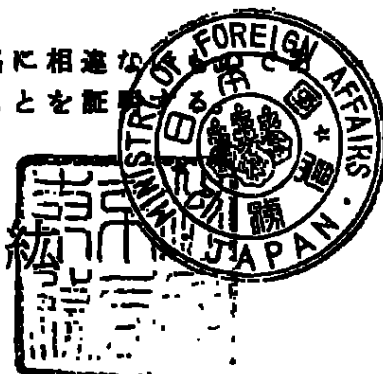
總公証 № 037332 号

証 明

上記署名は、東京法務局所属公証人の署名に相違な
かつ、その押印は、真実のものであることを証

平成 10 年 10 月 27 日

東京法務局長 三 谷



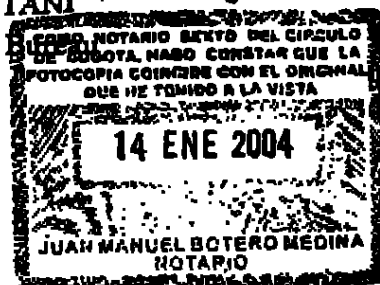
CERTIFICATE

This is to certify that the signature affixed above has been provided
Notary, duly authorized by the Tokyo Legal Affairs Bureau and that
the Official Seal appearing on the same is genuine.

Date OCT 27 1998

Hiroshi MITANI

Director of the Tokyo Legal Affairs



For legalization by the foreign consul in Japan,
this is to certify that the Seal affixed hereto
is genuine.
OCT. 29. 1998
Tokyo.
Ministry of Foreign Affairs
(Consular and Migration Policy Division)

TRADUCCION OFICIAL No.01.012.99 de un documento escrito en inglés el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor al mismo tiempo que la presente. Esta traducción ha sido preparada por Bernarda R. de Martínez, Traductora Oficial debidamente reconocida por el Ministerio de Relaciones Exteriores y aprobada por el Ministerio de Justicia de Colombia mediante Resolución No. 683 de 1991.

(En manuscrito), 1749 212 2UP

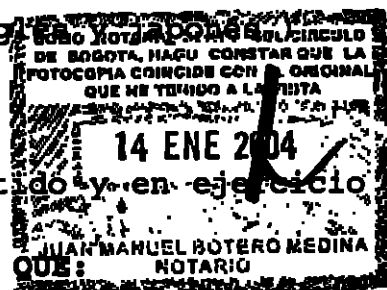
(Se traducen sellos y legalizaciones que aparecen a continuación de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Mitsui Chemicals, Inc. otorga Poder a favor de GERMAN CAVELIER, GONZALO PERDOMO, EMILIO FERRERO y LUZ CLEMENCIA DE PAEZ.)

Dado y firmado hoy 27 de octubre de 1998, en Tokio, Japón, por Shinichi Naemura, Director Principal, División de Propiedad Industrial.

(Se traduce del inglés texto escrito en inglés)

CERTIFICADO NOTARIAL

Yo, NOTARIO, debidamente autorizado, admitido y en ejercicio en Tokio, Japón, POR EL PRESENTE CERTIFICO QUE:



La firma que aparece al final de la página del documento anterior es la firma auténtica de SHINICHI NAEURA, Director Principal, División de Propiedad Intelectual de Mitsui Chemicals, Inc., domiciliada en el 2-5, Kasumigaseki 3-chome, Chiyoda-ku, Tokio, Japón, sociedad existente y constituida

bajo las leyes de Japón. Mr. NAEMURA ha presentado suficiente evidencia de la autoridad que tenía para firmar el documento mencionado en nombre de la sociedad citada anteriormente.

EN TESTIMONIO DE LO CUAL, he estampado mi firma y mi sello del cargo.

27 de octubre de 1998

(Firmado e impreso),

Kazuyoshi Imaoka

Notario

No. 1-1, 2-CHOME UCHISAIWAICHO

CHIYODA TOKIO JAPON

(Sello en tinta), OFICINA DE ASUNTOS JURIDICOS DE TOKIO

NOTARIA NO. 1-1, 2CHOME UCHISAIWAICHO CHIYODA-KU TOKIO JAPON

CERTIFICADO

No. 037332

(Se traduce del inglés texto escrito en inglés y japonés.)

Por medio del presente se certifica que la firma anterior fue estampada por un Notario debidamente autorizado por la Oficina de Asuntos Jurídicos de Tokio y, que el Sello Oficial que aparece allí es auténtico.

Fecha 27 de octubre de 1998

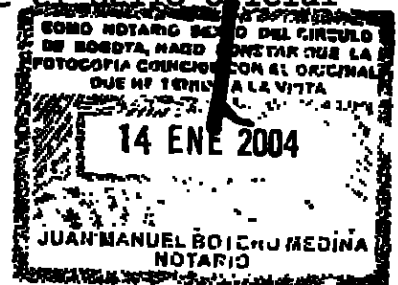
Hiroshi MITANI

Director de la Oficina de Asuntos

Jurídicos de Tokio

(Sello en tinta), MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES JAPON

(Sellos en tinta en japonés)



Para la legalización del cónsul extranjero en el Japón, por medio del presente se certifica que el sello estampado en el presente documento es auténtico.

Tokio, 29 de octubre de 1998.

(Firmado), Takashi Suzuki

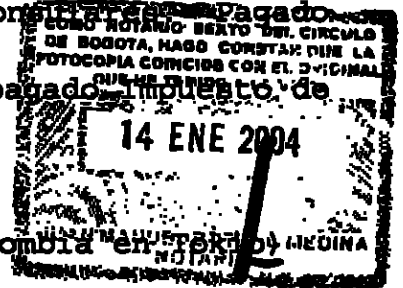
Funcionario

Ministerio de Relaciones Exteriores

(División de Política Consular y Migración)

(En español), Certificación de la firma y cargo de TAKASHI SUZUKI, de la existencia legal de la sociedad MITSUI CHEMICALS, INC. y de la autorización que tenía su Director Principal, SHINICHI NAEMURA, para conferir el poder antes mencionado. Esta certificación fue expedida por el CONSULADO GENERAL DE COLOMBIA en TOKIO-JAPON, bajo el No. 147, del 14 de diciembre de 1998 y firmada por Juan Pablo Turbay, Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares. Pagado Derechos por valor de ciento seis dólares, pagado impuesto de Timbre.

(Sello en tinta del Consulado General de Colombia en Tokio)



(Al dorso), Legalización de la firma que antecede expedida por el MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES, bajo el No. 204003, de fecha 20 de enero de 1998 y firmada por el Jefe de Legalizaciones.

Bernardo R. de Marín

Bernardo R. de Marín
Traductora e Interpret Oficial
Resolución 633 Migración 1994

(Sello parcial en tinta del Consulado General de Colombia en
Tokio)

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en los
archivos de esta oficina para su confrontación y a la cual me
remito.

Bogotá, 22 de enero de 1999

COLO 11464-703-001-3

BRM.1

Bernarda R. de Martínez
Bernarda R. de Martínez
Traductora e Interprete Oficial
Resolución 683 Minjusticia 1991

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

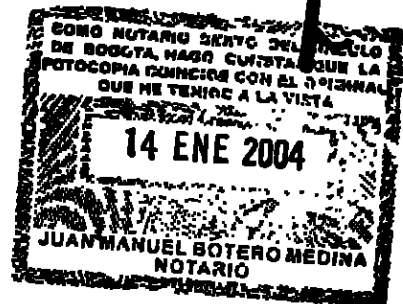
99 JAN 25 AM 11:42

JEFE DE LEGALIZACIONES
SANTAFE DE BOGOTÁ D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES
EXTERIORES

006615

COPIA QUE SE APOBECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) DE
Severdy R.
Alfonso
CONCIDE(N) CON LA FIRMA REGISTRADA POR
EL 19/10/06 EN ESTA NOTARIA
SANTA FE DE BOGOTA. 22 ENE 1999



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A VISTA
14 ENE 2004
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

CAVELIER**ABOGADOS**

WEB SITE: www.cavelier.com
E-MAIL: cavelier@cavelier.com

EDIFICIO SISKI
CARRERA 4 No. 72 - 35
BOGOTÁ 8, COLOMBIA

TELEFONO: (57) (1) 347-3611
TELEFAX: (57) (1) 217-9211 (57) (1) 310-4995

Señora Jefe de la
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Superintendencia de Industria y Comercio
E. S. D.

Poderdante: **MTSUI CHEMICALS, INC.**

Poder conferido el: 27-10-98

Yo, **GERMAN CAVELIER**, obrando en mi calidad de apoderado principal del poderdante arriba mencionado, atentamente manifiesto a Usted que sustituyo el poder que me ha sido conferido en la persona del doctor **EMILIO FERRERO**, Abogado con Tarjeta Profesional No. 31.929, con todas las facultades que me fueron conferidas.

Hago la anterior sustitución conforme al artículo 66 del Código de Procedimiento Civil ya que los otros sustitutos faltan en este momento.

Señora Jefe,

German Cavelier

~~GERMAN CAVELIER~~

T.P.A. No. 832

C.C. No. 2.877.924 de Bogotá

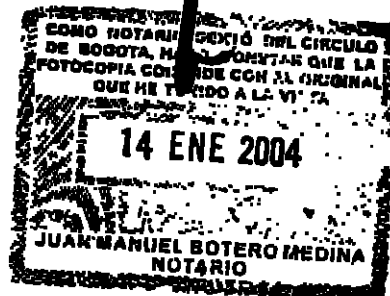
Acepto:

Emilio Ferrero

EMILIO FERRERO

T.P.A. N° 31.929

C.C. No. 438.019 de Usaquén



2e-780-2

N.º **7 A. DE BOGOTÁ**
17 OCT. 2003 PERSONAL
 Z. C. DE
 B.C. Compu.
Germin Cruz
Emilio
 quien (a): **7924** (a) C.C.
832
 y declaró (a) que aparece(n)
 en el presente documento la(s) saya (a) y
 que el contenido del mismo es cierto. En constan-
 cia se firma esta diligencia.

COMO NOTARIO DEL CÍRCULO
 DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
 FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
 QUE HA TENIDO A LA VISTA
14 FEB 2004
JUAN MANUEL BOIRAC MEDINA
 NOTARIO

Germin Cruz

Emilio

NOTARIA SEXTO
 PABLO MENDEZ
 BARAJAS
 Notario Sexto Encargado

(12) 許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2003 年 1 月 30 日 (30.01.2003)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 03/008372 A1

(51) 国際特許分類: C07C 271/20, 271/52, 269/04, 269/06, A01N 47/12, C07D 213/81, 275/03, 333/40, 213/82, 307/68, 409/12, 405/12, 333/32

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/07319

(22) 国際出願日: 2002 年 7 月 18 日 (18.07.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-218387 2001 年 7 月 18 日 (18.07.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三井化学株式会社 (MITSUI CHEMICALS, INC.) [JP/JP]; 〒100-6070 東京都千代田区霞が関三丁目 2 番 5 号 Tokyo (JP).

(73) 発明者: および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 千葉 豊 (CHIBA, Yutaka) [JP/JP]; 〒297-0017 千葉県茂原市東郷1144 三井化学株式会社内 Chiba (JP). 大岡 英則 (DAIDO, Hidemori) [JP/JP]; 〒297-0017 千葉県茂原市

東郷1144 三井化学株式会社内 Chiba (JP). 明瀬 智久 (AKASE, Tomohisa) [JP/JP]; 〒297-0017 千葉県茂原市東郷1144 三井化学株式会社内 Chiba (JP). 松野 泉 (MATSUNO, Hirozumi) [JP/JP]; 〒100-6070 東京都千代田区霞が関三丁目 2 番 5 号 三井化学株式会社内 Tokyo (JP). 貴志 淳郎 (KISHI, Junro) [JP/JP]; 〒100-6070 東京都千代田区霞が関三丁目 2 番 5 号 三井化学株式会社内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 金田 暢之, 外 (KANEDA, Nobuyuki et al.); 〒107-0052 東京都港区赤坂 1 丁目 9 番 20 号 第 16 興和ビル 8 階 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): BR, CN, CO, CR, ID, IN, KR, LK, MX, PH, US, VN.

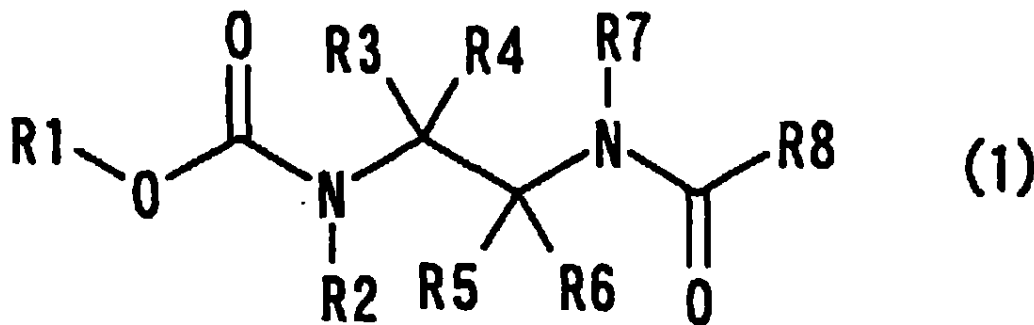
(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: DIAMINE DERIVATIVE, PROCESS FOR PRODUCING THE SAME, AND BACTERICIDE CONTAINING THE SAME AS ACTIVE INGREDIENT

(54) 発明の名称: ジアミン誘導体、その製造方法およびそれらを有効成分とする殺菌剤



(57) Abstract: A bactericide which contains as the active ingredient a diamine derivative represented by the formula (1): (1) wherein R1 to R7 each represents a specific substituent, e.g., C₁₋₄ alkyl; and R8 represents optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl. It has an excellent herbicidal activity against rice blast and causes no damage to useful crops.

[続葉有]

WO 03/008372 A1

Description

Diamine Derivatives, Process for Producing the Diamine Derivatives, and Fungicides Containing the Diamine Derivatives as an Active Ingredient

Technical Field

This invention relates to novel diamine derivatives, a process for producing the diamine derivatives, and a fungicide containing the diamine derivatives as an active ingredient.

Background Art

Pest Control plays a significant role in cultivation of paddy rice, and, in particular, various fungicides have been developed and used against rice blast, which is considered to be an important disease injury. These fungicides, however, are not always satisfactory in terms of the desired fungicidal activity and control of the undesirable harmful effects on useful crops. In addition, in recent years, fungi having drug-resistant have emerged due to the frequent use of agricultural and horticultural fungicides, and the existing fungicides do not always exhibit satisfactory fungicidal activity. Furthermore, from the environmental viewpoint, there have been demands for novel fungicides which are safe and capable of controlling harmful fungi at lower concentrations.

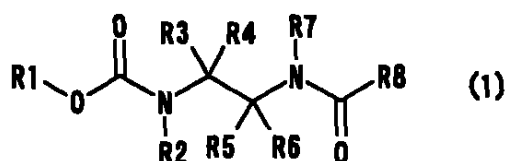
Disclosure of Invention

Accordingly, an object of this invention is to provide diamine derivatives, which exhibit excellent effect to control rice blast, but does not injure useful crops.

In order to solve the above-described problems, the present inventors synthesized various novel diamine derivatives and various investigations relating to their fungicidal activities, etc., have been carried out. They have finally found the diamine derivatives, which exhibit excellent effect to control rice blast, but not injure useful crops. As a result the present inventors have completed this invention.

Specifically, this invention include the following embodiments and aspects:

- [1] A diamine derivative, represented by the following general formula (1):



wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an

alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom;

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom, and

R8 represents an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted.

[2] The diamine derivative according to the above section [1], wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom; and

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen

atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom.

[3] The diamine derivative according to the above section [2], wherein

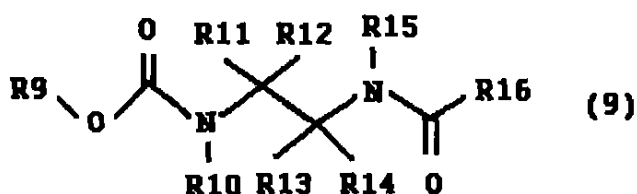
R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom; and

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom.

[4] The diamine derivative according to the above section [3], wherein R2 and R7 represent a hydrogen atom.

[5] A diamine derivative, represented by the following general formula (9):



wherein R9 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, a phenyl group, a phenyl group which is substituted at the fourth position, or a heteroaryl group which may be substituted;

R10 and R15 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

One of R11 and R12 represents a methyl group, and the other represents a hydrogen atom;

R13 and R14 represent a hydrogen atom, respectively; and

R16 represents a phenyl group, a phenyl group which is substituted at the fourth position, or a heteroaryl group which may be substituted.

[6] The diamine derivative according to the above section [5], wherein

R9 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, a phenyl group, a phenyl group which is substituted at the fourth position, or a heteroaryl group which may be substituted; and

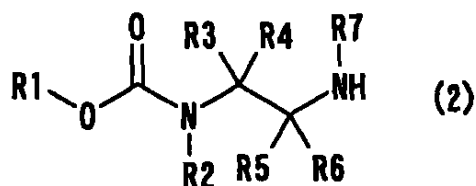
R10 and R15 represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group, independently.

[7] The diamine derivative according to the above section [6], wherein R10 and R15 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, or an acyl group.

[8] The diamine derivative according to the above section [7], wherein at R10 and R15 represent a hydrogen atom, respectively.

[9] A fungicide, wherein it contains the diamine derivative according to any one of the above sections [1] to [8] as an active ingredient.

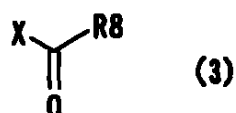
[10] A process for producing the diamine derivative according to the above section [1], wherein a compound having the following general formula (2):



wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 and R7 represent the same groups as those of the compounds according to the above section [1],

is reacted with a compound having the following general formula (3):

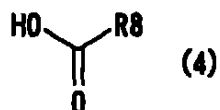


wherein

R8 represents the same group as that of the compound according to the above section [1], and

X represents a leaving group.

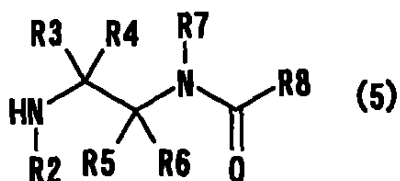
[11] A process for producing the diamine derivative according to the above section [1], wherein a compound of the general formula (2) is condensed with a compound having the following general formula (4):



wherein

R8 represents the same group as that of the compounds according to the above section [1].

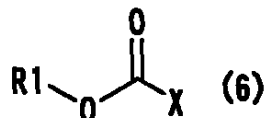
[12] A process for producing the diamine derivative according to the above section [1], wherein a compound having the following general formula (5):



wherein

R2, R3, R4, R5, R6, R7 and R8 represent the same groups as those of the compound according to the above section [1],

is reacted with a compound having the following general formula (6):

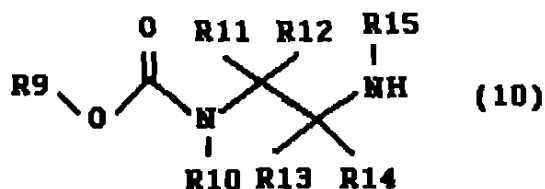


wherein

R1 represents the same group as that of the compound according to the above section [1], and

X represents a leaving group.

[13] A process for producing the diamine derivative according to the above section [5], wherein a compound having the following general formula (10):



wherein

R9, R10, R11, R12, R13, R14 and R15 represent the same groups as those of the compounds according to the above section [5],

is reacted with a compound having the following general formula (11):

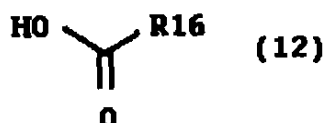


wherein

R16 represents the same group as that of the compound according to the above section [5], and

X represents a leaving group.

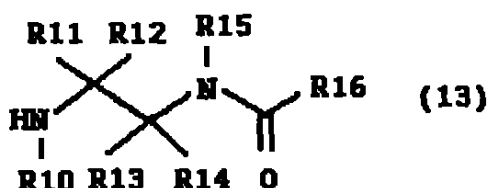
[14] A process for producing the diamine derivative according to the above section [5], wherein a compound of the general formula (10) is condensed with a compound having the following general formula (12):



wherein

R16 represents the same group as that of the compounds according to the above section [5].

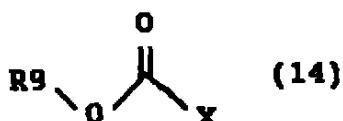
[15] A process for producing the diamine derivative according to the above section 5, wherein a compound having the following general formula (13):



wherein

R10, R11, R12, R13, R14, R15 and R16 represent the same groups as those of the compound according to the above section [5],

is reacted with a compound having the following general formula (14):



wherein

R9 represents the same group as that of the compound according to the above section [5], and

X represents a leaving group.

Best Mode for Carrying Out the Invention

The invention will be described below more in detail.

In the diamine derivatives of the general formulas (1) and (9) and the process for producing the same, examples of the alkyl group with 1 to 6 carbon atoms include methyl, ethyl, propyl, butyl, pentyl, hexyl, allyl, methallyl and propargyl groups; examples of the cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms include cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl groups; examples of the alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms include vinyl, propenyl, butenyl, pentenyl and hexenyl groups; examples of the cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms include cyclopropenyl, cyclobutenyl, cyclopentenyl and cyclohexenyl groups; examples of the alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms include ethynyl, propynyl, butynyl, pentynyl and hexynyl groups; examples of the aryl group include phenyl and naphthyl groups; examples of the heteroaryl group include pyridyl, pyrimidyl, thienyl, furanyl, pyrazolyl, imidazolyl, isothiazolyl, isoxazolyl, indolyl, quinolyl, benzofuranyl, benzothienyl, benzoxazolyl, benzoisoxazolyl, benzimidazolyl, benzothiazolyl and benzoisothiazolyl groups; examples of the acyl group include alkylcarbonyl groups such as acetyl group and arylcarbonyl groups such as benzoyl group.

Examples of the substituent(s) of the aryl group and the heteroaryl group include alkyl groups having 1 to 6 carbon atoms such as methyl, ethyl, propyl and butyl groups; cycloalkyl groups having 3 to 6 carbon atoms such as cyclopropyl, cyclobutyl, cyclopentyl and cyclohexyl groups;

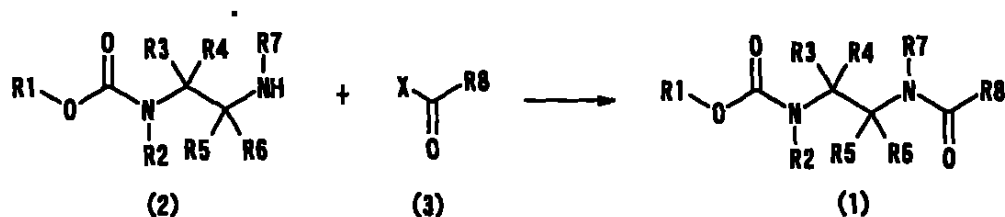
halogen-substituted alkyl groups having 1 to 4 carbon atoms such as trifluoromethyl, difluoromethyl, bromodifluoromethyl and trifluoroethyl groups; alkoxy groups having 1 to 4 carbon atoms such as methoxy, ethoxy, propoxy and butoxy groups; halogen-substituted alkoxy groups having 1 to 4 carbon atoms such as trifluoromethoxy, difluoromethoxy and trifluoroethoxy groups; alkylthio groups having 1 to 4 carbon atoms such as methylthio, ethylthio, propylthio and butylthio groups; halogen-substituted alkylthio groups having 1 to 4 carbon atoms such as trifluoromethylthio, difluoromethylthio and trifluoroethylthio groups; alkylsulfinyl groups having 1 to 4 carbon atoms such as methanesulfinyl, ethanesulfinyl, propanesulfinyl and butanesulfinyl groups; halogen-substituted alkylsulfinyl groups having 1 to 4 carbon atoms such as trifluoromethanesulfinyl, difluoromethanesulfinyl and trifluoroethanesulfinyl groups; alkyl sulfonyl groups having 1 to 4 carbon atoms such as methanesulfonyl, ethanesulfonyl, propanesulfonyl and butanesulfonyl groups; halogen-substituted alkylsulfonyl groups having 1 to 4 carbon atoms such as trifluoromethanesulfonyl, difluoromethanesulfonyl and trifluoroethanesulfonyl groups, alkylsulfonamide groups having 1 to 4 carbon atoms such as methanesulfonamide, ethanesulfonamide, propanesulfonamide and butanesulfonamide groups; halogen-substituted alkylsulfonamide groups having 1 to 4 carbon atoms such as trifluoromethanesulfonamide, difluoromethanesulfonamide and trifluoroethanesulfonamide groups; halogen atoms such as fluorine, chlorine, bromine and iodine atoms; and acyl groups such as acetyl and benzoyl groups.

The aryl group and the heteroaryl group may be substituted by two or more groups selected from them.

Examples of the methyl group, which may be substituted, include methyl, hydroxymethyl and halomethyl groups.

In the compounds of the general formulas (3), (6), (11) and (14), examples of the leaving groups include halogen atoms such as chlorine atom; alkoxy groups such as methoxy and ethoxy groups; aryloxy groups such as phenoxy group; and imidazole group.

The compounds of the invention represented by the general formulas (1) and (9) are novel. The compounds of formula (1) can be produced by the process shown by the following equation (1):



Equation (1)

wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 and R7 have the same definitions as those of the general formula (2), respectively; and

R8 and X have the same definitions as those of the general formula (3), respectively.

In the equation (1), a diamine derivative of the general formula (1) can be produced by reacting a diamine derivative of the general formula (2) or its salt with a well known carbonyl compound of the general formula (3) in a reaction containing

either no solvent or a solvent(s), and either in the absence of a base(s) or in the presence of base(s).

Examples of the base used in the reaction shown by the equation (1) include alkaline metal hydroxides such as sodium hydroxide and potassium hydroxide; alkaline earth metal hydroxides such as magnesium hydroxide and calcium hydroxide; alkaline metal hydrides such as sodium hydride and potassium hydride; alkaline metal alcoholates such as sodium methoxide and sodium ethoxide; alkaline metal oxides such as sodium oxide; carbonates such as potassium carbonate and sodium carbonate; phosphates such as tri-potassium phosphate, tri-sodium phosphate, di-potassium hydrogen phosphate, di-sodium hydrogen phosphate; acetates such as sodium acetate and potassium acetate; organic bases such as pyridine, 4-(dimethylamino)pyridine, triethylamine and 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene. At least one base can be used in the above reaction.

The quantity of the base(s) is not particularly limited, and when at least one of the above organic bases is used, it can also be used as a solvent.

Examples of the solvent which may be used in the reaction shown by the equation (1) include water; alcohols such as methanol, ethanol, propanol and butanol; halogenated hydrocarbons such as dichloromethane and chloroform; aromatic hydrocarbons such as benzene, toluene and xylene; aliphatic hydrocarbons such as hexane and heptane; polar aprotic solvents such as dimethylformamide (DMF), dimethylacetamide (DMA), dimethyl sulfoxide (DMSO), 1,3-dimethyl-2-imidazolidinone (DMI) and 1-methyl-2-pyrrolidone (NMP); ethers such as diethyl ether,

diisopropyl ether, 1,2-dimethoxyethane (DME), tetrahydrofuran (THF) and dioxane; and nitriles such as acetonitrile and propionitrile.

The chemical equivalent of the carbonyl compound of the general formula (3) to the compound of the general formula (2) is preferably 1 to 2, and more preferably 1 to 1.2.

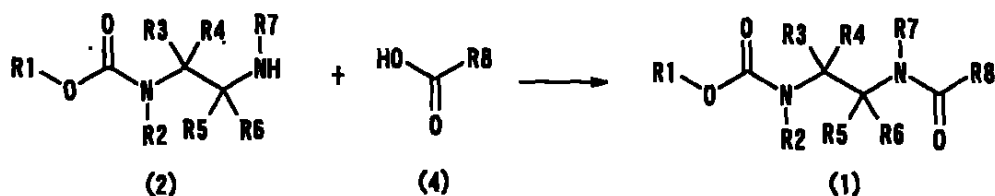
The reaction temperature and reaction time of the above reaction may be changed over a wide range. Generally, the reaction temperature may be preferably in the range from -20 to 200°C, more preferably from 0 to 100°C, and the reaction time may be preferably in the range from 0.01 to 50 hours, more preferably from 0.1 to 15 hours.

The amine derivatives and the salts thereof of the general formula (2) of the equation (1), other than commercially available ones, can be easily produced by the method such as Gabriel's synthesis; Delepine reaction; well known amine synthesis in which cyano group, amide, imine or oxime is reduced; or synthesis described in Tetrahedron Asymmetry, vol. 11, 1907 (2000).

The compounds of the general formula (3) of the equation (1) can be produced by conventional procedures in which a well known derivative of carboxylic acid of the general formula (4) is reacted with thionyl chloride, oxalyl chloride, phosgene or 1,1'-carbonylbis-1H-imidazole.

The compounds of the general formula (3) of the equation (1) can also be produced by conventional procedures in which a well known derivative of carboxylic acid of the general formula (4) is reacted with alcohol such as methyl alcohol or ethyl alcohol without a catalyst or in the presence of a catalyst.

The compounds of the invention, of the general formula (1), can also be produced by the process shown by the following equation (2).



Equation (2)

wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 and R7 have the same definitions as in the general formula (2), respectively; and

R8 has the same definition as that of the general formula (4).

In the equation (2), a diamine derivative of the general formula (1) can be produced by condensing a diamine derivative of the general formula (2) or its salt with a well known derivative of carboxylic acid of the general formula (4), in a reaction containing no solvent or a solvent(s).

Examples of the condensation agents for this case include:

N,N'-dicyclohexylcarbodiimide,
1,1'-carbonylbis-1H-imidazole,
1-ethyl-3-(3-dimethylaminopropyl)carbodiimide
hydrochloride, 2-chloro-1,3-dimethylimidazorium chloride.

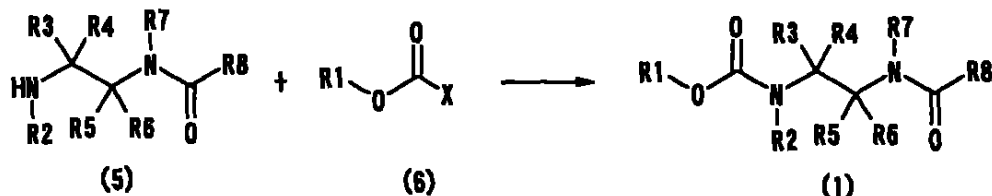
As the quantity of the condensation agent to the compound of the general formula (4), the chemical equivalent of the former to the latter is preferably 1 to 2, more preferably 1 to 1.2.

As the organic solvent(s) for this case, the same solvent(s) as those for the process shown by the equation (1) may be used.

Regarding the quantity of the derivative of carboxylic acid of the general formula (4) to the compound of the general formula (2), the chemical equivalent of the former to the latter is preferably 1 to 2, more preferably 1 to 1.2.

The reaction temperature and reaction time of the above reaction may be changed over a wide range. Generally, the reaction temperature may be preferably in the range from -20 to 200°C, more preferably from 0 to 100°C, and the reaction time may be preferably in the range from 0.01 to 50 hours, more preferably from 0.1 to 15 hours.

The compounds of the invention of the general formula (1), can also be produced by the process shown by the following equation (3):



Equation (3)

wherein

R2, R3, R4, R5, R6, R7 and R8 have the same definitions as those of the general formula (5), respectively; and

R1 and X have the same definitions as those of the general formula (6), respectively.

In the equation (3), a diamine derivative of the general formula (1) can be produced by reacting a diamine derivative of the general formula (5) or its salt with a well known compound of the general formula (6) in a reaction containing no solvent or a solvent(s), either in the absence of a base(s) or in the presence of a base(s).

In this reaction, the same base(s) as those used in the equation (1) can be used.

The quantity of the bases used is not particularly limited, and when the above organic base(s) is used, they can also be used as a solvent.

As the solvent(s) for this case, the same solvent(s) as those used in the process shown by the equation (1) can be used.

Regarding the quantity of the compounds of the general formula (6) to the diamine derivatives of the general formula (5), the chemical equivalent of the former to the latter is preferably 1 to 2, more preferably 1 to 1.2.

The reaction temperature and reaction time of the above reaction may be changed over a wide range. Generally, the reaction temperature may be preferably in the range from -20 to 200°C, more preferably from 0 to 100°C, and the reaction time may be preferably in the range from 0.01 to 50 hours, more preferably from 0.1 to 15 hours.

The compounds of formula (9) can be produced in the same manners by substituting the compounds (2) to (6) in the reaction equations (1) to (3) with the compounds (10) to (14) mentioned above.

There exist asymmetric carbon atoms in the diamine derivatives of the general formulas (1) and (9), depending

on the type of substituent(s), and the derivatives can exist as an optical isomer, diastereoisomer, racemic modification or mixture thereof at an arbitrary rate. The invention embraces all isomers of these types and the mixture thereof.

The agricultural and horticultural fungicides containing the diamine derivatives of the invention represented by the general formulas (1) and (9) as an active ingredient exhibit an excellent effect to control rice blast caused by *Piricularia oryzae*.

The diamine derivatives of the invention of the general formulas (1) and (9) can be used by combining them with at least one of other fungicides, agricultural chemicals such as insecticides, herbicides and plant growth regulators, soil conditioners, and fertilizer responsive substances. They can be applied in the form of a mixture preparation.

Although the diamine derivatives of the present invention may be used as they are, they are preferably used as a formulation in the form of a composition, which can be obtained by mixing them with a carrier including a solid or liquid diluent. The term "carrier" herein used means a synthetic or natural, inorganic or organic materials which is mixed to help the active ingredient reach the target site and make easier the storage, transportation and handling of the active ingredient compounds.

Examples of the solid carriers suitably used in the invention include clays such as montmorillonite, kaolinite and bentonite; inorganic substances such as diatomaceous earth, clay, talc, vermiculite, plaster, calcium carbonate, silica gel and ammonium sulfide; vegetable organic materials such as soybean flour, sawdust and wheat flour; and urea.

Examples of the liquid carriers suitably used in the invention include aromatic hydrocarbons such as toluene, xylene and cumene; paraffin hydrocarbons such as kerosine and mineral oil; halogenated hydrocarbons such as carbon tetrachloride, chloroform and dichloroethane; ketones such as acetone and methyl ethyl ketone; ethers such as dioxane, tetrahydrofuran and diethylene glycol dimethyl ether; alcohols such as methanol, ethanol, propanol and ethylene glycol; dimethylformamide; dimethyl sulfoxide; and water.

In order to enhance the effectiveness of the compounds of the invention, at least one of the following adjuvants can be used solely or in their combination, according to the object, while taking into account the formulation of the compounds, the site of application, etc.

When aiming at emulsification, dispersion, spreading, moistening, binding and stabilization of the compounds, an adjuvant(s) may be used for the formulation. Examples of the adjuvants include anionic surfactants such as ligninsulfonate, alkylbenzenesulfonate, alkylsulfate ester, polyoxyalkylene alkylsulfate ester and polyoxyalkylene alkylphosphate ester; nonionic surfactants such as polyoxyalkylene alkyl ether, polyoxyalkylene alkylaryl ether, polyoxyalkylene alkylamine, polyoxyalkylene alkylamide, polyoxyalkylene alkyl thioether, polyoxyalkylene fatty ester, glycerol fatty ester, sorbitan fatty ester, polyoxyalkylene sorbitan fatty ester and polyoxypropylene polyoxyethylene block copolymer; lubricants such as calcium stearate and wax; stabilizers such as isopropylhydrodiene phosphate; methyl cellulose; carboxymethyl cellulose; casein; and gum arabic.

The adjuvants used are not limited to the above described ones.

The quantity of the compounds of the invention as an active ingredient is generally 0.5 to 20% by weight for dust formulation, 5 to 50% by weight for emulsifiable concentrate, 10 to 90% by weight for wettable powder, 0.1 to 20% by weight for granular, and 10 to 90% by weight for flowable. The quantity of carrier in each formulation is generally 60 to 99% by weight for dust; 40 to 95% by weight for emulsifiable concentrate, 10 to 90% by weight for wettable powder, 80 to 99% by weight for granular, and 10 to 90% by weight for flowable, respectively. The quantity of adjuvant is generally 0.1 to 20% by weight for dust, 1 to 20% by weight for emulsifiable concentrate, 0.1 to 20% by weight for wettable powder, 0.1 to 20% by weight for granular, and 0.1 to 20% by weight for flowable.

[Examples]

In the following, the invention will be described in further detail taking several examples and test examples.

Example 1

[Preparation of N-(methoxycarbonyl)-N'-benzoyl-1-phenyl-1,2-ethylenediamine (compound no. 66)]

0.22 g of benzoyl chloride was added to 10 ml of a solution of 0.25 g of N-(methoxycarbonyl)-1-phenylethylenediamine and 0.2 g of triethylamine in dichloromethane under ice cooling, and the mixture was stirred for 30 minutes at 5°C and at room temperature for 3 hours. The reaction mixture was rinsed with water, the organic layer was dried over magnesium sulfate anhydrous, and the residual oily material obtained under a reduced pressure was purified by column chromatography on

silica gel (2:1 hexane/ethyl acetate) to obtain 0.28 g of the title compound as colorless crystals.

Example 2

[Preparation of N-(4-chlorobenzoyl)-N'-(1-propoxycarbonyl)-3-phenyl-1,2-propanediamine (compound no. 290)]

0.21 g of 1,1'-carbonylbis-1H-imidazole was added to a solution of 0.19 g of 4-chlorobenzoic acid in tetrahydrofuran and stirred for 1 hour at room temperature. Then 5 ml of a solution of 0.25 g of 2-(1-propoxycarbonylamino)-3-phenylpropylamine in tetrahydrofuran was added to the above solution and stirred at room temperature for 4 hours. The reaction mixture was rinsed with water, the organic layer was dried over magnesium sulfate anhydrous, and the residual oily material obtained under a reduced pressure was purified by column chromatography on silica gel (2:1 hexane/ethyl acetate) to obtain 0.26 g of the title compound as colorless crystals.

Example 3

[Preparation of N-(benzyloxycarbonyl)-N'-benzoyl-1-phenyl-1,2-ethylenediamine (compound no. 636)]

0.12 g of triethylamine was added to 10 ml of a solution of 0.25 g of N-benzoyl-2-phenyl-1,2-ethylenediamine hydrochloride and 0.17 g of benzyl chloroformate in dichloromethane under ice cooling, and the mixture was stirred at 5°C for 30 minutes and at room temperature for 3 hours. The reaction mixture was rinsed with water, the organic layer was dried over magnesium sulfate anhydrous, and the residual oily material obtained under a reduced pressure was purified by column chromatography on silica gel (2:1 hexane/ethyl

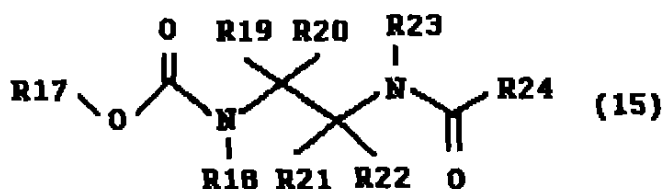
acetate) to obtain 0.28 g of the title compound as colorless crystals.

Example 4

[Preparation of N-(t-butoxycarbonyl)-N'-(4-methylbenzoyl)-1-phenyl-1,2-ethylenediamine (compound no. 504)]

0.24 g of triethylamine was added to a solution of 0.22 g of di-t-butyl dicarbonate and 0.25 g of N-(4-methylbenzoyl)-2-phenyl-1,2-ethylenediamine hydrochloride in dichloromethane under ice cooling, and the mixture was stirred at 5°C for 1 hour and at room temperature for 3 hours. The reaction mixture was rinsed with water, the organic layer was dried over magnesium sulfate anhydrous, and the residual oily material obtained under a reduced pressure was purified by column chromatography on silica gel (2:1 hexane/ethyl acetate) to obtain 0.24 g of the title compound as colorless crystals.

The compounds of the general formulas (1) and (9) which can be produced in the same manner as in Examples 1 to 4 are shown in Table 1 below. And the physical properties of some of the compounds are shown in Table 2. R17 to R24 in Table 1 are the substitutions shown in the following formula (15):



In Table 1, Me represents a methyl group, Et represents an ethyl group, n-Pr represents a normal propyl group, i-Pr represents an isopropyl group, i-Bu represents an isobutyl

group, s-Bu represents a secondary butyl group, t-Bu represents a tertiary butyl group, Ph represents a phenyl group, Bn represents a benzyl group, 1-Naph represents a 1-naphtyl group, 2-Naph represents a 2-naphtyl group, c-Pr represents a cyclopropyl group, c-Hex represents a cyclohexyl group, Ac represents an acetyl group, Bz represents a benzoyl group, vinyl represents an ethenyl group, allyl represents a 2-propenyl group, propargyl represents a 2-propynyl group, neopentyl represents a 2,2-dimethylpropyl group, methallyl represents a 2-methyl-2-propenyl group, and 2-thienyl represents a thiophene-2-yl group.

Table 1-1

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1	Me	H	Me	H	H	H	H	Ph
2	Me	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
3	Me	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
4	Me	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
5	Me	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
6	Me	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
7	Me	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
8	Me	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
9	Me	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
10	Me	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
11	Me	H	Et	H	H	H	H	Ph
12	Me	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
13	Me	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
14	Me	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
15	Me	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
16	Me	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
17	Me	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
18	Me	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
19	Me	H	Et	H	H	H	H	2-methyl pyridine-5-yl
20	Me	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
21	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
22	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
23	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
24	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
25	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
26	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
27	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
28	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
29	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
30	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
31	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
32	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
33	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
34	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	pyridine-3-yl
35	Me	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-2

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
36	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
37	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
38	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
39	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
40	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
41	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
42	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
43	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
44	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
45	Me	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
46	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
47	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
48	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
49	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
50	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
51	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
52	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph
53	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
54	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	3-methyl isothiazole-5-yl
55	Me	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
56	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
57	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
58	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
59	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
60	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
61	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
62	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
63	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
64	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
65	Me	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
66	Me	H	Ph	H	H	H	H	Ph
67	Me	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
68	Me	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
69	Me	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
70	Me	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
71	Me	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
72	Me	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
73	Me	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
74	Me	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
75	Me	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄

Table 1-3

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
76	Me	H	Bn	H	H	H	H	Ph
77	Me	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
78	Me	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
79	Me	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
80	Me	H	Bn	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
81	Me	H	-(CH ₂) ₂ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
82	Me	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
83	Et	H	Me	H	H	H	H	Ph
84	Et	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
85	Et	H	Me	H	Me	H	H	3-ClC ₆ H ₄
86	Et	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
87	Et	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
88	Et	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
89	Et	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
90	Et	H	Me	H	H	H	H	5-chloro thiophene-2-yl
91	Et	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
92	Et	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
93	Et	H	Et	H	H	H	H	Ph
94	Et	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
95	Et	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
96	Et	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
97	Et	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
98	Et	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
99	Et	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
100	Et	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
101	Et	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
102	Et	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
103	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
104	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
105	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
106	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
107	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
108	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
109	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
110	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
111	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-chloro pyridine-3-yl
112	Et	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-4

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
113	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
114	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
115	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
116	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
117	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
118	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
119	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
120	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
121	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
122	Et	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
123	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
124	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
125	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
126	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
127	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
128	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
129	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
130	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
131	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
132	Et	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
133	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
134	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
135	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
136	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
137	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
138	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
139	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
140	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
141	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
142	Et	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
143	Et	H	Ph	H	H	H	H	Ph
144	Et	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC6H4
145	Et	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC6H4
146	Et	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC6H4
147	Et	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC6H4

Table 1-5

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
148	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph
149	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
150	n-Pr	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
151	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
152	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
153	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
154	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
155	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	5-ethyl thiophene-2-yl
156	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
157	n-Pr	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
158	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	Ph
159	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	2-ClC ₆ H ₄
160	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	3-ClC ₆ H ₄
161	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	4-ClC ₆ H ₄
162	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	4-MeC ₆ H ₄
163	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
164	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	1-Naph
165	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	thiophene-2-yl
166	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	pyridine-3-yl
167	n-Pr	H	Et	Me	Et	H	H	4-ClC ₆ H ₄
168	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
168	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
169	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
170	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
171	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
172	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
173	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
174	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
175	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
176	n-Pr	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
177	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	Ph
178	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	4-ClC ₆ H ₄
179	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
180	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	2-MeC ₆ H ₄
181	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	4-MeC ₆ H ₄
182	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	4-t-BuC ₆ H ₄
183	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	1-Naph
184	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	thiophene-2-yl
185	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	isothiazole-5-yl
186	n-Pr	H	s-Bu	Me	Me	Me	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-6

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
187	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
188	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
189	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
190	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
191	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
192	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
193	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
194	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
195	n-Pr	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
196	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
197	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
198	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
199	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
200	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
201	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
202	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
203	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
204	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
205	n-Pr	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
206	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	Ph
207	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC6H4
208	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC6H4
209	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC6H4
210	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC6H4
211	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph
212	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	2-ClC6H4
213	i-Pr	H	Me	H	Me	H	H	3-ClC6H4
214	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-ClC6H4
215	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-MeC6H4
216	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
217	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
218	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
219	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
220	i-Pr	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC6H4

Table 1-7

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
221	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	Ph
222	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
223	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
224	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
225	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
226	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
227	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
228	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
229	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	2-methyl pyridine-5-yl
230	i-Pr	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
231	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
232	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
233	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
234	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
235	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
236	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
237	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
238	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
239	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
240	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
241	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
242	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
243	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
244	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	pyridine-3-yl
245	i-Pr	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
246	i-Pr	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-MeC ₆ H ₄
247	i-Pr	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-ClC ₆ H ₄
248	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
249	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
250	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
251	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
252	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
253	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
254	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
255	i-Pr	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄

Table 1-8

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
256	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
257	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
258	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
259	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
260	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
261	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
262	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph
263	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
264	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3-methyl isothiazole-5-yl
265	i-Pr	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
266	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
267	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
268	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
269	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
270	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
271	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
272	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
273	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
274	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
275	i-Pr	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
276	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	Ph
277	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
278	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
279	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
280	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
281	i-Pr	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
282	i-Pr	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
283	i-Pr	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
284	i-Pr	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
285	i-Pr	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
286	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	Ph
287	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
288	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
289	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
290	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
291	i-Pr	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
292	i-Pr	H	-(CH ₂) ₅ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-9

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
293	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	Ph
294	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
295	s-Bu	H	Me	H	Me	H	H	3-ClC ₆ H ₄
296	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
297	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
298	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
299	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
300	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	3-methyl thiophene-2-yl
301	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
302	s-Bu	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
303	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	Ph
304	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
305	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
306	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
307	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
308	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
309	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	1-Naph
310	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
311	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
312	s-Bu	Ac	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
313	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
314	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
315	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
316	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
317	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
318	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
319	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
320	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
321	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
322	s-Bu	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
323	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	Ph
324	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	4-ClC ₆ H ₄
325	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
326	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	2-MeC ₆ H ₄
327	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	4-MeC ₆ H ₄
328	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	4-t-BuC ₆ H ₄
329	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	1-Naph
330	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	thiophene-2-yl
331	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	isothiazole-5-yl
332	s-Bu	H	s-Bu	Me	H	H	Bz	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-10

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
333	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
334	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
335	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
336	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
337	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
338	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
339	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
340	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
341	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
342	s-Bu	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
343	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
344	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
345	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
346	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
347	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
348	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
349	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
350	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
351	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
352	s-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
353	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	Ph
354	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
355	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
356	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
357	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
358	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	Ph
359	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
360	i-Bu	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
361	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
362	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
363	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
364	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
365	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
366	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
367	i-Bu	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-11

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
368	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	Ph
369	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
370	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
371	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
372	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
373	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
374	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
375	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
376	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	2-methyl pyridine -5-yl
377	i-Bu	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
378	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
379	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
380	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
381	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
382	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
383	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
384	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
385	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
386	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
387	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
388	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
389	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
390	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl thiophene -2-yl
391	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	pyridine-3-yl
392	i-Bu	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
393	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
394	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
395	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
396	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
397	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
398	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
399	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
400	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
401	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
402	i-Bu	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄

Table 1-12

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
403	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
404	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
405	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
406	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
407	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
408	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
409	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph
410	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
411	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3-methyl isothiazole-5-yl
412	i-Bu	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
413	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
414	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
415	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
416	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
417	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
418	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
419	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
420	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
421	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
422	i-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
423	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	Ph
424	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
425	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
426	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
427	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
428	i-Bu	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
429	i-Bu	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
430	i-Bu	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
431	i-Bu	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
432	i-Bu	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
433	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	Ph
434	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
435	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
436	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
437	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
438	i-Bu	H	-(CH ₂) ₄ -	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
439	i-Bu	H	-(CH ₂) ₅ -	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-13

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
440	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	Ph
441	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
442	t-Bu	H	Me	H	Et	H	H	3-ClC ₆ H ₄
443	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
444	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
445	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
446	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
447	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
448	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
449	t-Bu	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
450	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	Ph
451	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
452	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
453	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
454	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
455	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
456	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	1-Naph
457	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
458	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
459	t-Bu	Me	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
460	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
461	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
462	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
463	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
464	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
465	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
466	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
467	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
468	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
469	t-Bu	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
470	t-Bu	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-MeC ₆ H ₄
471	t-Bu	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-ClC ₆ H ₄
472	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
473	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	2-MeC ₆ H ₄
474	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	4-MeC ₆ H ₄
475	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	4-t-BuC ₆ H ₄
476	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	1-Naph
478	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	thiophene-2-yl
479	t-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Et	isothiazole-5-y 1
480	t-Bu	H	s-Bu	Me	H	H	Et	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-14

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
481	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
482	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
483	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
484	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
485	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
486	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
487	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
488	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
489	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
490	t-Bu	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
491	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
492	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
493	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
494	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
495	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
496	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
497	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
498	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
499	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
500	t-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
501	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	Ph
502	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
503	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
504	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
505	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
506	Ph	H	Me	H	H	H	H	Ph
507	Ph	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
508	Ph	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
509	Ph	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
510	Ph	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
511	Ph	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
512	Ph	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
513	Ph	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
514	Ph	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
515	Ph	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-15

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
516	Ph	H	Et	H	H	H	H	Ph
517	Ph	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
518	Ph	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
519	Ph	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
520	Ph	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
521	Ph	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
522	Ph	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
523	Ph	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
524	Ph	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
525	Ph	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
526	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
527	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
528	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
529	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
530	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
531	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
532	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
533	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
534	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
535	Ph	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
536	Ph	H	allyl	H	H	H	H	Ph
537	Ph	H	allyl	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
538	Ph	H	allyl	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
539	Ph	H	allyl	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
540	Ph	H	allyl	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
541	Ph	H	allyl	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
542	Ph	H	allyl	H	H	H	H	1-Naph
543	Ph	H	allyl	H	H	H	H	thiophene-2-yl
544	Ph	H	allyl	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
545	Ph	H	allyl	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
546	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
547	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
548	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
549	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
550	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
551	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
552	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
553	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
554	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
555	Ph	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-18

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
556	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	Ph
557	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	4-ClC6H4
558	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
559	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	2-MeC6H4
560	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	4-MeC6H4
561	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
562	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	1-Naph
563	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	thiophene-2-yl
564	Ph	H	propargyl	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
565	Ph	H	propargyl	Me	H	H	H	4-MeC6H4
566	Ph	H	Ph	H	H	H	H	Ph
567	Ph	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC6H4
568	Ph	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC6H4
569	Ph	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC6H4
570	Ph	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC6H4
571	Bn	H	Me	H	H	H	H	Ph
572	Bn	H	Me	H	H	H	H	2-ClC6H4
573	Bn	H	Me	H	Me	H	H	3-ClC6H4
574	Bn	H	Me	H	H	H	H	4-ClC6H4
575	Bn	H	Me	H	H	H	H	4-MeC6H4
576	Bn	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
577	Bn	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
578	Bn	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
579	Bn	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
580	Bn	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC6H4
581	Bn	H	Et	H	H	H	H	Ph
582	Bn	H	Et	H	H	H	H	2-ClC6H4
583	Bn	H	Et	H	H	H	H	3-ClC6H4
584	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-ClC6H4
585	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-MeC6H4
586	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
587	Bn	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
588	Bn	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
589	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-methyl pyridine-5-yl
590	Bn	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC6H4
591	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
592	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC6H4
593	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC6H4
594	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
595	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC6H4

Table 1-17

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
596	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
597	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
598	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
599	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
600	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
601	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
602	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
603	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
604	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	pyridine-3-yl
605	Bn	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
606	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
607	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
608	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
609	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
610	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
611	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
612	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
613	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
614	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
615	Bn	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
616	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
617	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
618	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
619	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
620	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
621	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
622	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph
623	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
624	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	3-methyl isothiazole-5-yl
625	Bn	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
626	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
627	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
628	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
629	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
630	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
631	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
632	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
633	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
634	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
635	Bn	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-18

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
636	Bn	H	Ph	H	H	H	H	Ph
637	Bn	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
638	Bn	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
639	Bn	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
640	Bn	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
641	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
642	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
643	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
644	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
645	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
646	Bn	H	Bn	H	H	H	H	Ph
647	Bn	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
648	Bn	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
649	Bn	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
650	Bn	H	Bn	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
651	Bn	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
652	Bn	H	-(CH ₂) ₅ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
653	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	Ph
654	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	2-BrC ₆ H ₄
655	2-Naph	H	Me	Me	H	H	H	3-BrC ₆ H ₄
656	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	4-BrC ₆ H ₄
657	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
658	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
659	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
660	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
661	2-Naph	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
662	2-Naph	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
663	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	Ph
664	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	2-FC ₆ H ₄
665	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	3-FC ₆ H ₄
666	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	4-FC ₆ H ₄
667	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
668	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
669	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
670	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
671	2-Naph	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
672	2-Naph	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-19

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
673	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
674	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC6H4
675	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
676	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC6H4
677	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
678	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC6H4
679	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
680	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
681	2-Naph	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine -3-yl
682	2-Naph	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC6H4
683	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
684	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
685	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
686	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
687	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
688	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
689	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
690	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
691	2-Naph	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
692	2-Naph	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
693	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
694	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
695	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
696	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
697	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
698	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
699	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
700	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
701	2-Naph	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
702	2-Naph	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
703	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	Ph
704	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	4-ClC6H4
705	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
706	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	2-MeC6H4
707	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	4-MeC6H4
708	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
709	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	1-Naph
710	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	thiophene-2-yl
711	2-Naph	H	c-Hex	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
712	2-Naph	H	c-Hex	Me	H	H	H	4-MeC6H4

Table 1-20

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
713	2-Naph	H	Ph	H	H	H	H	Ph
714	2-Naph	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
715	2-Naph	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
716	2-Naph	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
717	2-Naph	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
718	allyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
719	allyl	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
720	allyl	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
721	allyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
722	allyl	H	Me	H	H	H	H	4-CNC ₆ H ₄
723	allyl	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
724	allyl	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
725	allyl	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
726	allyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
727	allyl	H	Me	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
728	allyl	H	Et	H	H	H	H	Ph
729	allyl	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
730	allyl	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
731	allyl	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
732	allyl	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
733	allyl	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
734	allyl	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
735	allyl	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
736	allyl	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
737	allyl	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
738	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
739	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
740	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
741	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
742	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
743	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
744	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
745	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
746	allyl	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
747	allyl	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-21

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
748	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
749	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
750	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
751	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
752	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
753	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
754	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
755	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
756	allyl	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
757	allyl	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
758	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
759	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
760	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
761	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
762	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
763	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
764	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
765	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
766	allyl	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
767	allyl	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
768	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
769	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
770	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
771	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
772	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
773	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
774	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
775	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
776	allyl	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
777	allyl	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
778	allyl	H	Ph	H	H	H	H	Ph
779	allyl	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
780	allyl	H	4-FC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
781	allyl	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
782	allyl	H	4-BrC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄

Table 1-22

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
783	propargyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
784	propargyl	H	Me	H	H	H	H	2-IC ₆ H ₄
785	propargyl	H	Me	H	Me	Me	H	3-IC ₆ H ₄
786	propargyl	H	Me	H	H	H	H	4-IC ₆ H ₄
787	propargyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
788	propargyl	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
789	propargyl	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
790	propargyl	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
791	propargyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
792	propargyl	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
793	propargyl	H	Et	H	H	H	H	Ph
794	propargyl	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
795	propargyl	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
796	propargyl	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
797	propargyl	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
798	propargyl	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
799	propargyl	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
800	propargyl	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
801	propargyl	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
802	propargyl	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
803	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
804	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
805	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
806	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
807	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
808	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
809	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
810	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
811	propargyl	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
812	propargyl	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
813	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
814	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
815	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
816	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
817	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
818	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
819	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
820	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
821	propargyl	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl

Table 1-23

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
822	propargyl	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
823	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
824	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
825	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
826	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
827	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
828	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
829	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
830	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
831	propargyl	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
832	propargyl	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
833	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
834	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
835	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
836	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
837	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
838	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
839	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
840	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
841	propargyl	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
842	propargyl	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
843	propargyl	H	Ph	H	Bn	H	H	Ph
844	propargyl	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
845	propargyl	H	4-ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
846	propargyl	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
847	propargyl	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
848	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph
849	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
850	c-Pr	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
851	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
852	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
853	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
854	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
855	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
856	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
857	c-Pr	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-24

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
858	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	Ph
859	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
860	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
861	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
862	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
863	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
864	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
865	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
866	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
867	c-Pr	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
868	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
869	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
870	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
871	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
872	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
873	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
874	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
875	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
876	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
878	c-Pr	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
879	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
880	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
881	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
882	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
883	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
884	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
885	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
886	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
887	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
888	c-Pr	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
889	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
890	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
891	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
892	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
893	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
894	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
895	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
896	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
897	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
898	c-Pr	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-25

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
899	c-Pr	H	t-Bu	H	Bn	H	H	Ph
900	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
901	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
902	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
903	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
904	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
905	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
906	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
907	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
908	c-Pr	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
909	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	Ph
910	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
911	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
912	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
913	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
914	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	Ph
915	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
916	c-Hex	H	Me	H	Et	H	H	3-ClC ₆ H ₄
917	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
918	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
919	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
920	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
921	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	5-methyl thiophene-2-yl
922	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
923	c-Hex	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
924	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	Ph
925	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
926	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
927	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
928	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
929	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
930	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
931	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
932	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
933	c-Hex	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

Table 1-28

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
934	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
935	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
936	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
937	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
938	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
939	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
940	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
941	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
942	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
943	c-Hex	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
944	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
945	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
946	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
947	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
948	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
949	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
950	c-Hex	H	s-Bu	H	Ph	H	H	1-Naph
951	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
952	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
953	c-Hex	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
954	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
955	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
956	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
957	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
958	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
959	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
960	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
961	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
962	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
963	c-Hex	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
964	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
965	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
966	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
967	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
968	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
969	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
970	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
971	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
972	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
973	c-Hex	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-27

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
974	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	Ph
975	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
976	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
977	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
978	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
979	vinyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
980	vinyl	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
981	vinyl	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
982	vinyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
983	vinyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
984	vinyl	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
985	vinyl	H	Me	H	H	H	H	1-Naph
986	vinyl	H	Me	H	H	H	H	5-ethyl thiophene-2-yl
987	vinyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
988	vinyl	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
989	vinyl	H	Et	H	H	H	H	Ph
990	vinyl	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
991	vinyl	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
992	vinyl	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
993	vinyl	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
994	vinyl	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
995	vinyl	H	Et	H	H	H	H	1-Naph
996	vinyl	H	Et	H	H	H	H	thiophene-2-yl
997	vinyl	H	Et	H	H	H	H	pyridine-3-yl
998	vinyl	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
999	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1000	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1001	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1002	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1003	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1004	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
1005	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naph
1006	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1007	vinyl	H	i-Pr	H	H	H	H	5-methyl pyridine-3-yl
1008	vinyl	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-28

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1009	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1010	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1011	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1012	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1013	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
1014	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1015	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1016	vinyl	H	s-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
1017	vinyl	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1018	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1019	vinyl	H	i-Bu	H	Ph	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1020	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1021	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1022	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
1023	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1024	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1025	vinyl	H	i-Bu	H	H	H	H	isothiazole-5-yl
1026	vinyl	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1027	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
1028	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1029	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1030	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1031	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1032	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
1033	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1034	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	Thiophene-2-yl
1035	vinyl	H	t-Bu	H	H	H	H	Isotiazole-5-yl
1036	vinyl	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1037	vinyl	H	Ph	H	H	H	H	Ph
1038	vinyl	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1039	vinyl	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1040	vinyl	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1041	vinyl	H	Ph	H	H	H	H	4-BrC ₆ H ₄
1042	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	Ph
1043	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	2-BrC ₆ H ₄
1044	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	3-BrC ₆ H ₄
1045	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-BrC ₆ H ₄
1046	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

Table 1-29

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1047	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1048	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1049	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1050	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1051	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
1052	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1053	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-FC ₆ H ₄
1054	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-FC ₆ H ₄
1055	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-FC ₆ H ₄
1056	4-MeC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1057	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	Ph
1058	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1059	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1060	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1061	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	pyridine-3-yl
1062	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1063	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1064	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1065	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1066	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1067	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1068	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1069	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-MeC ₆ H ₄
1070	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1071	4-ClC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	Me	H	H	H	1-Naph
1072	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	Ph
1073	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1074	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1075	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1076	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1077	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1078	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1079	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1080	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1081	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1082	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1083	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1084	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1085	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1086	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph

Table 1-30

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1087	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	Ph
1088	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1089	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1090	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1091	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1092	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1093	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1094	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1095	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1096	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1097	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1098	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1099	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1100	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1101	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1102	PhC(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	H	H	Ph
1103	PhC(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1104	PhC(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1105	PhC(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	H	H	furan-2-yl
1106	PhC(CH ₃) ₂	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1107	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1108	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1109	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1110	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1111	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1112	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1113	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1114	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1115	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1116	PhC(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph

Table 1-31

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1117	2-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1118	2-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1119	2-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1120	2-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1121	2-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1122	2-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1123	2-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1124	2-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1125	2-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1126	2-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1127	2-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1128	2-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1129	2-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1130	2-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1131	2-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1132	3-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1133	3-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1134	3-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1135	3-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	furan-2-yl
1136	3-furylmethyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1137	3-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1138	3-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1139	3-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1140	3-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1141	3-furylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1142	3-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1143	3-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1144	3-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1145	3-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1146	3-furylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph

Table 1-32

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1147	2-tetrahydrofuryl methyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1148	2-tetrahydrofuryl methyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1149	2-tetrahydrofuryl methyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1150	2-tetrahydrofuryl methyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1151	2-tetrahydrofuryl methyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1152	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1153	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1154	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1155	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1156	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1157	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1158	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1159	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1160	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1161	2-tetrahydrofuryl methyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph

Table 1-33

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1162	2-thienylmethyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1163	2-thienylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1164	2-thienylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1165	2-thienylmethyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1166	2-thienylmethyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1167	2-thienylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1168	2-thienylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1169	2-thienylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1170	2-thienylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1171	2-thienylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1172	2-thienylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1173	2-thienylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1174	2-thienylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1175	2-thienylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1176	2-thienylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1177	cyclopropylmethyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1178	cyclopropylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1179	cyclopropylmethyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1180	cyclopropylmethyl	H	Me	H	H	H	H	furan-2-yl
1181	cyclopropylmethyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1182	cyclopropylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1183	cyclopropylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1184	cyclopropylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1185	cyclopropylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1186	cyclopropylmethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1187	cyclopropylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1188	cyclopropylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1189	cyclopropylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1190	cyclopropylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1191	cyclopropylmethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph

Table 1-34

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1192	neopentyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1193	neopentyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1194	neopentyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1195	neopentyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1196	neopentyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1197	neopentyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1198	neopentyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1199	neopentyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1200	neopentyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1201	neopentyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1202	neopentyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1203	neopentyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1204	neopentyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1205	neopentyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1206	neopentyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1207	methallyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1208	methallyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1209	methallyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1210	methallyl	H	Me	H	H	H	H	furan-2-yl
1211	methallyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1212	methallyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1213	methallyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1214	methallyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1215	methallyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1216	methallyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1217	methallyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1218	methallyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1219	methallyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1220	methallyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1221	methallyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph

Table 1-35

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1222	1,2-dimethylpropyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1223	1,2-dimethylpropyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1224	1,2-dimethylpropyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1225	1,2-dimethylpropyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1226	1,2-dimethylpropyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1227	1,2-dimethylpropyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1228	1,2-dimethylpropyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1229	1,2-dimethylpropyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1230	1,2-dimethylpropyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1231	1,2-dimethylpropyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1232	1,2-dimethylpropyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1233	1,2-dimethylpropyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1234	1,2-dimethylpropyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1235	1,2-dimethylpropyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1236	1,2-dimethylpropyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1237	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	Ph
1238	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1239	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1240	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	furan-2-yl
1241	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1242	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1243	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1244	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1245	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1246	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1247	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1248	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1249	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1250	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1251	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph

Table 1-38

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1252	2-(methylthio)ethyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1253	2-(methylthio)ethyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1254	2-(methylthio)ethyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1255	2-(methylthio)ethyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1256	2-(methylthio)ethyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1257	2-(methylthio)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1258	2-(methylthio)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1259	2-(methylthio)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1260	2-(methylthio)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1261	2-(methylthio)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1262	2-(methylthio)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1263	2-(methylthio)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1264	2-(methylthio)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1265	2-(methylthio)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1266	2-(methylthio)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph
1267	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	Me	H	H	H	H	Pb
1268	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1269	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1270	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	Me	H	H	H	H	furan-2-yl
1271	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-4-yl
1272	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Pb
1273	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1274	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1275	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1276	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1277	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Pb
1278	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1279	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1280	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1281	2-(methanesulfonyl)ethyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naph

Table 1-37

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1282	2-thienyl	H	Me	H	H	H	H	Ph
1283	2-thienyl	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1284	2-thienyl	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1285	2-thienyl	H	Me	H	H	H	H	thiophene-2-yl
1286	2-thienyl	H	Me	H	H	H	H	pyridine-2-yl
1287	2-thienyl	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1288	2-thienyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1289	2-thienyl	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1290	2-thienyl	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1291	2-thienyl	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1292	2-thienyl	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1293	2-thienyl	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1294	2-thienyl	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1295	2-thienyl	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1296	2-thienyl	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naph

Table 2-1: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
4	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.15 (3H, d, J=6.1 Hz), 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.66 (1H, br-s), 7.41 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.74 (2H, d, J=8.1 Hz).
26	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=8.1 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.66 (1H, br-s), 7.39-7.49 (3H, m), 7.79 (2H, d, J=7.1 Hz).
30	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=8.1 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.66 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
66	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.66 (1H, br-s), 7.23-7.41 (5H, m), 7.39-7.49 (3H, m), 7.79 (2H, d, J=7.1 Hz).
215	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.14 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.24 (3H, d, J=6.8 Hz), 2.39 (3H, s), 3.46-3.53 (2H, m), 3.96-3.99 (1H, m), 4.79 (1H, br-s), 4.84-4.91 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
216	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.14 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.24 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.32 (9H, s), 3.46-3.53 (2H, m), 3.96-3.99 (1H, m), 4.79 (1H, br-s), 4.84-4.91 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
236	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.46-3.61 (2H, m), 3.66-3.74 (1H, m), 4.12 (1H, d, J=7.3 Hz), 4.73-4.89 (1H, m), 7.06 (1H, br-s), 7.40-7.50 (3H, m), 7.80 (2H, d, J=7.1 Hz).
237	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.11 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.23 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 3.50-3.54 (2H, m), 3.67-3.73 (1H, m), 4.73 (1H, d, J=8.8 Hz), 4.83-4.90 (1H, m), 7.21 (1H, br-s), 7.40 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.75 (2H, d, J=8.5 Hz).
238	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.14 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.24 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 3.50-3.53 (2H, m), 3.67-3.72 (1H, m), 4.75 (1H, d, J=8.3 Hz), 4.86-4.92 (1H, m), 7.35 (1H, br-s), 7.50 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.62 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.94 (1H, s).
239	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.17 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.21 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.83-1.88 (1H, m), 2.44 (3H, s), 3.41-3.47 (1H, m), 3.56-3.70 (2H, m), 4.77 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.82-4.88 (1H, m), 6.29 (1H, br-s), 7.16-7.35 (4H, m).

Table 2-2: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
240	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=7.3 Hz), 1.01 (3H, d, J=7.3 Hz), 1.10 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.21 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.84-1.88 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.47-3.60 (2H, m), 3.67-3.73 (1H, m), 4.75 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.83-4.89 (1H, m), 6.99 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.1 Hz).
241	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.3 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.2 Hz), 1.21-1.26 (6H, m), 1.82-1.90 (1H, m), 2.88 (2H, q, J=7.6 Hz), 3.48-3.62 (2H, m), 3.68-3.76 (1H, m), 4.74 (1H, d, J=8.8 Hz), 4.87-4.90 (1H, m), 6.99 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.72 (2H, d, J=8.5 Hz).
242	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.03 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.87-1.92 (1H, m), 3.54-3.67 (2H, m), 3.74-3.78 (1H, m), 4.77 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.88-4.92 (1H, m), 7.23 (1H, br-s), 7.51-7.59 (2H, m), 7.86-7.94 (4H, m), 8.34 (1H, s).
243	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.97-1.00 (6H, m), 1.11 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.80-1.90 (1H, m), 2.50 (3H, s), 3.44-3.57 (2H, m), 3.66-3.73 (1H, m), 4.76 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.87-4.90 (1H, m), 6.71 (1H, d, J=3.7 Hz), 6.87 (1H, br-s), 7.30 (1H, d, J=3.7 Hz).
245	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.93 (3H, d, J=7.1 Hz), 0.95 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.15 (3H, s), 1.23 (6H, d, J=6.3 Hz), 2.35-2.40 (4H, m), 3.80 (1H, dd, J=5.1 Hz, 14.2 Hz), 3.82 (1H, dd, J=5.9 Hz, 14.2 Hz), 4.72 (1H, br-s), 4.87-4.93 (1H, m), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (2H, d, J=8.1 Hz).
246	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.03 (6H, m), 1.17 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.26 (6H, d, J=6.3 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.51-3.56 (1H, m), 4.33-4.37 (1H, m), 4.56 (1H, d, J=6.0 Hz), 4.92-5.00 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.30 (1H, br-s), 7.72 (2H, d, J=8.3 Hz).
247	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99-1.03 (6H, m), 1.18 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.26 (6H, d, J=6.3 Hz), 1.82-1.87 (1H, m), 3.50-3.54 (1H, m), 4.33-4.35 (1H, m), 4.53 (1H, d, J=6.0 Hz), 4.91-4.98 (1H, m), 7.22 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.31 (1H, br-s), 7.74 (2H, d, J=8.3 Hz).
279	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.15-1.26 (6H, m), 2.40 (3H, s), 3.25-3.30 (1H, m), 3.42-3.50 (1H, m), 4.82-4.90 (1H, m), 4.92-4.98 (1H, m), 5.80 (1H, d, J=7.1 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.22-7.40 (7H, m), 7.67 (2H, d, J=7.8 Hz).
284	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.13-1.19 (6H, m), 2.40 (3H, m), 3.70-3.80 (2H, m), 4.82-4.92 (2H, m), 5.80 (1H, d, J=7.1 Hz), 6.65 (1H, br-s), 7.21-7.29 (4H, m), 7.34 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz). M ⁺ : 375.

Table 2-3: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
289	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.12 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.18 (3H, d, J=6.1 Hz), 2.38 (3H, s), 2.80-2.86 (1H, m), 2.92-2.98 (1H, m), 3.49-3.56 (2H, m), 4.07-4.15 (1H, m), 4.81-4.88 (1H, m), 4.95 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.88 (1H, br-s), 7.20-7.27 (5H, m), 7.31 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
290	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.12 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.18 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.20-1.25 (3H, m), 2.67 (2H, q, J=7.6 Hz), 2.80-2.86 (1H, m), 2.92-2.98 (1H, m), 3.49-3.56 (2H, m), 4.07-4.15 (1H, m), 4.81-4.88 (1H, m), 4.95 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.88 (1H, br-s), 7.20-7.27 (5H, m), 7.31 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
384	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.85 (3H, d, J=6.6 Hz), 0.86 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.79-1.89 (1H, m), 3.47-3.71 (3H, m), 3.80 (2H, d, J=6.8 Hz), 4.82 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.92 (br-s), 7.41 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.76 (2H, d, J=8.3 Hz).
387	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.84 (3H, d, J=6.8 Hz), 0.85 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.06 (6H, d, J=6.8 Hz), 1.63-1.89 (2H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.74 (3H, m), 3.80 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.82 (1H, d, J=8.8 Hz), 6.92 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.68 (2H, d, J=7.8 Hz).
464	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.39 (9H, s), 1.82-1.87 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.46-3.53 (2H, m), 3.65-3.69 (1H, m), 4.65 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.04 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
469	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.92 (3H, d, J=6.8 Hz), 0.94 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.13 (3H, s), 2.37-2.41 (4H, m), 3.57 (1H, dd, J=5.6 Hz, 13.7 Hz), 3.81 (1H, dd, J=5.6 Hz, 13.7 Hz), 4.82 (1H, br-s), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.77 (2H, d, J=8.1 Hz), 8.17 (1H, br-s).
470	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.03 (6H, m), 1.17 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.49 (9H, s), 1.58-1.67 (1H, m), 3.47-3.53 (1H, m), 4.33-4.35 (1H, m), 4.51 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.23 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.38 (1H, br-s), 7.73 (2H, d, J=8.3 Hz).
471	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.03 (6H, m), 1.16 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.49 (9H, s), 1.59-1.68 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.46-3.52 (1H, m), 4.33-4.35 (1H, m), 4.51 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.36 (1H, br-s), 7.72 (2H, d, J=8.3 Hz).
504	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.40 (9H, s), 2.40 (3H, s), 3.25-3.30 (1H, m), 3.42-3.50 (1H, m), 4.82-4.90 (1H, m), 5.60 (1H, d, J=7.1 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.22-7.40 (7H, m), 7.67 (2H, d, J=7.8 Hz).

Table 2-4: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
528	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.05 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.07 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.91-1.96 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.47-3.50 (1H, m), 3.74-3.78 (2H, m), 5.26 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.76 (1H, br-s), 7.15-7.31 (5H, m), 7.40-7.50 (3H, m), 7.80 (2H, d, J=7.3 Hz).
530	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.05 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.07 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.91-1.96 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.47-3.50 (1H, m), 3.74-3.78 (2H, m), 5.26 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.76 (1H, br-s), 6.95 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.15-7.31 (5H, m), 7.88 (2H, d, J=8.3 Hz).
596	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.62 (2H, m), 3.69-3.74 (1H, m), 4.94 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.06 (2H, d, J=7.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.20-7.30 (7H, m), 7.41-7.51 (3H, m), 7.79 (2H, d, J=7.1 Hz).
600	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.62 (2H, m), 3.69-3.74 (1H, m), 4.94 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.06 (2H, d, J=7.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.20-7.30 (7H, m), 7.85 (2H, d, J=8.1 Hz).
636	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 3.48-3.62 (2H, m), 3.69-3.74 (1H, m), 4.94 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.06 (2H, d, J=7.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.20-7.40 (14H, m), 7.82 (2H, d, J=7.1 Hz).
674	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.10 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.12 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.94-2.01 (1H, m), 3.50-3.55 (1H, m), 3.80-3.84 (2H, m), 5.31 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.78 (1H, br-s), 7.10 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.21 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.37 (1H, s), 7.41-7.56 (2H, m), 7.60-7.90 (5H, m).
677	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.09 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.94-1.99 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.47-3.51 (1H, m), 3.80-3.84 (2H, m), 5.30 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.77 (1H, br-s), 7.10 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.21 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.34 (1H, s), 7.41-7.54 (2H, m), 7.63-7.93 (5H, m).
739	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.3 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 3.46-3.74 (3H, m), 4.52 (2H, d, J=5.6 Hz), 4.93 (1H, d, J=8.3 Hz), 5.14 (1H, d, J=10.5 Hz), 5.25 (1H, d, J=17.1 Hz), 4.79-5.88 (1H, m), 6.88 (1H, br-s), 7.39 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.73 (2H, d, J=8.1 Hz).
742	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.3 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.74 (3H, m), 4.52 (2H, d, J=5.6 Hz), 4.93 (1H, d, J=8.3 Hz), 5.14 (1H, d, J=10.5 Hz), 5.25 (1H, d, J=17.1 Hz), 4.79-5.88 (1H, m), 6.88 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).

Table 2-5: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
804	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.8 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.36 (1H, s), 3.47-3.74 (3H, m), 4.63 (2H, s), 5.01 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.79 (1H, br-s), 7.38 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.73 (2H, d, J=8.1 Hz).
807	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.8 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.36 (1H, s), 2.39 (3H, s), 3.47-3.74 (3H, m), 4.63 (2H, s), 5.01 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.79 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1049	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.00 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 2.31 (3H, s), 3.49-3.57 (2H, m), 3.89-3.75 (1H, m), 4.92 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.00 (1H, d, J=12.2 Hz), 5.05 (1H, d, J=12.2 Hz), 7.00 (1H, br-s), 7.07 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.16 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=7.8 Hz).
1050	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.00 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 2.31 (3H, s), 2.40 (3H, s), 3.49-3.57 (2H, m), 3.89-3.75 (1H, m), 4.92 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.00 (1H, d, J=12.2 Hz), 5.05 (1H, d, J=12.2 Hz), 7.00 (1H, br-s), 7.07 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.16 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.8 Hz).
1063	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 3.43-3.47 (1H, m), 3.62-3.73 (2H, m), 4.94 (1H, d, J=12.4 Hz), 4.95 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.06 (1H, d, J=12.4 Hz), 6.73 (1H, br-s), 7.17-7.22 (6H, m), 7.59 (2H, d, J=8.1 Hz).
1066	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 2.41 (3H, s), 3.43-3.47 (1H, m), 3.62-3.73 (2H, m), 4.94 (1H, d, J=12.4 Hz), 4.95 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.06 (1H, d, J=12.4 Hz), 6.73 (1H, br-s), 7.17-7.22 (6H, m), 7.61 (2H, d, J=8.1 Hz).
1078	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95-1.02 (6H, m), 1.39 (3 x 1/2H, d, J=8.6 Hz), 1.51 (3H x 1/2, d, J=8.6 Hz), 1.80-1.88 (1H, m), 3.40-3.64 (3H, m), 4.90 (1H x 1/2, d, J=8.5 Hz), 4.96 (1H x 1/2, d, J=9.0 Hz), 5.70-5.77 (1H, m), 6.71 (1H x 1/2, br-s), 6.78 (1H x 1/2, br-s), 7.09-7.36 (6H, m), 7.45 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz), 7.69 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz).
1081	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95-1.02 (6H, m), 1.39 (3H x 1/2, d, J=8.6 Hz), 1.51 (3H x 1/2, d, J=8.6 Hz), 1.80-1.88 (1H, m), 2.37 (3H x 1/2, s), 2.40 (3H x 1/2, s), 3.40-3.64 (3H, m), 4.90 (1H x 1/2, d, J=8.5 Hz), 4.96 (1H x 1/2, d, J=9.0 Hz), 5.70-5.77 (1H, m), 6.71 (1H x 1/2, br-s), 6.78 (1H x 1/2, br-s), 7.09-7.36 (6H, m), 7.47 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz), 7.71 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz).

Table 2-6: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
1123	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.51-3.54 (2H, m), 3.72-3.76 (1H, m), 4.90 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.02 (2H, d, J=4.9 Hz), 6.29 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.31 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.85 (1H, br-s), 7.20 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.33 (1H, s), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
1126	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.51-3.54 (2H, m), 3.70-3.76 (1H, m), 4.90 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.02 (2H, d, J=4.9 Hz), 6.29 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.33 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.87 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.33 (1H, s), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1138	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 3.48-3.61 (2H, m), 3.68-3.73 (1H, m), 4.88 (1H, d, J=6.8 Hz), 4.92 (2H, s), 6.34 (1H, s), 6.80 (1H, br-s), 7.20 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.29 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.41 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.63 (2H, d, J=7.8 Hz).
1141	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.48-3.61 (2H, m), 3.68-3.73 (1H, m), 4.88 (1H, d, J=6.8 Hz), 4.92 (2H, s), 6.33 (1H, s), 6.83 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.31 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.39 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.8 Hz).
1153	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.49-1.56 (1H, m), 1.81-1.95 (4H, m), 3.51-3.54 (2H, m), 3.65-4.16 (6H, m), 4.95 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (1H, br-s), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
1156	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.49-1.56 (1H, m), 1.81-1.95 (4H, m), 2.39 (3H, s), 3.51-3.55 (2H, m), 3.67-4.16 (6H, m), 4.95 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.93 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1168	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.51-3.56 (2H, m), 3.70-3.75 (1H, m), 4.91 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.19 (1H, d, J=12.7 Hz), 5.22 (1H, d, J=12.7 Hz), 6.83 (1H, br-s), 6.91 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.01 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.21-7.25 (3H, m), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).

Table 2-7: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
1171	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.51-3.56 (2H, m), 3.70-3.75 (1H, m), 4.92 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.19 (1H, d, J=12.7 Hz), 5.22 (1H, d, J=12.7 Hz), 6.85 (1H, br-s), 6.91 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.01 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.21-7.24 (3H, m), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
1183	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.19-0.23 (2H, m), 0.45-0.50 (2H, m), 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.86-1.93 (1H, m), 3.48-3.64 (2H, m), 3.67-3.75 (1H, m), 3.85 (2H, d, J=7.3 Hz), 4.87 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.96 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.5 Hz).
1186	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.19-0.23 (2H, m), 0.45-0.49 (2H, m), 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.86-1.93 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.48-3.62 (2H, m), 3.67-3.75 (1H, m), 3.84 (2H, d, J=7.3 Hz), 4.86 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.96 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.5 Hz).
1198	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.86 (9H, s), 1.03 (6H, t, J=5.6 Hz), 1.86-1.90 (1H, m), 3.48-3.68 (2H, m), 3.70-3.75 (3H, m), 4.84 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.92 (1H, d, J=6.6 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
1201	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.86 (9H, s), 1.01 (6H, t, J=5.6 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.68 (2H, m), 3.70-3.76 (3H, m), 4.84 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (1H, d, J=6.6 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
1213	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.03 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.88 (3H, s), 1.84-1.90 (1H, m), 3.48-3.75 (3H, m), 4.45 (2H, s), 4.83 (1H, s), 4.90-4.95 (2H, m), 6.87 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1216	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.87 (3H, s), 1.84-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.75 (3H, m), 4.44 (2H, s), 4.83 (1H, s), 4.90-4.94 (2H, m), 6.87 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
1228	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.75 (3H, d, J=6.6 Hz), 0.90 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (6H + 3H x 1/2, t, J=6.6 Hz), 1.13 (3H x 1/2, d, J=6.6 Hz), 1.82-1.91 (1H, m), 3.45-3.65 (2H, m), 3.69-3.77 (1H, m), 4.58-4.61 (1H, m), 4.75 (1H, t, J=8.1 Hz), 6.94 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.20-7.24 (2H, m), 7.66 (2H, t, J=7.6 Hz).

Table 2-8: Analytical data

Comp. No.	Analytical data
1231	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.75 (3H, d, J=6.6 Hz), 0.89 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (6H + 3H x 1/2, t, J=6.6 Hz), 1.14 (3H x 1/2, d, J=6.6 Hz), 1.82-1.91 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.45-3.85 (2H, m), 3.89-3.76 (1H, m), 4.56-4.82 (1H, m), 4.75 (1H, t, J=8.1 Hz), 6.95 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.20-7.23 (2H, m), 7.68 (2H, t, J=7.6 Hz).
1258	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.6 Hz), 1.86-1.92 (1H, m), 2.05 (3H, s), 2.62 (2H, t, J=6.8 Hz), 3.47-3.73 (3H, m), 4.15-4.24 (2H, m), 4.89 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
1261	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.6 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.07 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.62 (2H, t, J=6.8 Hz), 3.47-3.72 (3H, m), 4.15-4.23 (2H, m), 4.89 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.81 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1273	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.13-3.18 (2H, m), 3.41-3.45 (1H, m), 3.66-3.70 (2H, m), 4.34-4.40 (1H, m), 4.49-4.54 (1H, m), 5.20 (1H, d, J=8.1 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.26 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.8 Hz).
1276	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 2.40 (3H, s), 2.81 (3H, s), 3.13-3.16 (2H, m), 3.41-3.45 (1H, m), 3.66-3.70 (2H, m), 4.34-4.40 (1H, m), 4.49-4.55 (1H, m), 5.19 (1H, d, J=8.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.24 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.66 (2H, d, J=7.8 Hz).

Examples of Formulations and Tests

The examples of the formulations and the activity tests of the fungicides according to the invention will be shown below. In the following examples, the term "part" hereinafter used means "part by weight" or "% by weight".

Example of Formulation 1 Granules

Thirty parts of the compound of the invention (30), 22 parts of bentonite, 45 parts of talc, 3 parts of Sorpol 5060 (surfactant: Toho Chemical Industry Co., Ltd., brand name) and a small quantity of antifoamer were kneaded uniformly, granulated with a basket granulating machine, and dried to obtain 100 parts of granules.

Example of Formulation 2 Granules

Fifteen parts of the compound of the invention (241), 60 parts of bentonite, 21 parts of talc, 1 part of sodium dodecylbenzenesulfonate, 1 part of polyoxyethylenealkyl allyl ether and 2 parts of sodium ligninsulfonate were mixed, kneaded uniformly with the addition of a suitable quantity of water, granulated with a basket granulating machine, and dried to obtain 100 parts of granules.

Example of Formulation 3: Wettable powder

Fifty parts of the compound of the invention (290), 40 parts of calcium carbonate, 5 parts of Sorpol 5039 (a mixture of anionic surfactant and white carbon: Toho Chemical Industry Co., Ltd., brand name) and 5 parts of white carbon were mixed and milled uniformly to obtain a wettable powder.

Example of Formulation 4 Wettable powder

Thirty parts of the compound of the invention (526), 63 parts of kaolinite, 5 parts of Sorpol 5039 (a mixture of anionic surfactant and white carbon: Toho Chemical Industry

Co., Ltd., brand name) and 2 parts of white carbon were mixed and milled uniformly to obtain wettable powder.

Example of Formulation 5 Emulsion

Twenty parts of the compound of the invention (674), 55 parts of xylene, 20 parts of N,N-dimethylformamide and 5 parts of Sorpol 2680 (surfactant) were mixed uniformly to obtain an emulsion concentrate.

Example of Formulation 6 Flowable

Of all the ingredients of 40 parts of the compound of the invention (742), 5 parts of Sorpol 3353 (a nonionic surfactant: Toho Chemical Industry Co., Ltd., brand name), 5 parts of 1% aqueous solution of xanthan gum, 40 parts of water and 10 parts of ethylene glycol, those except the active ingredient were dissolved uniformly, and then the compound of the invention was added. After fully stirred, the mixture was wet milled with a sand mill to obtain a flowable.

Example of Formulation 7 Powder

Five parts of the compound of the invention (807) and 95 parts of clay were admixed to obtain powder.

Test Example 1: Test of rice blast controlling effect (spray application test)

A diluted solution of a wettable powder prepared at 500 ppm in accordance with formulation Example 4 was applied to a rice pot (variety: Koshihikari; 2-leaf stage) and air-dried. The plant was put into an artificial weather room (set conditions: 22°C, 12-hour dark light cycle) and spray-inoculated with a suspension of *Pyricularia oryzae* spores. The artificial weather room was kept at high humidity, and the plant was examined after 7 days. The preventive value was calculated by the following equation and the controlling

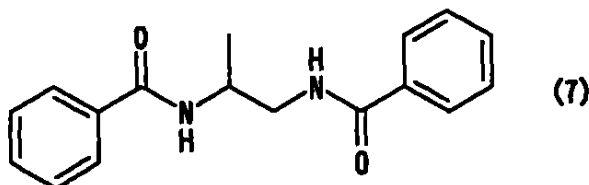
effect was evaluated based on the criteria shown in the following table. The results are shown in Table 3.

Preventive value (%) = (1 - the number of lesions in treated plot/the number of lesions in untreated plot) × 100

Effect	Preventive value
A	100%
B	80% or more and less than 100%
C	50% or more and less than 80%
D	less than 50%

As a control, the following chemicals were used.

General formulation (7):



General formulation (8):

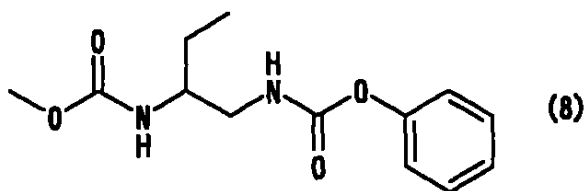


Table 3-1: Rice blast controlling effect test (Spray Application Test)

Comp. No.	Grade of Effect
4	A
26	A
30	A
66	A
215	A
216	A
236	A
237	A
238	A
239	A
240	A
241	A
242	A
243	A
245	A
246	A
247	A
279	A
284	A
289	A
290	A
384	A
387	A
464	B
469	B
470	A
471	A
504	B
526	A
530	A
596	A
600	A
636	A
674	A
677	A
739	A
742	A
804	A
807	A
1049	A
1050	A
1063	A
1066	A

Table 3-2: Rice blast controlling effect test (Spray Application Test)

Comp. No.	Grade of Effect
1078	A
1081	A
1123	A
1126	A
1138	A
1141	A
1153	A
1156	A
1168	A
1171	A
1183	A
1186	A
1198	A
1201	A
1213	A
1216	A
1228	A
1231	A
1258	A
1261	A
1273	A
1276	A
Formula (7)	D
Formula (8)	D

**Test Example 2: Test of rice blast controlling effect
(Water surface application)**

Rice seedlings (variety: Koshihikari; 3-leaf stage) were planted in 1/5000 are Wagner pots and grown for one week in a green house. Granules prepared in accordance with Formulation Example 2 were applied to water surface in each pot at a rate of 3kg/10ares. After 30 days from the application, a liquid suspension of *Pyricularia oryzae* spores was directly sprayed to the rice plants. The rice plants were placed under the conditions of 25°C and high humidity for 1 week, and the number of lesions was checked. The preventive value was calculated by the following equation and the controlling effect was evaluated based on the following standard. The results are shown in Table 4. As a control, the same chemical as in Test Example 1 was used.

Preventive value (%) = (1 - the number of lesions in treated plot/the number of lesions in untreated plot) × 100

Effect	Preventive value
A	From 80% to 100%
B	50% or more and less than 80%
C	less than 50%

Table 4-1: Rice blast controlling effect test (Water surface application)

Comp. No.	Grade of Effect
4	A
26	A
30	A
66	A
215	A
216	A
236	A
237	A
238	A
239	A
240	A
241	A
242	A
243	A
245	A
246	A
247	A
279	A
284	A
289	A
290	A
384	A
387	A
464	B
469	B
470	A
471	A
504	B
526	A
530	A
596	A
600	A
636	A
674	A
677	A
739	A
742	A
804	A
807	A
1049	A
1050	A
1063	A
1066	A

Table 4-2: Rice blast controlling effect test (Water surface application)

Comp. No.	Grade of Effect
1078	A
1081	A
1123	A
1126	A
1138	A
1141	A
1153	A
1156	A
1168	A
1171	A
1183	A
1186	A
1198	A
1201	A
1213	A
1216	A
1228	A
1231	A
1258	A
1261	A
1273	A
1276	A
Formula (7)	C
Formula (8)	C

**Test Example 3: Test of rice blast controlling effect
(nursery box treatment)**

Rice seedlings (variety: Koshihikari; 2-leaf stage) raised in a nursery box for rice (30 cm x 60 cm x 3 cm) were treated with granules prepared in accordance with Formulation Example 1 in a quantity of 50 g per box. After 3 days, the rice seedlings were transplanted into a 1/5000 are Wagner in area and raised in a greenhouse. Thirty days after the transplantation, the plant was spray-inoculated with a suspension of *Pyricularia oryzae* spores, allowed to keep under the conditions of 25°C and high humidity for 1 week, and the number of lesions was counted. The preventive value was calculated by the following equation and the controlling effect was evaluated based on the same criteria as in Test Example 2. The results are shown in Table 5. As a control, the same chemical as in Test Example 1 was used.

Preventive value (%) = (1 - the number of lesions in treated plot/the number of lesions in untreated plot) x 100

Table 5-1: Test of rice blast controlling effect (Nursery box treatment)

Comp. No.	Grade of Effect
4	A
26	A
30	A
66	A
215	A
216	A
236	A
237	A
238	A
239	A
240	A
241	A
242	A
243	A
245	A
246	A
247	A
279	A
284	A
289	A
290	A
384	A
387	A
464	B
469	B
470	A
471	A
504	B
526	A
530	A
596	A
600	A
636	A
674	A
677	A
739	A
742	A
804	A
807	A
1049	A
1050	A
1063	A
1066	A

Table 5-2: Test of rice blast controlling effect (Nursery box treatment)

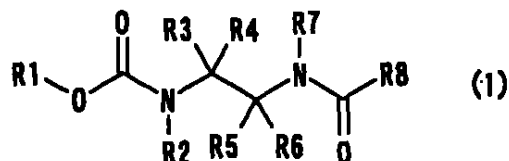
Comp. No.	Grade of Effect
1078	A
1081	A
1123	A
1126	A
1138	A
1141	A
1153	A
1156	A
1168	A
1171	A
1183	A
1186	A
1198	A
1201	A
1213	A
1216	A
1228	A
1231	A
1258	A
1261	A
1273	A
1276	A
Formula (7)	C
Formula (8)	C

Industrial Applicability

The diamine derivative according to this invention exhibit an excellent rice blast controlling effect, but, on the other hand, does not injure useful crops; therefore, it is very useful as an agricultural and horticultural fungicide.

Claims

1. A diamine derivative, represented by the following general formula (1):



wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be

substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom;

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom, and

R8 represents an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted.

2. The diamine derivative according to claim 1, wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with

3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom; and

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom.

3. The diamine derivative according to claim 2, wherein

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, or an acyl group;

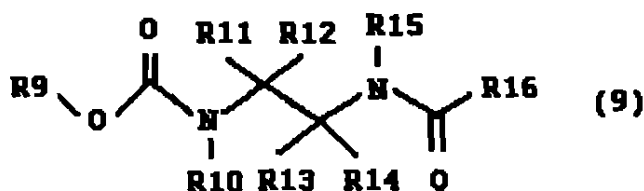
R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group

with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom;
and

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom.

4. The diamine derivative according to claim 3, wherein R2 and R7 represent a hydrogen atom.

5. A diamine derivative, represented by the following general formula (9):



wherein R9 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, a phenyl group, a phenyl group which is substituted at the fourth position, or a heteroaryl group which may be substituted;

R10 and R15 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group

with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

One of R11 and R12 represents a methyl group, and the other represents a hydrogen atom;

R13 and R14 represent a hydrogen atom, respectively; and

R16 represents a phenyl group, a phenyl group which is substituted at the fourth position, or a heteroaryl group which may be substituted.

6. The diamine derivative according to claim 5, wherein

R9 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, a phenyl group, a phenyl group which is substituted at the fourth position, or a heteroaryl group which may be substituted; and

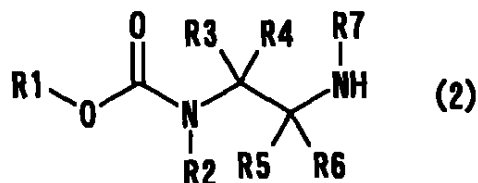
R10 and R15 represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group, independently.

7. The diamine derivative according to claim 6, wherein R10 and R15 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, or an acyl group.

8. The diamine derivative according to claim 7, wherein at R10 and R15 represent a hydrogen atom, respectively.

9. A fungicide, wherein it contains the diamine derivative according to any one of claims 1 to 8 as an active ingredient.

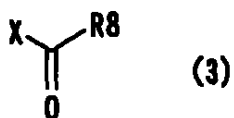
10. A process for producing the diamine derivative according to claim 1, wherein a compound having the following general formula (2):



wherein

R1, R2, R3, R4, R5, R6 and R7 represent the same groups as those of the compounds according to claim 1,

is reacted with a compound having the following general formula (3):

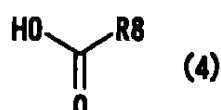


wherein

R8 represents the same group as that of the compound according to claim 1, and

X represents a leaving group.

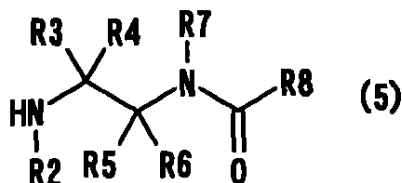
11. A process for producing the diamine derivative according to claim 1, wherein a compound of the general formula (2) is condensed with a compound having the following general formula (4):



wherein

R8 represents the same group as that of the compounds according to claim 1.

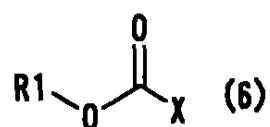
12. A process for producing the diamine derivative according to claim 1, wherein a compound having the following general formula (5):



wherein

R2, R3, R4, R5, R6, R7 and R8 represent the same groups as those of the compound according to claim 1,

is reacted with a compound having the following general formula (6):

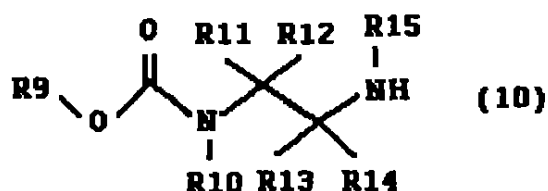


wherein

R1 represents the same group as that of the compound according to claim 1, and

X represents a leaving group.

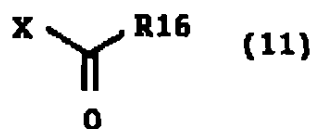
13. A process for producing the diamine derivative according to claim 5, wherein a compound having the following general formula (10):



wherein

R9, R10, R11, R12, R13, R14 and R15 represent the same groups as those of the compounds according to claim 5,

is reacted with a compound having the following general formula (11):

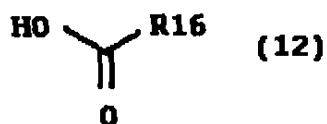


wherein

R16 represents the same group as that of the compound according to claim 5, and

X represents a leaving group.

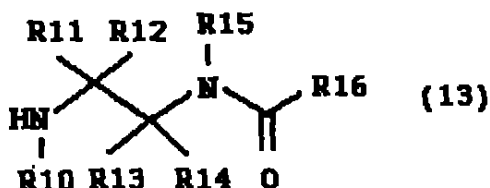
14. A process for producing the diamine derivative according to claim 5, wherein a compound of the general formula (10) is condensed with a compound having the following general formula (12):



wherein

R16 represents the same group as that of the compounds according to claim 5.

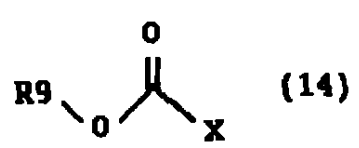
15. A process for producing the diamine derivative according to claim 5, wherein a compound having the following general formula (13):



wherein

R10, R11, R12, R13, R14, R15 and R16 represent the same groups as those of the compound according to claim 5,

is reacted with a compound having the following general formula (14):



wherein

R9 represents the same group as that of the compound according to claim 5, and

X represents a leaving group.



107

1/5

特許協力条約に基づく国際出願

原本(出願用) - 印刷日時 2002年07月18日 (18.07.2002) 木曜日 15時13分44秒

MCI02P118A

0	受理官庁記入欄	
0-1	国際出願番号.	
0-2	国際出願日	PCT 18.7.02
0-3	(受付印)	受領印
0-4	様式-PCT/RO/101 この特許協力条約に基づく国際出願審査は、 0-4-1 右記によって作成された。	PCT-EASY Version 2.92 (updated 01.06.2002)
0-5	甲立て 出願人は、この国際出願が特許協力条約に従って処理されることを請求する。	
0-6	出願人によって指定された受理官庁	日本国特許庁 (RO/JP)
0-7	出願人又は代理人の書類記号	MCI02P118A
I	発明の名称	ジアミン誘導体、その製造方法およびそれらを含む有効成分とする殺菌剤
II	出願人	
II-1	この欄に記載した者は	出願人である (applicant only)
II-2	右の指定国についての出願人である。	米国を除くすべての指定国 (all designated States except US)
II-4ja	名称	三井化学株式会社
II-4en	Name	MITSUI CHEMICALS, INC.
II-5ja	あて名:	100-6070 日本国 東京都 千代田区 蔵が関三丁目2番5号
II-5en	Address:	2-5, Kasumigasaki 3-chome Chiyoda-ku, Tokyo 100-6070 Japan
II-6	国籍 (国名)	日本国 JP
II-7	住所 (国名)	日本国 JP
III-1	その他の出願人又は発明者	
III-1-1	この欄に記載した者は	出願人及び発明者である (applicant and inventor)
III-1-2	右の指定国についての出願人である。	米国のみ (US only)
III-1-4j	氏名 (姓名)	千葉 豊
III-1-4e	Name (LAST, First)	CHIBA, Yutaka
III-1-5j	あて名:	297-0017 日本国 千葉県 茂原市 東郷1144 三井化学株式会社内
III-1-5e	Address:	o/o Mitsui Chemicals, Inc. 1144, Togo Mobara-shi, Chiba 297-0017 Japan
III-1-6	国籍 (国名)	日本国 JP
III-1-7	住所 (国名)	日本国 JP

III-2	その他の出願人又は発明者	
III-2-1	この欄に記載した者は	出願人及び発明者である (applicant and inventor)
III-2-2	右の指定国についての出願人である。	米国のみ (US only)
III-2-4J	氏名 (姓名)	大同 英則
III-2-4a	Name (LAST, First)	DAIDO, Hidenori
III-2-5J	あて名:	297-0017 日本国 千葉県 茂原市 東郷1144 三井化学株式会社内
III-2-5a	Address:	c/o Mitsui Chemicals, Inc. 1144, Togo Mobara-shi, Chiba 297-0017 Japan
III-2-6	国籍 (国名)	日本国 JP
III-2-7	住所 (国名)	日本国 JP
III-3	その他の出願人又は発明者	
III-3-1	この欄に記載した者は	出願人及び発明者である (applicant and inventor)
III-3-2	右の指定国についての出願人である。	米国のみ (US only)
III-3-4J	氏名 (姓名)	明瀬 智久
III-3-4a	Name (LAST, First)	AKASE, Tomohisa
III-3-5J	あて名:	297-0017 日本国 千葉県 茂原市 東郷1144 三井化学株式会社内
III-3-5a	Address:	c/o Mitsui Chemicals, Inc. 1144, Togo Mobara-shi, Chiba 297-0017 Japan
III-3-6	国籍 (国名)	日本国 JP
III-3-7	住所 (国名)	日本国 JP
III-4	その他の出願人又は発明者	
III-4-1	この欄に記載した者は	出願人及び発明者である (applicant and inventor)
III-4-2	右の指定国についての出願人である。	米国のみ (US only)
III-4-4J	氏名 (姓名)	松野 裕泉
III-4-4a	Name (LAST, First)	MATSUNO, Hirozumi
III-4-5J	あて名:	100-6070 日本国 東京都 千代田区 霞が関三丁目2番5号 三井化学株式会社内
III-4-5a	Address:	c/o Mitsui Chemicals, Inc. 2-5, Kasumigaseki 3-chome Chiyoda-ku, Tokyo 100-6070 Japan
III-4-6	国籍 (国名)	日本国 JP
III-4-7	住所 (国名)	日本国 JP

III-5 III-5-1	その他の出願人又は発明者 この欄に記載した者は	出願人及び発明者である (applicant and inventor)
III-5-2	右の指定国についての出願人である。	米国のみ (US only)
III-5-4j III-5-4e III-5-5j	氏名(姓名) Name (LAST, First) あて名:	貴志 淳郎 KISHI, Junro 100-6070 日本国 東京都 千代田区 霞が関三丁目2番5号 三井化学株式会社内
III-5-8e	Address:	c/o Mitsui Chemicals, Inc. 2-5, Kasumigasaki 3-chome Chiyoda-ku, Tokyo 100-6070 Japan
III-5-6	国籍(国名)	日本国 JP
III-5-7	住所(国名)	日本国 JP
IV-1	代理人又は共通の代表者、通知のあて名 下記の者は国際機関において右記のごとく出願人のために行動する。	代理人 (agent)
IV-1-1ja IV-1-1ea IV-1-2ja	氏名(姓名) Name (LAST, First) あて名:	金田 暢之 KANEDA, Nobuyuki 107-0052 日本国 東京都 港区 赤坂1丁目9番20号 第16興和ビル8階
IV-1-2ea	Address:	8th Floor, 16th Kowa Bldg. 9-20, Akasaka 1-chome Minato-ku, Tokyo 107-0052 Japan
IV-1-3	電話番号	03-3585-1878
IV-1-4	ファクシミリ番号	03-3587-2388
IV-1-5	電子メール	waka@patent.wpa.co.jp
IV-2	その他の代理人	筆頭代理人と同じあて名を有する代理人 (additional agent(s) with same address as first named agent)
IV-2-1ja IV-2-1ea	氏名 Name(s)	伊藤 克博: 石橋 政幸 ITO, Katsuhiko: ISHIBASHI, Masayuki
V	国の指定	
V-1	広域特許 (他の種類の保護又は取扱いを求める場合には括弧内に記載する。)	EP: AT BE BG CH< CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR IE IT LU MC NL PT SE SK TR 及びヨーロッパ特許条約と特許協力条約の締結国である他の国
V-2	国内特許 (他の種類の保護又は取扱いを求める場合には括弧内に記載する。)	BR CN CO CR ID IN KR LK MX PH US VN

V-1	指定の確認の宣言 出願人は、上記の指定に加えて、規則4.9(b)の規定に基づき、特許協力条約のもとで認められる他の全ての国の指定を行う。ただし、V-6欄に示した国の指定を除く。出願人は、これらの追加される指定が確認を条件としていること、並びに優先日から15月が経過する前にその確認がなされない指定は、この期間の経過時に、出願人によって取り下げられたものとみなされることを宣言する。		
V-6	指定の確認から除かれる国	なし (NONE)	
VI-1	先の国内出願に基づく優先権主張		
VI-1-1	出願日	2001年07月18日 (18. 07. 2001)	
VI-1-2	出願番号	特願2001-218387	
VI-1-3	国名	日本国 JP	
VII-1	特定された国際調査機関 (ISA)	日本国特許庁 (ISA/JP)	
VIII	申立て	申立て数	
VIII-1	発明者の特定に関する申立て	-	
VIII-2	出願し及び特許を与えられる国際出願目における出願人の資格に関する申立て	-	
VIII-3	先の出願の優先権を主張する国際出願目における出願人の資格に関する申立て	-	
VIII-4	発明者である旨の申立て (米国を指定国とする場合)	-	
VIII-5	不利にならない開示又は新規性喪失の例外に関する申立て	-	
IX	照合欄	用紙の枚数	添付された電子データ
IX-1	願書 (申立てを含む)	5	-
IX-2	明細書	73	-
IX-3	請求の範囲	7	-
IX-4	要約	1	EZABST00.TXT
IX-5	図面	0	-
IX-7	合計	86	
	添付書類	添付	添付された電子データ
IX-8	手数料計算用紙	✓	-
IX-9	個別の委任状の原本	✓	-
IX-13	優先権証明書	優先権証明書 VI-1	-
IX-17	PCT-EASYディスク	-	フロッピーディスク
IX-18	その他	納付する手数料に相当する特許印紙を貼付した書面	-
IX-19	要約書とともに提示する国の番号		
IX-20	国際出願の使用言語名:	日本語	
I-1	提出者の記名押印		
I-1-1	氏名 (姓名)	金田 暢之	

特許協力条約に基づく国際出願

MC102P118A

原本（出願用） - 印刷日時 2002年07月16日（18.07.2002）木曜日 15時13分44秒

I-2	提出者の記名押印	
I-2-1	氏名(姓名)	伊藤 克博
I-3	提出者の記名押印	
I-3-1	氏名(姓名)	石橋 政幸

受理官庁記入欄

10-1	国際出願として提出された書類の実際の受理の日	
10-2	図面：	
10-2-1	受理された	
10-2-2	不足図面がある	
10-3	国際出願として提出された書類を補充する書類又は図面であってその後期間内に提出されたものの実際の受理の日（訂正日）	
10-4	特許協力条約第11条(2)に基づく必要な補充の期間内の受理の日	
10-5	出願人により特定された国際調査機関	ISA/JP
10-6	調査手数料未払いにつき、国際調査機関に調査用写しを送付していない	

国際事務局記入欄

11-1	記録原本の受理の日	
------	-----------	--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/07319

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07C271/20, 271/52, 269/04, 269/06, A01N47/12, C07D213/81, 275/03, 333/40, 213/82, 307/68, C07D409/12, 405/12, 333/32

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07C271/20, 271/52, 269/04, 269/06, A01N47/12, C07D213/81, 275/03, 333/40, 213/82, 307/68, C07D409/12, 405/12, 333/32

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)
STN (CA, REGISTRY)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X, P	WO 02/40483 A1 (Sankyo Co., Ltd.), 23 May, 2002 (23.05.02), Referential Example 61 & JP 2002-212182 A	1-4
X	GRAHAM M. KYNE, MARK E. LIGHT, MIKE B. HURSTHOUSE, JAVIER DE MENDOZA JEREMY D. KILBURN, "Enantioselective amino acid recognition using acyclic thiourea receptors", Journal of the Chemical Society, Perkin Transactions 1, 2001, No.11, pages 1258 to 1263	1-4
X	WO 01/46124 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.), 28 June, 2001 (28.06.01), Tables 1, 2 & JP 2001-240580A & EP 1241159 A1	1-8

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not
considered to be of particular relevance
"E" earlier document but published on or after the international filing
date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is
cited to establish the publication date of another citation or other
special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other
means
"P" document published prior to the international filing date but later
than the priority date claimed

"I" later document published after the international filing date or
priority date and not in conflict with the application but cited to
understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered novel or cannot be considered to involve an inventive
step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be
considered to involve an inventive step when the document is
combined with one or more other such documents, such
combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
08 October, 2002 (08.10.02)

Date of mailing of the international search report
29 October, 2002 (29.10.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/07319

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of Item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☒ Claims Nos.: 1-7 and 9-15
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
Claims 1-7 and 9-15 involve compounds which are inadequately supported by the description. Consequently, a relevant prior art (especially one relating to inventiveness) cannot be specified.
(to be continued on the last page)
3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of Item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

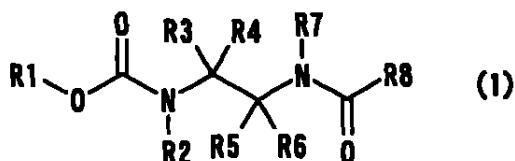
Disclosure of Invention

Accordingly, an object of this invention is to provide diamine derivatives, which exhibit excellent effect to control rice blast, but does not injure useful crops.

In order to solve the above-described problems, the present inventors synthesized various novel diamine derivatives and various investigations relating to their fungicidal activities, etc., have been carried out. They have finally found the diamine derivatives, which exhibit excellent effect to control rice blast, but not injure useful crops. As a result the present inventors have completed this invention.

Specifically, this invention include the following embodiments and aspects:

[1] A diamine derivative, represented by the following general formula (1):



wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms [provided that the case is excluded where R1 is a tert-butyl], a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom;

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom, and

R8 represents an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted.

[2] The diamine derivative according to the above section [1], wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms [provided that the case is excluded where R1 is a tert-butyl], a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

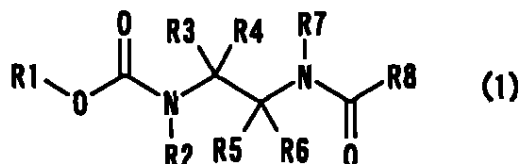
R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom; and

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen

117

Claims

1.(Amended) A diamine derivative, represented by the following general formula (1):



wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms [provided that the case is excluded where R1 is a tert-butyl], a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or an acyl group;

R3 and R4 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be

substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted, or a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms including an attached carbon atom;

R5 and R6 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, a cycloalkenyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkynyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, or an aryl group which may be substituted; provided that the case is excluded where R3, R4, R5 and R6 all represent a hydrogen atom or where any one of R3, R4, R5 and R6 represents a methyl group which may be substituted and the others represent a hydrogen atom, and

R8 represents an aryl group which may be substituted or a heteroaryl group which may be substituted.

2. (Amended) The diamine derivative according to claim 1, wherein

R1 represents an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms [provided that the case is excluded where R1 is a tert-butyl], a cycloalkyl group with 3 to 6 carbon atoms, an alkenyl group with 2 to 6 carbon atoms, an arylalkyl group which may be substituted, a heteroarylalkyl group which may be substituted, an aryl group which may be substituted, or a heteroaryl group which may be substituted;

R2 and R7 independently represent a hydrogen atom, an alkyl group with 1 to 6 carbon atoms, a cycloalkyl group with

PATENT COOPERATION TREATY

119

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

KANEDA, Nobuyuki
8th Floor, 16th Kowa Bldg
9-20, Akasaka 1-chome
Minato-ku, Tokyo 107-0052
Japan

Date of mailing (day/month/year) 12 September 2002 (12.09.02)	
Applicant's or agent's file reference MCI02P118A	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/JP02/07319	International filing date (day/month/year) 18 July 2002 (18.07.02)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 18 July 2001 (18.07.01)
Applicant MITSUI CHEMICALS, INC. et al	

1. The applicant is hereby notified of the date of receipt (except where the letters "NR" appear in the right-hand column) by the International Bureau of the priority document(s) relating to the earlier application(s) indicated below. Unless otherwise indicated by an asterisk appearing next to a date of receipt, or by the letters "NR", in the right-hand column, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
2. This updates and replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents.
3. An asterisk(*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b). In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
4. The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which was not received by the International Bureau or which the applicant did not request the receiving Office to prepare and transmit to the International Bureau, as provided by Rule 17.1(a) or (b), respectively. In such a case, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
18 July 2001 (18.07.01)	2001-218387	JP	09 Augu 2002 (09.08.02)

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland Facsimile No. (41-22) 740.14.35	Authorized officer Akiko KOYAMA Telephone No. (41-22) 338.83.38
--	---

Form PCT/IB/304 (July 1998)

006102837

From the INTERNATIONAL BUREAU

120

PCT**NOTICE INFORMING THE APPLICANT OF THE
COMMUNICATION OF THE INTERNATIONAL
APPLICATION TO THE DESIGNATED OFFICES**

(PCT Rule 47.1(c), first sentence)

To:

KANEDA, Nobuyuki
8th Floor, 18th Kowa Bldg.
9-20, Akasaka 1-chome
Minato-ku, Tokyo 107-0052
JAPON



Date of mailing(day/month/year) 30 January 2003 (30.01.03)		
Applicant's or agent's file reference MCI02P118A		IMPORTANT NOTICE
International application No. PCT/JP02/007319	International filing date(day/month/year) 18 July 2002 (18.07.02)	
		Priority date(day/month/year) 18 July 2001 (18.07.01)
Applicant MITSUI CHEMICALS, INC., et al		

1. Notice is hereby given that the International Bureau has communicated, as provided in Article 20, the international application to the following designated Offices on the date indicated above as the date of mailing of this notice:

KR, US

In accordance with Rule 47.1(c), third sentence, those Offices will accept the present notice as conclusive evidence that the communication of the international application has duly taken place on the date of mailing indicated above and no copy of the international application is required to be furnished by the applicant to the designated Office(s).

2. The following designated Offices have waived the requirement for such a communication at this time:

BR, CN, CO, CR, EP, ID, IN, LK, MX, PH, VN

The communication will be made to those Offices only upon their request. Furthermore, those Offices do not require the applicant to furnish a copy of the international application (Rule 49.1(a-bis)).

3. Enclosed with this notice is a copy of the international application as published by the International Bureau on 30 January 2003 (30.01.03) under No. WO 03/008372.

4. **TIME LIMITS** for filing a demand for international preliminary examination and for entry into the national phase

The applicable time limit for entering the national phase will, subject to what is said in the following paragraph, be 30 MONTHS from the priority date, not only in respect of any elected Office if a demand for international preliminary examination is filed before the expiration of 19 months from the priority date, but also in respect of any designated Office, in the absence of filing of such demand, where Article 22(1) as modified with effect from 1 April 2002 applies in respect of that designated Office. For further details, see *PCT Gazette* No. 44/2001 of 1 November 2001, pages 19926, 19932 and 19934, as well as the *PCT Newsletter*, October and November 2001 and February 2002 issues.

In practice, time limits other than the 30-month time limit will continue to apply, for various periods of time, in respect of certain designated or elected Offices. For regular updates on the applicable time limits (20, 21, 30 or 31 months, or other time limit), Office by Office, refer to the *PCT Gazette*, the *PCT Newsletter* and the *PCT Applicant's Guide*, Volume II, National Chapters, all available from WIPO's Internet site, at <http://www.wipo.int/pct/en/index.html>.

For filing a demand for international preliminary examination, see the *PCT Applicant's Guide*, Volume I/A, Chapter IX. Only an applicant who is a national or resident of a PCT Contracting State which is bound by Chapter II has the right to file a demand for international preliminary examination (at present, all PCT Contracting States are bound by Chapter II).

It is the applicant's sole responsibility to monitor all these time limits.

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Judith Zahra
Facsimile No.(41-22) 740.14.35	Telephone No.(41-22) 338.91.11

Form PCT/IB/308 (April 2002)

121

Descripción

Derivados de Diamina, Proceso para Producir los Derivados de Diamina, y Fungicidas que Contienen los Derivados de Diamina como Ingrediente Activo

Campo Técnico

Esta invención se relaciona con derivados de diamina novedosos, un proceso para producir los derivados de diamina, y un fungicida que contiene los derivados de diamina como un ingrediente activo.

Estado de la Técnica

El control de plagas juega un papel significativo en el cultivo de arroz en cáscara, y, en particular, varios fungicidas han sido desarrollados y usados contra el tizón del arroz, que es considerado como un daño importante de enfermedad. Estos fungicidas, sin embargo no siempre son satisfactorios en términos de la actividad fungicida deseada y el control de los efectos dañinos no

deseados sobre los cultivos útiles. Adicionalmente, en años recientes, los hongos tienen resistencia a las drogas han surgido debido al uso frecuente de fungidas en agricultura y horticultura, y los fungicidas existentes no siempre exhiben una actividad fungicida satisfactoria, más aun desde el punto de vista ambiental, ha habido demandas de fungicidas nuevos que sean seguros y capaces de controlar los hongos dañinos a concentraciones más bajas.

Divulgación de la Invención

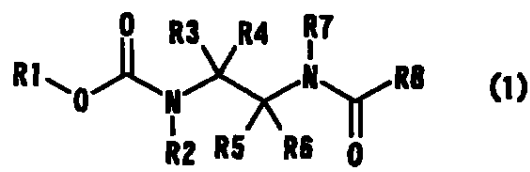
De acuerdo con lo anterior, un objeto de esta invención es suministrar derivados de diamina los cuales exhiben efectos excelentes para controlar el tizón del arroz, pero no dañan los cultivos útiles

Para poder resolver los problemas descritos anteriormente los inventores de la presente sintetizaron varios derivados de diamina novedosos y varias investigaciones relacionadas con sus actividades fungicidas, etc., se han llevado a cabo.

Ellos finalmente encontraron los derivados de diamina, que exhiben efecto excelente para controlar el tizón del arroz, pero no daña los cultivos útiles. Como un resultado los inventores de la presente han completado esta invención.

Específicamente, esta invención incluye las siguientes modalidades y aspectos:

[1] Un derivado de diamina, representado por la fórmula general siguiente (1):



En donde

R1 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo

arilalquilo el cual puede estar sustituido, un grupo heteroarilalquilo el cual puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido;

R2 y R7 representan independientemente un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo acilo;

R3 y R4 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo que

puede ser sustituido, o un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono incluyendo un carbón ligado;

R5 y R6 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido; siempre que en el caso sea excluido en donde R3, R4, R5 y R6 todos represente un átomo de Hidrógeno o en donde cualquiera de ellos entre R3, R4, R5 y R6 representen un grupo metilo el cual puede ser sustituido y los otros representen un átomo de Hidrógeno, y

R8 representa un grupo un grupo arilo que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido.

[2] El derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [1], en donde

R1 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilaquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido;

R2 y R7 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido, o grupo acilo;

R3 y R4 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido, o un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono que incluye un átomo de carbono ligado;
y

R5 y R6 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido; siempre que el caso sea excluido en donde R3, R4, R5 y R6 todos representen un átomo de Hidrógeno o en donde cualquiera entre R3, R4, R5 y R6 representen un grupo metilo que puede ser sustituido y los otros representen un átomo de Hidrógeno.

[3] El derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [2], en donde

R2 y R7 representan independientemente un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o un grupo acilo;

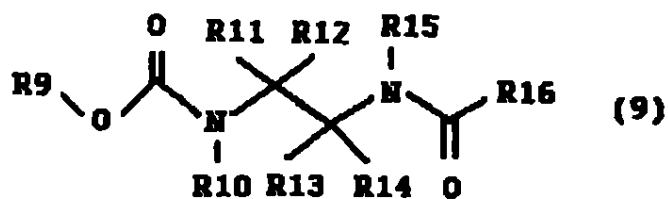
R3 y R4 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo cicloalquilo

con 3 a 6 átomos de carbono incluyendo un átomo de carbono ligado; y

R5 y R6 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido; siempre que el caso sea excluido en donde R3, R4, R5 y R6 todos representen un átomo de Hidrógeno o en donde uno cualquiera de R3, R4, R5 y R6 representen un grupo metilo que puede ser sustituido y los otros representen un átomo de Hidrógeno.

[4] El derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [3], en donde R2 Y R7 representan un átomo de Hidrógeno.

[5] Un derivado de diamina, representado por la fórmula general siguiente (9):



En donde R9 representa. un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, un grupo fenilo, un grupo fenilo que es sustituido en la cuarta posición, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido;

R10 y R15 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo acilo;

Uno entre R11 y R12 representan un grupo metilo, y el otro representa un átomo de Hidrógeno;

R13 y R14 representan un átomo de Hidrógeno, respectivamente; y

R16 representa un grupo fenilo, un grupo fenilo que es sustituido en la cuarta posición o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido.

[6] El derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [5], en donde

En donde R9 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, un grupo fenilo, un grupo fenilo que es sustituido en la cuarta posición, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido; y

R10 y R15 representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que

~~130~~
131

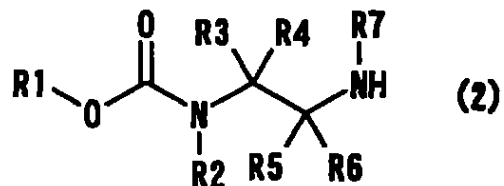
puede ser sustituido, o un grupo acilo, independientemente.

[7] El derivado de diamina de acuerdo con la sección [6], en donde R10 y R15 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o un grupo acilo.

[8] El derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [7], en donde R10 y R15 representan un átomo de Hidrógeno, respectivamente.

[9] Un fungicida, en donde este contiene el derivado de diamina de acuerdo con una cualquiera de la secciones anteriores [1] a [8] como un ingrediente activo.

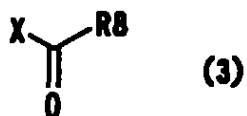
[10] Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [1], en donde un compuesto que tiene la fórmula general es siguiente (2):



En donde

R1, R2, R3, R4, R5, R6 y R7 representan los mismos grupos de aquellos de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [1],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (3):

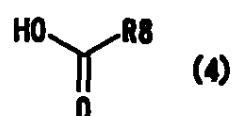


En donde

R8 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [1], y

X representa un grupo saliente.

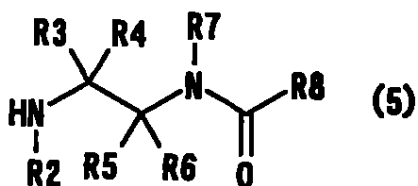
[11] Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [1], en donde un compuesto de la fórmula general (2) es condensado con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (4):



En donde

R8 representa el mismo grupo de aquel de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [1].

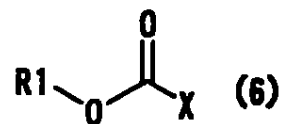
[12] Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [1], en donde un compuesto que tiene la fórmula general siguiente (5):



En donde

R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 representan los mismos grupos de aquellos del compuesto de acuerdo con la sección anterior [1],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (6):

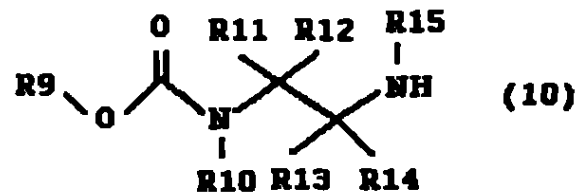


En donde

R1 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [1], y

X representa un grupo saliente.

[13] Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [5], en donde un compuesto que tiene la fórmula general siguiente (10):



En donde

R9, R10, R11, R12, R13, R14 y R15 representan los mismos grupos de aquellos de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [5],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene las siguiente fórmula general (11):



En donde

R17 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [5], y

X representa un grupo saliente.

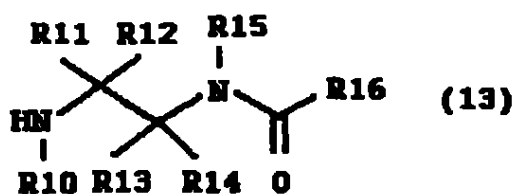
[14] Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [5], en donde un compuesto de fórmula general (10) es condensado con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (12):



En donde

R16 representa el mismo grupo de aquel de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [5].

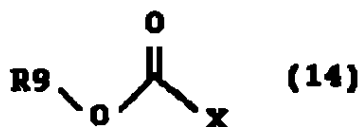
[15] Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la sección anterior [5], en donde un compuesto tiene la fórmula general siguiente (13):



En donde

R10, R11, R12, R13, R14, R15 y R16 representan los mismos grupos de aquellos de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [5],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene las siguiente fórmula general (14):



En donde

R9 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [5], y

X representa un grupo saliente.

Mejor Modo de Llevar a Cabo la Invención

La invención será descrita ahora en más detalle.

En los derivados de diamina las fórmulas generales (1) y (9) y el proceso para producirlas, ejemplos del grupo alquilo de 1 a 6 átomos de carbono incluye metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, alilo, metalilo y propargilo; ejemplos del grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono incluyen grupos ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo; ejemplos del grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono incluyen grupos vinilos, propenilo, butenilo, pentenilo y hexenilo; ejemplos del grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono incluyen los grupos ciclopropenilo, ciclobutenilo, ciclopentenilo y ciclohexenilo; ejemplos del grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono incluyen los grupos etinilo, propinilo, butinilo, pentinilo, hexinilo; ejemplos del grupo arilo incluyen grupos fenilo y naftilo; ejemplo del grupo heteroarilo incluyen los grupos piridilo, pirimidilo, tienilo, furanilo, pirasolilo, imidasolilo, isotiazolilo, isoxazolilo,

indolilo, quinolilo, benzofuranilo, benzotienilo, bezoxazolilo, benzoisoxazolilo, benzimidazolilo, benzotiazolilo y benzoisotiazolilo; ejemplos del grupo acilo incluyen los grupos aquilcarbonilo tales como grupo acetilo y grupos arilcarbonilo tales como el grupo benzoilo.

Ejemplos de los sustituyentes del grupo arilo y del grupo heteroarilo incluyen los grupos alquilo que tienen 1 a 6 átomos de carbono tales como metilo, etilo, propilo y butilo;

Los grupos cicloalquilo que tienen 3 a 6 átomos de carbono tales como los grupos ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo;

Los grupos alquilo sustituidos con halógeno que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos trifluorometilo, difluorometilo, bromodifluorometilo y trifluoro etilo; los grupos alcoxi que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos metoxi, etoxi, propoxi y butoxi; los grupos alcoxi sustituidos con halógeno que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos trifluorometoxi, difluorometoxi y

trifluoroetoxi; los grupos alquiltio que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como metiltio, etiltio, propiltio y butiltio; los grupos alquiltio sustituidos con halógeno que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos trifluorometiltio, difluorometiltio y trifluoroetiltio; los grupos alquilsulfinilo que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos metanosulfinilo, etanolsulfinilo, etanosulfinilo, propanosulfinilo y butanosulfinilo; los grupos alquilsulfinilo sustituidos con halógeno que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como en los grupos trifluorometanosulfinilo, difluorometanosulfinilo y trifluoroetanosulfinilo; los grupos alquilsulfonilo que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como los grupos metanosulfonilo, etanosulfonilo, propanosulfonilo y butasulfonilo; los grupos alquilsulfonilo sustituidos con halógeno que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como trifluorometanosulfonilo, difluorometanosulfonilo y trifluoroetanosulfonilo, grupos, alquilsulfonamida que tienen 1 a 4 átomos de carbón o tales como los grupos metanosulfonamida, etanosulfonamida, propanosulfonamida y butanosulfonamida; los grupos alquilsulfonamida sustituidos con halógeno que tienen 1 a 4 átomos de carbono tales como trifluorometanosulfonamida, difluorometanosulfonamida y

~~140~~
141

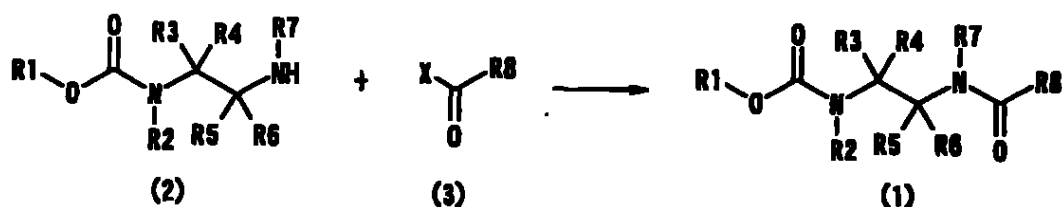
trifluoroetanosulfonamida; átomos de halógeno tales como el flúor, cloro, cloro, bromo y yodo; y grupos acilos tales como grupos acetilo y benzoilo.

El grupo arilo y el grupo heteroarilo pueden ser sustituidos por dos o más grupos seleccionados entre ellos.

Ejemplos del grupo metilo que puede ser sustituido, incluye los grupos metilo, hidroximetilo y halometilo.

En los compuestos de fórmulas generales (3), (6), (11) y (14), ejemplos de los grupos salientes incluyen átomos de halógeno tales como átomo de cloro; los grupos alcoxi tales como grupos metoxi y etoxi; los grupos ariloxi tales como grupo fenoxi; y el grupo imidazol.

Los compuestos de la invención representados por las fórmulas generales (1) y (9) son novedosas. Los compuestos de la fórmula (1) pueden ser producidos por el proceso mostrado en la siguiente ecuación (1):



Ecuación (1)

En donde

R1, R2, R3, R4, R5, R6 y R7 tienen las mismas definiciones de aquellos de la fórmula general (2), respectivamente; y

R8 y X tienen las misma definiciones de aquellos de la fórmula general (3), respectivamente.

En la ecuación (1) un derivado de diamina de la fórmula general (1) puede ser producida haciendo reaccionar un derivado de diamina de fórmula general (2) o su sal con un compuesto de carbonilo bien conocido de la fórmula general (3) en una reacción que no contiene disolvente o un disolvente, y que puede estar en la ausencia de una base o bases o en la presencia de una base o bases.

Ejemplos de la base usada en la reacción mostrada por la ecuación (1) incluye hidróxidos metálicos alcalinos tales como hidróxido de sodio e hidróxido de potasio; hidróxidos de metales de tierras alcalinas tales como hidróxido de magnesio e hidróxido de calcio; hidruros de metal alcalino tal como el hidruro de sodio y el hidruro de potasio; alcolatos de metal alcalino tales como metóxido de sodio y etóxido de sodio; óxido de metal alcalino tales como óxido de sodio; carbonatos tales como carbonato de potasio y carbonato de sodio; fosfatos tales como fosfato de tri-potasio, fosfato de tri-sodio, fosfato de di-potasio hidrogeno, fosfato de di-sodio hidrogeno; acetatos tales como acetato de sodio y acetato de potasio; bases orgánicas tales como piridina, 4-(dimetilamino) piridina, trietilamina y 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno. Por lo menos una base puede ser usada en la reacción anterior.

La cantidad de la base o bases no es limitada particularmente, y cuando por lo menos una de las anteriores bases orgánicas es usada, también puede ser usado un disolvente.

Ejemplos de disolvente que pueden ser usados en la reacción mostrada por la ecuación (1) incluyen agua; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y butanol; hidrocarburos halogenados tales como diclorometano y cloroformo; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos tales como hexano y heptano; disolventes apróticos polares tales como dimetil formamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), sulfóxido de dimetilo (DMSO), 1,3-dimetil-2-imidazolinona (DMI) y 1-metil-2-pirrolidona (NMP); éteres tales como dietil éter, diisopropil éter, 1,2-dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano (THF) y dioxano; y nitrilos tales como acetonitrilo y propionitrilo.

El equivalente químico del compuesto carbonilo de la fórmula general (3) al compuesto de la fórmula general (2) es preferiblemente 1 a 2, y más preferiblemente 1 a 1,2.

La temperatura de reacción y el tiempo de reacción de la reacción anterior puede ser cambiada en un amplio rango. Generalmente la temperatura de reacción puede estar preferiblemente en el rango entre -20 a 200° C, más preferiblemente entre 0 a 100° C, y el tiempo de reacción

puede estar preferiblemente en el rango entre 0,01 a 50 horas, y más preferiblemente entre 0,1 a 15 horas.

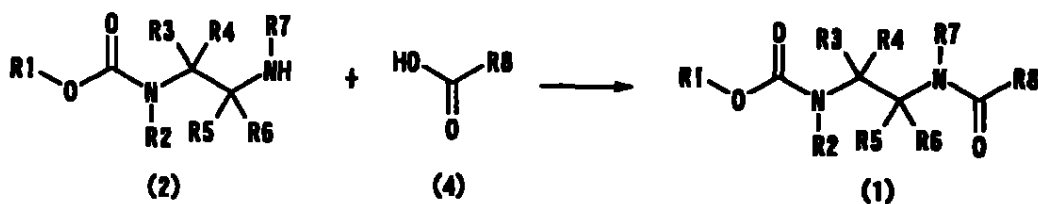
Los derivados de amina y las sales de las mismas de la fórmula general (2) de la ecuación (1), diferente de las disponibles comercialmente pueden ser producidas fácilmente por el método tal como la síntesis de Gabriel; reacción Delepin; la síntesis de amina bien conocida en la cual el grupo ciano, amida, imina o oxima es reducida; o la síntesis descrita en la asimetría de Tetrahedron, volumen 11, 1907 (2000).

Los compuestos de la fórmula general (3) de la ecuación (1) pueden ser producidos por procedimientos convencionales en los cuales un derivado bien conocido de ácido carboxílico de la fórmula general (4) se hace reaccionar con cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo, fosgeno o 1,1'-carbonil bis-1H-imidazol.

Los compuestos del fórmula general (3) de la ecuación (1) también pueden ser producidos por procedimientos convencionales en los cuales un derivado bien conocido de ácido carboxílico de la fórmula general (4) se hace reaccionar con alcohol tal metil alcohol o

etil alcohol sin un catalizador o en la presencia de un catalizador.

Los compuestos de la invención de la fórmula general (1), también pueden ser producidos por el proceso mostrado por la siguiente ecuación (2).



Ecuación (2)

En donde

R1, R2, R3, R4, R5, R6 y R7 tiene las mismas definiciones que la fórmula general (2), respectivamente;
 y

R8 tiene la misma definición que se da en la fórmula general (4).

En la ecuación (2), un derivado de diamina de fórmula general (1) puede ser producida por medio de condensar un derivado de diamina de la fórmula general (2) o sus sales con un derivado bien conocido de ácido carboxílico de la fórmula general (4), en una reacción que no contiene disolvente o que contiene uno o más disolventes.

Ejemplos de agentes de condensación para este caso incluyen:

N,N'-diciclohexil carbodiimida,
1,1'-carbonilbis-1H-imidazol
hidrocloruro de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)
carbodiimida, cloruro de 2-cloro-1,3-dimetilimidazolrio.

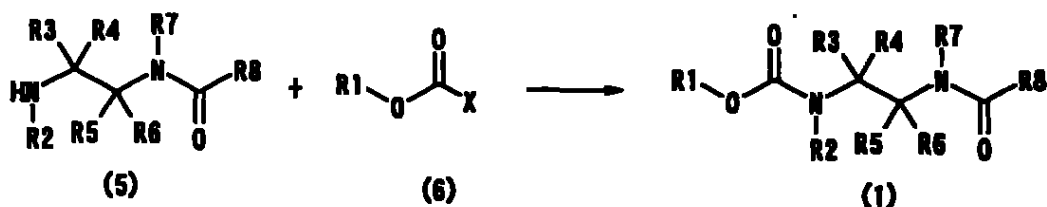
Ya que la cantidad del agente de condensación en el compuesto de la fórmula general (4), el equivalente químico del anterior al ultimo es preferiblemente 1 a 2 más preferiblemente 1 a 1,2.

Como disolvente o disolventes orgánicos para este caso, los mismos disolventes que aquellos para el proceso mostrado por la ecuación (1) pueden ser usados.

Con respecto a la cantidad del derivado de ácido carboxílico de fórmula general (4) al compuesto de fórmula general (2), el equivalente químico del anterior al último es preferiblemente 1 a 2, más preferiblemente 1 a 1,2.

La temperatura de reacción y el tiempo de reacción de la reacción anterior puede cambiar en un amplio rango. Generalmente la temperatura de reacción puede estar preferiblemente en el rango entre -20 a 200° C, más preferiblemente entre 0 a 100° C, y el tiempo de reacción puede estar preferiblemente en el rango entre 0,01 a 50 horas, más preferiblemente desde 0,1 a 15 horas.

Los compuestos de la invención de la fórmula general (1), también pueden ser producidos por el proceso mostrado por la siguiente ecuación (3):



Ecuación (3)

En donde

R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 tienen las mismas definiciones que la fórmula general (5), respectivamente; y

R1 y RX tiene la misma definición de aquellos de la fórmula general (6), respectivamente.

En la ecuación (3), un derivado de diamina de la fórmula general (1) puede ser producido haciendo reaccionar un derivado de diamina de la fórmula general (5) o sus sales con un compuesto bien conocido de la fórmula general (6) en una reacción que no contiene disolvente o contiene uno o más disolventes, sea en la ausencia de una o más bases o en la presencia de una o más bases.

En esta reacción, la misma base o bases son usadas en la ecuación (1) pueden ser usadas aquí.

La cantidad de las bases usadas no es particularmente limitada, y cuando las bases orgánicas anteriores son usadas, ellas también pueden ser usadas como un disolvente.

Como disolventes para este caso los mismos disolventes usados en el proceso mostrado por la ecuación (1) pueden ser usados aquí.

Con respecto a la cantidad de los compuestos de la fórmula general (6) con respecto a los derivados de diamina de la fórmula general (5), el equivalente químico del anterior al último es preferiblemente 1 a 2, más preferiblemente 1 a 1,2.

La temperatura de reacción y el tiempo de reacción de la reacción anterior puede cambiar en un amplio rango. Generalmente, la temperatura de reacción puede estar preferiblemente en el rango entre -20 a 200° C, más preferiblemente entre 0 a 100° C, y el tiempo de reacción

puede estar preferiblemente en el rango entre 0,01 a 50 horas, más preferiblemente entre 0,1 a 15 horas.

Los compuestos de la fórmula (9), pueden ser producidos de las mismas maneras por medio de la sustitución de los compuestos (2) a (6) en las ecuaciones de reacción (1) a (3) con los compuestos (10) a (14) mencionados anteriormente.

Existen átomos de carbono asimétricos en los derivados de diamina de las fórmulas generales (1) y (9), dependiendo del tipo de sustituyentes, y los derivados pueden existir como isómeros ópticos, diastereoisómeros, modificación racémica o mezclas de ellos en una taza arbitraria. La invención abraza todos los isómeros de estos tipos y mezclas de ellos.

Los fungicidas de agricultura y horticultura que contienen los derivados de diamina de la invención representada por las fórmulas generales (1) y (9) como ingrediente activo exhiben un efecto excelente para controlar el tizón de arroz causado por la *Pyricularia oryzae*.

Los derivados de diamina de la invención de las fórmulas generales (1) y (9) pueden ser usados por medio de combinarlos con por lo menos uno de otros fungicidas, químicos de agricultura tales como insecticidas, herbicidas y reguladores de crecimiento de plantas, acondicionadores del suelo, sustancias responsables de fertilizador. Ellos pueden ser aplicados en la forma de una preparación de mezcla.

Aunque los derivados de diamina de la presente invención pueden ser usados tal como están, ellos preferiblemente son usados como una formulación en la forma de una composición que puede ser obtenida mezclándolos con un vehículo que incluye un diluyente sólido o líquido. El termino "vehículo" usado aquí significa unos materiales inorgánico u orgánicos, sintéticos u orgánicos, sintéticos o naturales que son mezclados para ayudar al ingrediente activo a alcanzar el sitio objetivo de hacer más fácil el almacenamiento, transporte y manejo de los compuestos de ingrediente activo.

Ejemplos de los vehículos sólidos adecuados usados en la invención incluyen arcillas tales como

montmorillonita, caolinita y bentonita; sustancias inorgánicas tales como tierras diatomáceas, arcilla, talco, vermiculita, plaster, carbonato de calcio, gel de sílice y sulfuro de amonio; materiales orgánicos vegetales tales como harina de soya, polvo y flor de trigo; y urea.

Ejemplos de los vehículos líquidos adecuados usados en la invención incluyen los hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, Ximeno y cumeno; hidrocarburos de parafina tales como querosina y aceite mineral; hidrocarburos halogenados tales como tetracloruro de carbono, cloroformo y dicloroetano; cetonas tales como acetona y metiletilcetona; éteres tales como dioxano, tetrahidrofurano y dietilen glicol dimetil éter; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y etilen glicol; dimetilformamida; dimetil sulfóxido; y agua.

Para poder mejorar la efectividad de los compuestos de la invención, por lo menos uno de los siguientes activantes pueden ser usados solos o en sus combinaciones, de acuerdo con el objetivo, mientras que se tiene en cuenta la formulación de los compuestos, el sitio de aplicación, etc.

Cuando se quiere una emulsificación, dispersión, esparcimiento, humectante, aglomerante y estabilización de los compuestos uno o varios adyuvantes pueden ser usados para la formulación. Ejemplos de adyuvantes incluyen los tenso activos aniónicos tales como ligninsulfonato, alquilbenzenosulfonato, ester de alquilsulfato, ester polioxialquileno alquilsulfato y ester de polioxialquileno alquilfosfato, tenso activos no ionicos tales como polioxialquilen alquil éter, polioxialquilen aquilaril éter, polioxialquilen alquilamina, polioxialquilen alquilamida, polioxialquilen alquiltio éter, polioxialquilen de esteos graso, ester graso de glicerol, ester graso de sorbitan, ester graso de polioxialquilen sorbitan y copolímero de bloque de polioxipropileno polioxietileno; lubricantes tales como estearato de calcio y cera; estabilizadores tales como fosfato de isopropilhidrodieno; metil celulosa; carboximetil celulosa; caseina; y goma arábica.

Los adyuvantes usados no están limitados a los anteriormente descritos.

La cantidad de compuestos de la invención como un ingrediente activo es generalmente 0,5 a 20% en peso para la formulación en polvo, 5 a 50% en peso para concentrados emulsificables, 10 a 90% en peso para polvos humectables, 0,1 a 20% en peso para granular y 10 a 90% en peso para fluible. La cantidad de vehículo en cada formulación es generalmente entre 60 a 99% en peso para polvo, 40 a 95% en peso para concentrado emulsificable, 10 a 90% en peso para polvo humectante, 80 a 99% en peso para granular, y 10 a 90% en peso para fluible, respectivamente. La cantidad de adyuvante es generalmente entre 0,1 a 20% en peso para polvo, 1 a 20% en peso para concentrado emulsificable, 0,1 a 20% en peso para polvo humectable, 0,1 a 20% en peso para granular y 0,1 a 20% en peso para fluible.

[Ejemplos]

En seguida, la invención será descrita en mayor detalle tomando en cuenta varios ejemplos y ejemplos de ensayo.

Ejemplo 1

[Preparación de N-(metoxycarbonil)-N'-benzoil-1-fenil-1,2-etilenediamina (compuesto No. 66)]

0,22 g de cloruro de benzoilo fue agregado a 10 ml de una solución de 0,25g de N-(metoxycarbonil)-1-feniletilenediamina y 0,2 g de trietilamina en diclorometano bajo enfriamiento con hielo, y la mezcla fue agitada durante 30 minutos a 5° C y a temperatura ambiente durante 3 horas. La mezcla de reacción fue enjuagada con agua, la capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidroso, y el material aceitoso residual obtenido bajo una presión reducida fue purificado por cromatografía de columna sobre gel de sílice (2:1 hexano/acetato de etilo) para obtener 0,28 g del compuesto titulado como un cristales sin color.

Ejemplo 2

[Preparación de N-(4-clorobenzoil)-N'-(1-propoxycarbonil)-3-fenil-1,2-propanodiamina (compuesto No. 290)]

0,21 g de 1,1'-carbonilbis-1H-imidazol fue agregado a una solución de 0,19 g de ácido 4-clorobenzoico en tetrahidrofurano y agitado durante 1 hora a temperatura ambiente. Luego 5 ml de una solución de 0,25 g de 2-(i-propoxycarbonilamino)-3-fenilpropilamina en tetrahidrofurano se agregó a la solución anterior y se agitó a temperatura ambiente durante 4 horas. La mezcla de reacción fue enjuagada con agua, la capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidroso, y el material aceitoso residual obtenido bajo una presión reducida fue purificado por cromatografía de columna sobre gel de sílice (2:1 hexano/acetato de etilo) para obtener 0,26 g del compuesto titulado como cristales sin color.

Ejemplo 3

[Preparación de N-(benziloxycarbonil)-N'-benzoil-1-fenil-1,2-etilenediamina (compuesto No. 636)]

0,12 g de trietilamina fue agregado a 10 ml de una solución de 0,25 g de hidrocloruro N-benzoil-2-fenil-1,2-etilenediamina y 0,17 g de cloroformato de bencilo en diclorometano bajo enfriamiento con hielo, y la mezcla fue agitada 5° C durante 30 minutos y a temperatura

ambiente durante 3 horas. La mezcla de reacción fue enjuagada con agua, la capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidroso, y el material aceitoso residual obtenido bajo una presión reducida fue purificado por cromatografía de columna sobre gel de sílice (2:1 hexano/acetato de etilo) para obtener 0,28 g del compuesto titulado como cristales sin color.

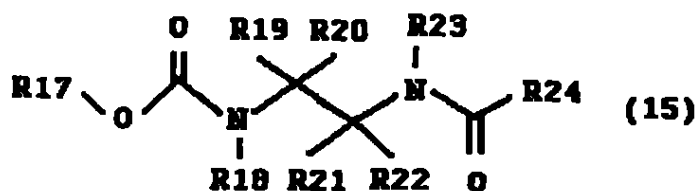
Ejemplo 5

[Preparación de N-(t-butoxicarbonil)-N'-(4-metilbenzoil)-1-fenil-1,2-etilenediamina (compuesto No. 504)]

0,24 g de trietilamina fue agregado a una solución de 0,22 g de di-t-butil bicarbonato y 0,25 g de hidrocloruro de N-(4-metilbenzoil)-2-fenil-1,2-etilenediamina en diclorometano bajo enfriamiento con hielo, y la mezcla se agitó a 5° C durante 1 hora y a temperatura ambiente durante 3 horas. La mezcla de reacción fue enjuagada con agua, la capa orgánica fue secada sobre sulfato de magnesio anhidroso, y el material aceitoso residual obtenido bajo presión reducida fue purificado por cromatografía de columna sobre gel de

silíce (2:1 hexano/acetato de etilo) para obtener 0,24 g del compuesto titulado como cristales sin color.

Los compuestos de las fórmulas generales (1) y (9) que pueden ser producidos de la misma manera que en los ejemplos 1 a 4 se muestran en la Tabla 1 que sigue. Y las propiedades físicas de algunos de los compuestos se dan en la tabla 2. R17 a R24 en la Tabla 1 son las sustituciones mostradas en la fórmula siguiente (15):



En la Tabla 1, Me representa un grupo metilo, Et representa un grupo etilo, n-Pr representa un grupo propilo normal, i-Pr representa un grupo isopropilo, i-Bu representa un grupo isobutilo, s-Bu representa un grupo butilo secundario, t-Bu representa un grupo butilo terciario, pH representa un grupo fenilo, Bn representa un grupo benzilo, 1-Naf representa un grupo 1-naftilo, 2-Naf representa un grupo 2-naftilo, c-Pr representa un

grupo ciclopropilo, c-Hex representa un grupo ciclohexilo, Ac representa un grupo acetilo, Bz representa un grupo benzoilo, vinilo representa un grupo etenilo, alilo representa un grupo 2-propenilo, propargilo representa un grupo 2-propinilo, neopentilo representa un grupo 2,2-dimetilpropilo, metalilo representa un grupo 2-metil-2-propoenilo, y 2-tienilo representa un grupo tiofeno-2-ilo.

Tabla 1

Comp. No.	R17	R18	R19	R20	R21	R22	R23	R24
1	Me	H	Me	H	H	H	H	Ph
2	Me	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
3	Me	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
4	Me	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
5	Me	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
6	Me	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
7	Me	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
8	Me	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
9	Me	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
10	Me	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
11	Me	H	Et	H	H	H	H	Ph
12	Me	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
13	Me	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
14	Me	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

410
161

15	Me	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
16	Me	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
17	Me	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
18	Me	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
19	Me	H	Et	H	H	H	H	2-metilo piridin-5-ilo
20	Me	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
21	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
22	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
23	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
24	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
25	Me	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
26	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
27	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
28	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
29	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
30	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
31	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
32	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
33	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metilo tiofen-2-ilo
34	Me	H	i-Pr	H	H	H	H	piridin-3-ilo
35	Me	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
36	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
37	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
38	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
39	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
40	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
41	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
42	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf

43	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
44	Me	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
45	Me	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
46	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
47	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
48	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
49	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
50	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
51	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
52	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
53	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
54	Me	H	i-Bu	H	H	H	H	3-metilo isotiazol-5-ilo
55	Me	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
56	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
57	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
58	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
59	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
60	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
61	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
62	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
63	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
64	Me	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
65	Me	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
66	Me	H	Ph	H	H	H	H	Ph
67	Me	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
68	Me	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
69	Me	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

70	Me	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
71	Me	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
72	Me	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
73	Me	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
74	Me	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
75	Me	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
76	Me	H	Bn	H	H	H	H	Ph
77	Me	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
78	Me	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
79	Me	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
80	Me	H	Bn	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
81	Me	H	- (CH ₂) ₂ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
82	Me	H	- (CH ₂) ₄ -		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
83	Et	H	Me	H	H	H	H	Ph
84	Et	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
85	Et	H	Me	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
86	Et	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
87	Et	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
88	Et	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
89	Et	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
90	Et	H	Me	H	H	H	H	5-cloro tiofen-2-ilo
91	Et	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
92	Et	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

93	Et	H	Et	H	H	H	H	Ph
94	Et	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
95	Et	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
96	Et	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
97	Et	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
98	Et	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
99	Et	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
100	Et	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
101	Et	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
102	Et	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
103	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
104	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
105	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
106	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
107	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
108	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
109	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
110	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
111	Et	H	i-Pr	H	H	H	H	4-coro piridin-3-ilo
112	Et	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
113	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
114	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
115	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
116	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
117	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
118	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
119	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
120	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
121	Et	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-

								ilo
122	Et	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
123	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
124	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
125	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
126	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
127	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
128	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
129	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
130	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
131	Et	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
132	Et	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
133	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
134	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
135	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
136	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
137	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
138	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
139	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
140	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
141	Et	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
142	Et	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
143	Et	H	Ph	H	H	H	H	Ph
144	Et	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
145	Et	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
146	Et	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
147	Et	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
148	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph

149	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
150	n-Pr	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
151	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
152	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
153	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
154	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
155	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	5-etilo tiofen-2-ilo
156	n-Pr	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
157	n-Pr	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
158	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	Ph
159	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	2-ClC ₆ H ₄
160	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	3-ClC ₆ H ₄
161	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	4-ClC ₆ H ₄
162	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	4-MeC ₆ H ₄
163	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
164	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	1-Naf
165	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	tiofen-2-ilo
166	n-Pr	H	Et	H	Et	H	H	piridin-3-ilo
167	n-Pr	H	Et	Me	Et	H	H	4-ClC ₆ H ₄
168	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
168	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
169	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
170	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
171	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
172	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
173	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
174	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
175	n-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metilo piridi-3-ilo

176	n-Pr	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
177	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	Ph
178	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	4-ClC ₆ H ₄
179	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
180	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	2-MeC ₆ H ₄
181	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	4-MeC ₆ H ₄
182	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	4-t-BuC ₆ H ₄
183	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	1-Naf
184	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	tiofen-2-ilo
185	n-Pr	H	s-Bu	H	Me	Me	H	isotiazol-5-ilo
186	n-Pr	H	s-Bu	Me	Me	Me	H	4-MeC ₆ H ₄
187	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
188	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
189	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
190	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
191	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
192	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
193	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
194	n-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
195	n-Pr	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
196	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
197	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
198	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
199	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
200	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
201	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
202	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
203	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo

204	n-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
205	n-Pr	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
206	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	Ph
207	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
208	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
209	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
210	n-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
211	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph
212	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
213	i-Pr	H	Me	H	Me	H	H	3-ClC ₆ H ₄
214	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
215	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
216	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
217	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
218	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
219	i-Pr	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
220	i-Pr	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
221	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	Ph
222	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
223	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
224	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
225	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
226	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
227	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
228	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
229	i-Pr	H	Et	H	H	H	H	2-mtilo piridi-5-ilo
230	i-Pr	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
231	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph

232	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
233	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
234	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
235	i-Pr	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
236	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
237	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
238	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
239	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
240	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
241	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
242	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
243	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metilo tiofen-2-ilo
244	i-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	piridin-3-ilo
245	i-Pr	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
246	i-Pr	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-MeC ₆ H ₄
247	i-Pr	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-ClC ₆ H ₄
248	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
249	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
250	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
251	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
252	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
253	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
254	i-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
255	i-Pr	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
256	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
257	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
258	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
259	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄

260	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
261	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
262	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
263	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
264	i-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3-metilo isotiazol-5- ilo
265	i-Pr	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
266	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
267	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
268	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
269	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
270	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
271	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
272	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
273	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
274	i-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
275	i-Pr	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
276	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	Ph
277	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
278	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
279	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
280	i-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
281	i-Pr	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
282	i-Pr	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
283	i-Pr	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
284	i-Pr	H	4-	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

170
171

			ClC6H4					
285	i-Pr	H	4- ClC6H4	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
286	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	Ph
287	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	4-CF3C6H4
288	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC6H4
289	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC6H4
290	i-Pr	H	Bn	H	H	H	H	4-ClC6H4
291	i-Pr	H	- (CH2) 4-		H	H	H	4-ClC6H4
292	i-Pr	H	- (CH2) 5-		H	H	H	4-ClC6H5
293	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	Ph
294	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	2-ClC6H4
295	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	3-ClC6H4
296	s-Bu	H	Me	H	Me	H	H	4-ClC6H4
297	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-MeC6H4
298	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
299	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
300	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	3-metilo tiofen-2-ilo
301	s-Bu	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
302	s-Bu	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC6H4
303	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	Ph
304	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	2-ClC6H4
305	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	3-ClC6H4
306	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	4-ClC6H4
307	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	4-MeC6H4
308	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
309	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	1-Naf
310	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo

311	s-Bu	Ac	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
312	s-Bu	Ac	i-Pr	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
313	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
314	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
315	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
316	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
317	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
318	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
319	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
320	s-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
321	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	5-metilo piridin- 3-ilo
322	s-Bu	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
323	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	Ph
324	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	4-ClC ₆ H ₄
325	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
326	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	2-MeC ₆ H ₄
327	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	4-MeC ₆ H ₄
328	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	4-t-BuC ₆ H ₄
329	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	1-Naf
330	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	tiofen-2-ilo
331	s-Bu	H	s-Bu	H	H	H	Bz	isotiazol-5- ilo
332	s-Bu	H	s-Bu	Me	H	H	Bz	4-MeC ₆ H ₄
333	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
334	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
335	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
336	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
337	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
338	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄

339	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
340	s-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
341	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
342	s-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
343	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
344	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
345	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
346	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
347	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
348	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
349	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
350	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
351	s-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
352	s-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
353	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	Ph
354	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
355	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
356	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
357	s-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
358	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	Ph
359	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
360	i-Bu	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
361	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
362	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
363	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
364	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
365	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
366	i-Bu	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo

367	i-Bu	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
368	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	Ph
369	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
370	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
371	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
372	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
373	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
374	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
375	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
376	i-Bu	H	Et	H	H	H	H	2-metilo piridin-5-ilo
377	i-Bu	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
378	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
379	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
380	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
381	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
382	i-Bu	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
383	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
384	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
385	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
386	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
387	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
388	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
389	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
390	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil tiofeno-2-il
391	i-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	piridin-3-ilo
392	i-Bu	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
393	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
394	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

395	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
396	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
397	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
398	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
399	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
400	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
401	i-Bu	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
402	i-Bu	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
403	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
404	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
405	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
406	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
407	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
408	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
409	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
410	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
411	i-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3-metil isotiazol-5-ilo
412	i-Bu	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
413	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
414	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
415	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
416	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
417	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
418	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
419	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
420	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
421	i-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo

422	i-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
423	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	Ph
424	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
425	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
426	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
427	i-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
428	i-Bu	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
429	i-Bu	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
430	i-Bu	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
431	i-Bu	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
432	i-Bu	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
433	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	Ph
434	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
435	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
436	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
437	i-Bu	H	Bn	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
438	i-Bu	H	- (CH ₂) 4-		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
439	t-Bu	H	-CH ₂) 5-		H	H	H	4-ClC ₆ H ₅
440	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	Ph
441	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
442	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
443	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
444	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
445	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
446	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	1-Naf

447	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	5-metil tiofen-2-ilo
448	t-Bu	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
449	t-Bu	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
450	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	Ph
451	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
452	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
453	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
454	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
455	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
456	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	1-Naf
457	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
458	t-Bu	Me	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
459	t-Bu	Me	i-Pr	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
460	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
461	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
462	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
463	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
464	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
465	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
466	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
467	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
468	t-Bu	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil piridin-3-ilo
469	t-Bu	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
470	t-Bu	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-MeC ₆ H ₄
471	t-Bu	H	i-Pr	H	Me	H	H	4-ClC ₆ H ₄
472	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
473	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	2-MeC ₆ H ₄
474	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	4-MeC ₆ H ₄

475	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	4-t-BuC6H4
476	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	1-Naf
478	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	tiofen-2-ilo
479	t-Bu	H	S-Bu	H	H	H	Et	isotiazol-5-ilo
480	t-Bu	H	S-Bu	Me	H	H	Et	4-MeC6H4
481	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
482	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
483	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
484	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
485	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
486	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
487	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
488	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
489	t-Bu	H	i-Bu	Me	H	H	H	isotiazol-5-ilo
490	t-Bu	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
491	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
492	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
493	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
494	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
495	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
496	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
497	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
498	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
499	t-Bu	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
500	t-Bu	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
501	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	Ph
502	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC6H4
503	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC6H5

504	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
505	t-Bu	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
506	Ph	H	Me	H	H	H	H	Ph
507	Ph	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
508	Ph	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
509	Ph	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
510	Ph	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
511	Ph	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
512	Ph	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
513	Ph	H	Me	H	H	H	H	5-metil tiofen-2-ilo
514	Ph	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
515	Ph	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
516	Ph	H	Et	H	H	H	H	Ph
517	Ph	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
518	Ph	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
519	Ph	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
520	Ph	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
521	Ph	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
522	Ph	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
523	Ph	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
524	Ph	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
525	Ph	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
526	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
527	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
528	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
529	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
530	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
531	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
532	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf

533	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
534	Ph	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil piridin-3-ilo
535	Ph	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
536	Ph	H	alilo	H	H	H	H	Ph
537	Ph	H	alilo	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
538	Ph	H	alilo	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
539	Ph	H	alilo	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
540	Ph	H	alilo	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
541	Ph	H	alilo	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
542	Ph	H	alilo	H	H	H	H	1-Naf
543	Ph	H	alilo	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
544	Ph	H	alilo	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
545	Ph	H	alilo	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
546	Ph	H	alilo	H	H	H	H	Ph
547	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
548	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
549	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
550	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
551	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
552	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
553	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
554	Ph	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
555	Ph	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
556	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	Ph
557	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
558	Ph	H	proparg	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃

181

			ilo					
559	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
560	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
561	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
562	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	1-Naf
563	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
564	Ph	H	proparg ilo	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
565	Ph	H	proparg ilo	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
566	Ph	H	Ph	H	H	H	H	Ph
567	Ph	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
568	Ph	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₅
569	Ph	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
570	Ph	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
571	Bn	H	Me	H	H	H	H	Ph
572	Bn	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
573	Bn	H	Me	H	Me	H	H	3-ClC ₆ H ₃
574	Bn	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
575	Bn	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
576	Bn	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
577	Bn	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
578	Bn	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
579	Bn	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
580	Bn	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
581	Bn	H	Et	H	H	H	H	Ph

582	Bn	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
583	Bn	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
584	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
585	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
586	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
587	Bn	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
588	Bn	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
589	Bn	H	Et	H	H	H	H	4-metil piridin-5-ilo
590	Bn	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
591	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	Ph
592	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
593	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₅
594	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
595	Bn	H	n-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
596	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
597	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
598	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
599	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
600	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
601	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
602	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
603	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil tiofen-2-ilo
604	Bn	H	i-Pr	H	H	H	H	piridin-3-ilo
605	Bn	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
606	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
607	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
608	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
609	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄

610	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
611	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
612	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
613	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
614	Bn	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
615	Bn	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
616	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
617	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
618	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
619	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
620	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
621	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
622	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
623	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
624	Bn	H	i-Bu	H	H	H	H	3-metil isotiazol-5-ilo
625	Bn	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
626	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
627	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
628	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
629	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
630	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
631	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
632	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
633	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
634	Bn	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
635	Bn	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
636	Bn	H	Ph	H	H	H	H	Ph

637	Bn	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
638	Bn	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
639	Bn	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
640	Bn	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
641	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	Ph
642	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
643	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
644	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
645	Bn	H	4-MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
646	Bn	H	Bn	H	H	H	H	Ph
647	Bn	H	Bn	H	H	H	H	4-CF ₃ C ₆ H ₄
648	Bn	H	Bn	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
649	Bn	H	Bn	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
650	Bn	H	Bn	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
651	Bn	H	- (CH ₂) 4-		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
652	Bn	H	- (CH ₂) 5-		H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
653	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	Ph
654	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	2-BrC ₆ H ₄
655	2-Naf	H	Me	Me	H	H	H	3-BrC ₆ H ₄
656	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	4-BrC ₆ H ₄
657	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
658	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
659	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
660	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	5-metilo

								tiofen-2-ilo
661	2-Naf	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
662	2-Naf	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
663	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	Ph
664	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	2-FC ₆ H ₄
665	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	3-FC ₆ H ₄
666	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	4-FC ₆ H ₄
667	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
668	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
669	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
670	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
671	2-Naf	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
672	2-Naf	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
673	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
674	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
675	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
676	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
677	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
678	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
679	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
680	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
681	2-Naf	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metilo piridin-3-ilo
682	2-Naf	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
683	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
684	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
685	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
686	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
687	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
688	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄

689	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
690	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
691	2-Naf	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
692	2-Naf	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
693	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
694	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC6H4
695	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
696	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4
697	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
698	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
699	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
700	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
701	2-Naf	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
702	2-Naf	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC6H4
703	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	Ph
704	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	4-ClC6H4
705	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
706	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	2-MeC6H4
707	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	4-MeC6H4
708	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
709	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	1-Naf
710	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
711	2-Naf	H	c-Hex	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
712	2-Naf	H	c-Hex	Me	H	H	H	4-MeC6H4
713	2-Naf	H	Ph	H	H	H	H	Ph
714	2-Naf	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC6H4
715	2-Naf	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC6H4
716	2-Naf	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC6H4

717	2-Naf	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC6H4
718	alilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
719	alilo	H	Me	H	H	H	H	2-ClC6H4
720	alilo	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC6H3
721	alilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC6H4
722	alilo	H	Me	H	H	H	H	4-CNC6H4
723	alilo	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
724	alilo	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
725	alilo	H	Me	H	H	H	H	5-metilo tiofen-2-ilo
726	alilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
727	alilo	H	Me	Me	H	H	H	4-CF3C6H4
728	alilo	H	Et	H	H	H	H	Ph
729	alilo	H	Et	H	H	H	H	2-ClC6H4
730	alilo	H	Et	H	H	H	H	3-ClC6H3
731	alilo	H	Et	H	H	H	H	4-ClC6H4
732	alilo	H	Et	H	H	H	H	4-MeC6H4
733	alilo	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
734	alilo	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
735	alilo	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
736	alilo	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
737	alilo	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC6H4
738	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
739	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC6H4
740	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
741	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC6H4
742	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
743	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC6H4
744	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
745	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo

746	alilo	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metilo piridin-3-ilo
747	alilo	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
748	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
749	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
750	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
751	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
752	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
753	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
754	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
755	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
756	alilo	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
757	alilo	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
758	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
759	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
760	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
761	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
762	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
763	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
764	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
765	alilo	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
766	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
767	alilo	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
768	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
769	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
770	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
771	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
772	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
773	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄

774	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
775	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
776	alilo	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
777	alilo	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
778	alilo	H	Ph	H	H	H	H	Ph
779	alilo	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
780	alilo	H	4-FC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
781	alilo	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
782	alilo	H	4-Brc ₆ H ₄	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
783	propargilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
784	propargilo	H	Me	H	H	H	H	2-IC ₆ H ₄
785	propargilo	H	Me	H	H	H	H	3-IC ₆ H ₄
786	propargilo	H	Me	H	H	H	H	4-IC ₆ H ₄
787	propargilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
788	propargilo	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
789	propargilo	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
790	propargilo	H	Me	H	H	H	H	5-metilo tiofen-2-ilo
791	propargilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
792	propargilo	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

793	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	Ph
794	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
795	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
796	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
797	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
798	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
799	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
800	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
801	proparg ilo	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
802	proparg ilo	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
803	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
804	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
805	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
806	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
807	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
808	proparg	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄

	ilo							
809	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
810	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
811	proparg ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metilo piridin-3-ilo
812	proparg ilo	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
813	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
814	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
815	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
816	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
817	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
818	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
819	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
820	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
821	proparg ilo	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
822	proparg ilo	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
823	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph

192

824	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
825	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
826	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
827	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
828	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
829	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
830	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
831	proparg ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
832	proparg ilo	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
833	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
834	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
835	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
836	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
837	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
838	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
839	proparg	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf

	ilo							
840	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
841	proparg ilo	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
842	proparg ilo	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
843	proparg ilo	H	Ph	H	H	H	H	Ph
844	proparg ilo	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
845	proparg ilo	H	4- ClC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
846	proparg ilo	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
847	proparg ilo	H	4- MeC ₆ H ₄	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
848	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph
849	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
850	c-Pr	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC ₆ H ₃
851	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
852	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
853	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
854	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
855	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	5-metilo tiofen-2-ilo
856	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
857	c-Pr	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
858	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	Ph
859	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
860	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄

861	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
862	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
863	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
864	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
865	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
866	c-Pr	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
867	c-Pr	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
868	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
869	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
870	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
871	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
872	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
873	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
874	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
875	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
876	c-Pr	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil piridin-3-ilo
878	c-Pr	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
879	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
880	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
881	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
882	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
883	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
884	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
885	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
886	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
887	c-Pr	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
888	c-Pr	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
889	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph

890	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
891	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
892	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
893	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
894	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
895	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
896	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
897	c-Pr	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
898	c-Pr	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
899	c-Pr	H	t-Bu	H	Bn	H	H	Ph
900	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
901	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
902	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
903	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
904	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
905	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
906	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
907	c-Pr	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
908	c-Pr	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
909	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	Ph
910	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
911	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
912	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
913	c-Pr	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
914	c-Pr	H	Me	H	H	H	H	Ph
915	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
916	c-Hex	H	Me	H	Et	H	H	3-ClC ₆ H ₄
917	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

918	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
919	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
920	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
921	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	5-metilo tiofen-2-ilo
922	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
923	c-Hex	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
924	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	Ph
925	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
926	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
927	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
928	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
929	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
930	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
931	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
932	c-Hex	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
933	c-Hex	H	Et	Me	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
934	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
935	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
936	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
937	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
938	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
939	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
940	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
941	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
942	c-Hex	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil piridin-3-ilo
943	c-Hex	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
944	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	Ph
945	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

946	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
947	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
948	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
949	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
950	c-Hex	H	s-Bu	H	Ph	H	H	1-Naf
951	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
952	c-Hex	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
953	c-Hex	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
954	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
955	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
956	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
957	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
958	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
959	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
960	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
961	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
962	c-Hex	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
963	c-Hex	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
964	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
965	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
966	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
967	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
968	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
969	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
970	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
971	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
972	c-Hex	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
973	c-Hex	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

974	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	Ph
975	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC6H4
976	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC6H4
977	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC6H4
978	c-Hex	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC6H4
979	c-Hex	H	Me	H	H	H	H	Ph
980	vinilo	H	Me	H	H	H	H	2-ClC6H4
981	vinilo	H	Me	Me	H	H	H	3-ClC6H4
982	vinilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC6H4
983	vinilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC6H4
984	vinilo	H	Me	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
985	vinilo	H	Me	H	H	H	H	1-Naf
986	vinilo	H	Me	H	H	H	H	5-etilo tiofen-2-ilo
987	vinilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
988	vinilo	H	Me	Me	H	H	H	4-ClC6H4
989	vinilo	H	Et	H	H	H	H	Ph
990	vinilo	H	Et	H	H	H	H	2-ClC6H4
991	vinilo	H	Et	H	H	H	H	3-ClC6H4
992	vinilo	H	Et	H	H	H	H	4-ClC6H4
993	vinilo	H	Et	H	H	H	H	4-MeC6H4
994	vinilo	H	Et	H	H	H	H	4-t-BuC6H4
995	vinilo	H	Et	H	H	H	H	1-Naf
996	vinilo	H	Et	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
997	vinilo	H	Et	H	H	H	H	piridin-3-ilo
998	vinilo	H	Et	H	H	H	H	4-ClC6H4
999	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1000	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC6H4
1001	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
1002	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC6H4

1003	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1004	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
1005	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-Naf
1006	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1007	vinilo	H	i-Pr	H	H	H	H	5-metil piridin-3-ilo
1008	vinilo	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1009	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1010	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1011	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1012	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1013	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
1014	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1015	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1016	vinilo	H	s-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
1017	vinilo	H	s-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1018	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1019	vinilo	H	i-Bu	H	Ph	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1020	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1021	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1022	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
1023	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1024	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1025	vinilo	H	i-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5- ilo
1026	vinilo	H	i-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1027	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	Ph
1028	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1029	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1030	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄

1031	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1032	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	4-t-BuC ₆ H ₄
1033	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1034	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1035	vinilo	H	t-Bu	H	H	H	H	isotiazol-5-ilo
1036	vinilo	H	t-Bu	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1037	vinilo	H	Ph	H	H	H	H	Ph
1038	vinilo	H	Ph	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1039	vinilo	H	Ph	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1040	vinilo	H	Ph	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1041	vinilo	H	Ph	H	H	H	H	4-EtC ₆ H ₄
1042	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	Me	H	H	H	H	Ph
1043	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	Me	H	H	H	H	2-BrC ₆ H ₄
1044	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	Me	H	H	H	H	3-BrC ₆ H ₄
1045	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	Me	H	H	H	H	4-BrC ₆ H ₄
1046	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1047	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1048	4-	H	i-Pr	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄

	MeC6H4C H2							
1049	4- MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC6H4
1050	4- MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
1051	4- MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-EtC6H4
1052	4- MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1053	4- MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	2-FC6H4
1054	4- MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	3-FC6H4
1055	4- MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	4-FC6H4
1056	4- MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC6H4
1057	4- MeC6H4C H2	H	Me	H	H	H	H	Ph
1058	4- MeC6H4C	H	Me	H	H	H	H	4-ClC6H4

	H2							
1059	4-MeC6H4C H2	H	Me	H	H	H	H	4-MeC6H4
1060	4-MeC6H4C H2	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1061	4-MeC6H4C H2	H	Me	H	H	H	H	piridin-3-ilo
1062	4-MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1063	4-MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC6H4
1064	4-MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl2C6H3
1065	4-MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC6H4
1066	4-MeC6H4C H2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC6H4
1067	4-MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1068	4-MeC6H4C H2	H	i-Bu	H	H	H	H	2-MeC6H4

1069	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-MeC ₆ H ₄
1070	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1071	4-MeC ₆ H ₄ C H ₂	H	i-Bu	Me	H	H	H	1-Naf
1072	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	Ph
1073	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1074	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1075	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1076	PhCH(CH ₃)	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1077	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1078	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1079	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1080	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1081	PhCH(CH ₃)	H	i-Pr	Me	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1082	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph

1083	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1084	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1085	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1086	PhCH(CH ₃)	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1087	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	Ph
1088	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1089	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1090	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1091	PhCH(i-Pr)	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1092	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1093	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1094	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1095	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1096	PhCH(i-Pr)	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1097	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1098	PhCH(i-Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄

	Pr)							
1099	PhCH(i- Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1100	PhCH(i- Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1101	PhCH(i- Pr)	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1102	PhCH(CH 3)2	H	Me	H	H	H	H	Ph
1103	PhCH(CH 3)2	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1104	PhCH(CH 3)2	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1105	PhCH(CH 3)2	H	Me	H	H	H	H	furan-2-ilo
1106	PhCH(CH 3)2	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1107	PhCH(CH 3)2	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1108	PhCH(CH 3)2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1109	PhCH(CH 3)2	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1110	PhCH(CH 3)2	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1111	PhCH(CH 3)2	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1112	PhCH(CH 3)2	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1113	PhCH(CH 3)2	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄

1114	PhCH(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1115	PhCH(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1116	PhCH(CH ₃) ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
1117	2-furilmetilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1118	2-furilmetilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1119	2-furilmetilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1120	2-furilmetilo	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1121	2-furilmetilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1122	2-furilmetilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1123	2-furilmetilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1124	2-furilmetilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1125	2-	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄

	furilme tilo							
1126	2- furilme tilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1127	2- furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1128	2- furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1129	2- furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1130	2- furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1131	2- furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1132	3- furilme tilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1133	3- furilme tilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1134	3- furilme tilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1135	3- furilme	H	Me	H	H	H	H	furan-2-ilo

	tilo							
1136	3-furilme tilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1137	3-furilme tilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1138	3-furilme tilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1139	3-furilme tilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1140	3-furilme tilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1141	3-furilme tilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1142	3-furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1143	3-furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1144	3-furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1145	3-furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

1146	3- furilme tilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
1147	2- tetrahi drofil metilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1148	2- tetrahi drofil metilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1149	2- tetrahi drofil metilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1150	2- tetrahi drofil metilo	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1151	2- tetrahi drofil metilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1152	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1153	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

1154	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1155	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1156	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1157	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1158	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1159	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1160	2- tetrahi drofil metilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1161	2- tetrahi drofil	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf

	metilo							
1162	2-tienilm etilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1163	2-tienilm etilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1164	2-tienilm etilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1165	2-tienilm etilo	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1166	2-tienilm etilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1167	2-tienilm etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1168	2-tienilm etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1169	2-tienilm etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1170	2-tienilm etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1171	2-tienilm etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

212
212

1172	2-tienilm etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1173	2-tienilm etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1174	2-tienilm etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1175	2-tienilm etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1176	2-tienilm etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1177	ciclopr opilmet ilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1178	ciclopr opilmet ilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1179	ciclopr opilmet ilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1180	ciclopr opilmet ilo	H	Me	H	H	H	H	furan-2-ilo
1181	ciclopr opilmet ilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1182	ciclopr	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph

	opilmet ilo							
1183	ciclopr opilmet ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1184	ciclopr opilmet ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1185	ciclopr opilmet ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1186	ciclopr opilmet ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1187	ciclopr opilmet ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1188	ciclopr opilmet ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1189	ciclopr opilmet ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1190	ciclopr opilmet ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1191	ciclopr opilmet ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
1192	neopent ilo	H	Me	H	H	H	H	Ph

1193	neopent ilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1194	neopent ilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1195	neopent ilo	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1196	neopent ilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1197	neopent ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1198	neopent ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1199	neopent ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1200	neopent ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1201	neopent ilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1202	neopent ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1203	neopent ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1204	neopent ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1205	neopent ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1206	neopent ilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1207	metalil o	H	Me	H	H	H	H	Ph
1208	metalil	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

	o							
1209	metalil o	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1210	metalil o	H	Me	H	H	H	H	furan-2-ilo
1211	metalil o	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1212	metalil o	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1213	metalil o	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1214	metalil o	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1215	metalil o	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1216	metalil o	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1217	metalil o	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1218	metalil o	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1219	metalil o	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1220	metalil o	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1221	metalil o	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
1222	1,2- dimetil propilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1223	1,2-	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

	dimetil propilo							
1224	1,2- dimetil propilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1225	1,2- dimetil propilo	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1226	1,2- dimetil propilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1227	1,2- dimetil propilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1228	1,2- dimetil propilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1229	1,2- dimetil propilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1230	1,2- dimetil propilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1231	1,2- dimetil propilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1232	1,2- dimetil propilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1233	1,2- dimetil	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄

	propilo							
1234	1,2-dimetil propilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1235	1,2-dimetil propilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1236	1,2-dimetil propilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1237	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	Ph
1238	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1239	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1240	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	furan-2-ilo
1241	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1242	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1243	4-MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

1244	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1245	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1246	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1247	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1248	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1249	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1250	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1251	4- MeOC ₆ H ₄ CH ₂	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
1252	2- (metilt io)etil o	H	Me	H	H	H	H	Ph
1253	2- (metilt io)etil	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄

	o							
1254	2- (metilt io)etil o	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1255	2- (metilt io)etil o	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1256	2- (metilt io)etil o	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1257	2- (metilt io)etil o	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1258	2- (metilt io)etil o	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1259	2- (metilt io)etil o	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1260	2- (metilt io)etil o	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1261	2- (metilt	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

	io)etil o							
1262	2- (metilt io)etil o	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1263	2- (metilt io)etil o	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1264	2- (metilt io)etil o	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1265	2- (metilt io)etil o	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1266	2- (metilt io)etil o	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf
1267	2- (metano sulfoni l)etilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1268	2- (metano sulfoni l)etilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1269	2-	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

221

	(metano sulfoni l)etilo							
1270	2- (metano sulfoni l)etilo	H	Me	H	H	H	H	furan-2-ilo
1271	2- (metano sulfoni l)etilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-4-ilo
1272	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1273	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1274	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1275	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1276	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄

1277	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	Ph
1278	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1279	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1280	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1281	2- (metano sulfoni l)etilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-Naf
1282	2- tienilo	H	Me	H	H	H	H	Ph
1283	2- tienilo	H	Me	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1284	2- tienilo	H	Me	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1285	2- tienilo	H	Me	H	H	H	H	tiofen-2-ilo
1286	2- tienilo	H	Me	H	H	H	H	piridin-2-ilo
1287	2-	H	Me	H	H	H	H	Ph

	tienilo							
1288	2-tienilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1289	2-tienilo	H	i-Pr	H	H	H	H	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃
1290	2-tienilo	H	i-Pr	H	H	H	H	2-MeC ₆ H ₄
1291	2-tienilo	H	i-Pr	H	H	H	H	4-MeC ₆ H ₄
1292	2-tienilo	H	i-Pr	H	H	H	H	Ph
1293	2-tienilo	H	i-Bu	H	H	H	H	2-ClC ₆ H ₄
1294	2-tienilo	H	i-Bu	H	H	H	H	3-ClC ₆ H ₄
1295	2-tienilo	H	i-Bu	H	H	H	H	4-ClC ₆ H ₄
1296	2-tienilo	H	i-Bu	H	H	H	H	1-Naf

Tabla 2-1: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
4	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.15 (3H, d, J=6.1 Hz), 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.41 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.74 (2H, d, J=8.1 Hz).
26	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=8.1 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.39-7.49 (3H, m), 7.79 (2H, d, J=7.1 Hz).
30	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=8.1 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
66	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 3.46-3.61 (2H, m), 3.63 (3H, s), 3.66-3.72 (1H, m), 4.86 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.23-7.41 (5H, m), 7.39-7.49 (3H, m), 7.79 (2H, d, J=7.1 Hz).
215	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.14 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.24 (3H, d, J=6.8 Hz), 2.39 (3H, s), 3.46-3.53 (2H, m), 3.66-3.99 (1H, m), 4.79 (1H, br-s), 4.84-4.91 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
216	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.14 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.24 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.32 (9H, s), 3.46-3.53 (2H, m), 3.66-3.99 (1H, m), 4.79 (1H, br-s), 4.84-4.91 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
236	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.46-3.61 (2H, m), 3.66-3.74 (1H, m), 4.12 (1H, d, J=7.3 Hz), 4.73-4.89 (1H, m), 7.06 (1H, br-s), 7.40-7.50 (3H, m), 7.80 (2H, d, J=7.1 Hz).
237	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=8.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=8.8 Hz), 1.11 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.23 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 3.50-3.54 (2H, m), 3.67-3.73 (1H, m), 4.73 (1H, d, J=8.8 Hz), 4.83-4.90 (1H, m), 7.21 (1H, br-s), 7.40 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.75 (2H, d, J=8.5 Hz).
238	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (6H, t, J=8.8 Hz), 1.14 (3H, d, J=8.3 Hz), 1.24 (3H, d, J=8.3 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 3.50-3.53 (2H, m), 3.67-3.72 (1H, m), 4.75 (1H, d, J=8.3 Hz), 4.86-4.92 (1H, m), 7.35 (1H, br-s), 7.50 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.82 (1H, d, J=8.3 Hz), 7.94 (1H, s).
239	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=8.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=8.8 Hz), 1.17 (3H, d, J=8.3 Hz), 1.21 (3H, d, J=8.3 Hz), 1.83-1.88 (1H, m), 2.44 (3H, s), 3.41-3.47 (1H, m), 3.56-3.70 (2H, m), 4.77 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.82-4.88 (1H, m), 6.29 (1H, br-s), 7.16-7.35 (4H, m).

Tabla 2-2: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
240	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=7.3 Hz), 1.01 (3H, d, J=7.3 Hz), 1.10 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.21 (3H, d, J=8.1 Hz), 1.84-1.88 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.47-3.60 (2H, m), 3.67-3.73 (1H, m), 4.75 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.83-4.89 (1H, m), 6.99 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.1 Hz).
241	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.3 Hz), 1.09 (3H, d, J=8.2 Hz), 1.21-1.26 (6H, m), 1.82-1.90 (1H, m), 2.68 (2H, q, J=7.6 Hz), 3.46-3.62 (2H, m), 3.69-3.76 (1H, m), 4.74 (1H, d, J=8.8 Hz), 4.87-4.90 (1H, m), 6.99 (1H, d, J=8.1 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.72 (2H, d, J=8.5 Hz).
242	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.03 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.09 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.87-1.92 (1H, m), 3.54-3.67 (2H, m), 3.74-3.78 (1H, m), 4.77 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.86-4.92 (1H, m), 7.23 (1H, br-s), 7.51-7.58 (2H, m), 7.86-7.94 (4H, m), 8.34 (1H, s).
243	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.97-1.00 (6H, m), 1.11 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.22 (3H, d, J=6.3 Hz), 1.80-1.90 (1H, m), 2.50 (3H, s), 3.44-3.57 (2H, m), 3.66-3.73 (1H, m), 4.76 (1H, d, J=8.5 Hz), 4.87-4.90 (1H, m), 6.71 (1H, d, J=3.7 Hz), 6.87 (1H, br-s), 7.30 (1H, d, J=3.7 Hz).
245	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.93 (3H, d, J=7.1 Hz), 0.95 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.15 (3H, s), 1.23 (6H, d, J=6.3 Hz), 2.35-2.40 (4H, m), 3.60 (1H, dd, J=5.1 Hz, 14.2 Hz), 3.82 (1H, dd, J=5.9 Hz, 14.2 Hz), 4.72 (1H, br-s), 4.87-4.93 (1H, m), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.76 (2H, d, J=8.1 Hz).
246	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.03 (6H, m), 1.17 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.26 (6H, d, J=6.3 Hz), 1.65-1.69 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.51-3.56 (1H, m), 4.33-4.37 (1H, m), 4.56 (1H, d, J=8.0 Hz), 4.82-5.00 (1H, m), 7.23 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.30 (1H, br-s), 7.72 (2H, d, J=8.3 Hz).
247	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99-1.03 (6H, m), 1.18 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.26 (6H, d, J=6.3 Hz), 1.62-1.67 (1H, m), 3.50-3.54 (1H, m), 4.33-4.35 (1H, m), 4.53 (1H, d, J=8.0 Hz), 4.91-4.98 (1H, m), 7.22 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.31 (1H, br-s), 7.74 (2H, d, J=8.3 Hz).
279	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.15-1.26 (6H, m), 2.40 (3H, s), 3.25-3.30 (1H, m), 3.42-3.50 (1H, m), 4.82-4.90 (1H, m), 4.92-4.98 (1H, m), 5.60 (1H, d, J=7.1 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.22-7.40 (7H, m), 7.67 (2H, d, J=7.8 Hz).
284	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.13-1.19 (6H, m), 2.40 (3H, m), 3.70-3.80 (2H, m), 4.82-4.92 (2H, m), 5.80 (1H, d, J=7.1 Hz), 6.85 (1H, br-s), 7.21-7.29 (4H, m), 7.34 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz). M ⁺ : 375.

Tabla 2-3: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
289	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.12 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.18 (3H, d, J=6.1 Hz), 2.38 (3H, s), 2.80-2.86 (1H, m), 2.92-2.98 (1H, m), 3.49-3.56 (2H, m), 4.07-4.15 (1H, m), 4.81-4.88 (1H, m), 4.95 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.88 (1H, br-s), 7.20-7.27 (5H, m), 7.31 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
290	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.12 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.18 (3H, d, J=6.1 Hz), 1.20-1.25 (3H, m), 2.67 (2H, q, J=7.8 Hz), 2.80-2.86 (1H, m), 2.92-2.98 (1H, m), 3.49-3.56 (2H, m), 4.07-4.15 (1H, m), 4.81-4.88 (1H, m), 4.95 (1H, d, J=7.3 Hz), 6.88 (1H, br-s), 7.20-7.27 (5H, m), 7.31 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
384	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.85 (3H, d, J=6.6 Hz), 0.86 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (6H, t, J=6.6 Hz), 1.79-1.89 (1H, m), 3.47-3.71 (3H, m), 3.80 (2H, d, J=6.8 Hz), 4.82 (1H, d, J=8.3 Hz), 6.92 (br-s), 7.41 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.76 (2H, d, J=8.3 Hz).
387	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.84 (3H, d, J=6.8 Hz), 0.85 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.06 (6H, d, J=6.8 Hz), 1.63-1.89 (2H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.74 (3H, m), 3.80 (2H, d, J=6.6 Hz), 4.82 (1H, d, J=8.8 Hz), 6.92 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.68 (2H, d, J=7.8 Hz).
484	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=6.8 Hz), 1.39 (9H, s), 1.82-1.87 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.46-3.53 (2H, m), 3.65-3.89 (1H, m), 4.65 (1H, d, J=8.5 Hz), 7.04 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
489	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.92 (3H, d, J=6.8 Hz), 0.94 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.13 (3H, s), 2.37-2.41 (4H, m), 3.57 (1H, dd, J=5.6 Hz, 13.7 Hz), 3.81 (1H, dd, J=5.6 Hz, 13.7 Hz), 4.82 (1H, br-s), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.77 (2H, d, J=8.1 Hz), 8.17 (1H, br-s).
470	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.03 (6H, m), 1.17 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.49 (9H, s), 1.58-1.67 (1H, m), 3.47-3.53 (1H, m), 4.33-4.35 (1H, m), 4.51 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.23 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.38 (1H, br-s), 7.73 (2H, d, J=8.3 Hz).
471	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00-1.03 (6H, m), 1.16 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.49 (9H, s), 1.59-1.68 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.46-3.52 (1H, m), 4.33-4.35 (1H, m), 4.51 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.21 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.36 (1H, br-s), 7.72 (2H, d, J=8.3 Hz).
504	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.40 (9H, s), 2.40 (3H, s), 3.25-3.30 (1H, m), 3.42-3.50 (1H, m), 4.82-4.90 (1H, m), 5.60 (1H, d, J=7.1 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.22-7.40 (7H, m), 7.67 (2H, d, J=7.8 Hz).

Tabla 2-4: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
526	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.05 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.07 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.91-1.96 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.47-3.50 (1H, m), 3.74-3.78 (2H, m), 5.28 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.76 (1H, br-s), 7.15-7.31 (5H, m), 7.40-7.50 (3H, m), 7.80 (2H, d, J=7.3 Hz).
530	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.05 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.07 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.91-1.96 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.47-3.50 (1H, m), 3.74-3.78 (2H, m), 5.28 (1H, d, J=7.6 Hz), 6.76 (1H, br-s), 6.95 (2H, d, J=8.3 Hz), 7.15-7.31 (5H, m), 7.68 (2H, d, J=8.3 Hz).
596	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.62 (2H, m), 3.69-3.74 (1H, m), 4.94 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.06 (2H, d, J=7.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.20-7.30 (7H, m), 7.41-7.51 (3H, m), 7.79 (2H, d, J=7.1 Hz).
600	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.62 (2H, m), 3.69-3.74 (1H, m), 4.94 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.06 (2H, d, J=7.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.20-7.30 (7H, m), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
636	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 3.48-3.62 (2H, m), 3.69-3.74 (1H, m), 4.94 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.06 (2H, d, J=7.1 Hz), 6.86 (1H, br-s), 7.20-7.40 (14H, m), 7.82 (2H, d, J=7.1 Hz).
674	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.10 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.12 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.94-2.01 (1H, m), 3.50-3.55 (1H, m), 3.80-3.84 (2H, m), 5.31 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.78 (1H, br-s), 7.10 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.21 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.37 (1H, s), 7.41-7.56 (2H, m), 7.80-7.90 (5H, m).
677	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.09 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.10 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.94-1.99 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.47-3.51 (1H, m), 3.80-3.84 (2H, m), 5.30 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.77 (1H, br-s), 7.10 (1H, d, J=8.8 Hz), 7.21 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.34 (1H, s), 7.41-7.54 (2H, m), 7.83-7.93 (5H, m).
739	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.3 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 3.48-3.74 (3H, m), 4.52 (2H, d, J=5.6 Hz), 4.93 (1H, d, J=8.3 Hz), 5.14 (1H, d, J=10.5 Hz), 5.25 (1H, d, J=17.1 Hz), 4.79-5.88 (1H, m), 6.88 (1H, br-s), 7.39 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.73 (2H, d, J=8.1 Hz).
742	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.3 Hz), 1.85-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.74 (3H, m), 4.52 (2H, d, J=5.6 Hz), 4.93 (1H, d, J=8.3 Hz), 5.14 (1H, d, J=10.5 Hz), 5.25 (1H, d, J=17.1 Hz), 4.79-5.88 (1H, m), 6.88 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).

Tabla 2-5: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
804	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.8 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.36 (1H, s), 3.47-3.74 (3H, m), 4.63 (2H, s), 5.01 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.79 (1H, br-s), 7.38 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.73 (2H, d, J=8.1 Hz).
807	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.8 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.36 (1H, s), 2.39 (3H, s), 3.47-3.74 (3H, m), 4.63 (2H, s), 5.01 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.79 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1048	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.00 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 2.31 (3H, s), 3.49-3.57 (2H, m), 3.69-3.75 (1H, m), 4.92 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.00 (1H, d, J=12.2 Hz), 5.05 (1H, d, J=12.2 Hz), 7.00 (1H, br-s), 7.07 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.16 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=7.8 Hz).
1050	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.00 (3H, d, J=7.1 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 2.31 (3H, s), 2.40 (3H, s), 3.49-3.57 (2H, m), 3.69-3.75 (1H, m), 4.92 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.00 (1H, d, J=12.2 Hz), 5.05 (1H, d, J=12.2 Hz), 7.00 (1H, br-s), 7.07 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.16 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.8 Hz).
1063	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 3.43-3.47 (1H, m), 3.62-3.73 (2H, m), 4.94 (1H, d, J=12.4 Hz), 4.95 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.06 (1H, d, J=12.4 Hz), 6.73 (1H, br-s), 7.17-7.22 (6H, m), 7.59 (2H, d, J=8.1 Hz).
1066	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 2.41 (3H, s), 3.43-3.47 (1H, m), 3.62-3.73 (2H, m), 4.94 (1H, d, J=12.4 Hz), 4.95 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.06 (1H, d, J=12.4 Hz), 6.73 (1H, br-s), 7.17-7.22 (6H, m), 7.61 (2H, d, J=8.1 Hz).
1078	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95-1.02 (6H, m), 1.39 (3 x 1/2H, d, J=8.6 Hz), 1.51 (3H x 1/2, d, J=8.6 Hz), 1.80-1.88 (1H, m), 3.40-3.64 (3H, m), 4.90 (1H x 1/2, d, J=8.5 Hz), 4.96 (1H x 1/2, d, J=9.0 Hz), 5.70-5.77 (1H, m), 6.71 (1H x 1/2, br-s), 6.78 (1H x 1/2, br-s), 7.09-7.36 (6H, m), 7.45 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz), 7.69 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz).
1081	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.95-1.02 (6H, m), 1.39 (3H x 1/2, d, J=8.6 Hz), 1.51 (3H x 1/2, d, J=8.6 Hz), 1.80-1.88 (1H, m), 2.37 (3H x 1/2, s), 2.40 (3H x 1/2, s), 3.40-3.64 (3H, m), 4.90 (1H x 1/2, d, J=8.5 Hz), 4.96 (1H x 1/2, d, J=9.0 Hz), 5.70-5.77 (1H, m), 6.71 (1H x 1/2, br-s), 6.78 (1H x 1/2, br-s), 7.09-7.36 (6H, m), 7.47 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz), 7.71 (2H x 1/2, d, J=8.3 Hz).

Tabla 2-6: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
1123	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.51-3.54 (2H, m), 3.72-3.76 (1H, m), 4.90 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.02 (2H, d, J=4.9 Hz), 6.29 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.31 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.85 (1H, br-s), 7.20 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.33 (1H, s), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
1126	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.51-3.54 (2H, m), 3.70-3.76 (1H, m), 4.90 (1H, d, J=9.0 Hz), 5.02 (2H, d, J=4.9 Hz), 6.29 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.33 (1H, d, J=3.2 Hz), 6.87 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.33 (1H, s), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
1138	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 3.48-3.61 (2H, m), 3.68-3.73 (1H, m), 4.88 (1H, d, J=6.8 Hz), 4.92 (2H, s), 6.34 (1H, s), 6.80 (1H, br-s), 7.20 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.29 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.41 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.63 (2H, d, J=7.8 Hz).
1141	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.84-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.48-3.61 (2H, m), 3.68-3.73 (1H, m), 4.88 (1H, d, J=6.8 Hz), 4.92 (2H, s), 6.33 (1H, s), 6.83 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.31 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.39 (1H, d, J=2.0 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.8 Hz).
1153	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.49-1.56 (1H, m), 1.81-1.95 (4H, m), 3.51-3.54 (2H, m), 3.65-4.16 (6H, m), 4.95 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.91 (1H, br-s), 7.24 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.70 (2H, d, J=8.1 Hz).
1156	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.49-1.56 (1H, m), 1.81-1.95 (4H, m), 2.39 (3H, s), 3.51-3.55 (2H, m), 3.67-4.16 (6H, m), 4.95 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.93 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1168	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 3.51-3.56 (2H, m), 3.70-3.75 (1H, m), 4.91 (1H, d, J=8.8 Hz), 5.19 (1H, d, J=12.7 Hz), 5.22 (1H, d, J=12.7 Hz), 6.83 (1H, br-s), 6.91 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.01 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.21-7.25 (3H, m), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).

Tabla 2-7: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
1171	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.98 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.00 (3H, d, J=6.8 Hz), 1.85-1.89 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.51-3.56 (2H, m), 3.70-3.75 (1H, m), 4.92 (1H, d, J=6.8 Hz), 5.19 (1H, d, J=12.7 Hz), 5.22 (1H, d, J=12.7 Hz), 6.85 (1H, br-s), 6.91 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.01 (1H, dd, J=1.7 Hz, 3.4 Hz), 7.21-7.24 (3H, m), 7.66 (2H, d, J=8.1 Hz).
1183	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.19-0.23 (2H, m), 0.45-0.50 (2H, m), 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.86-1.93 (1H, m), 3.48-3.64 (2H, m), 3.67-3.75 (1H, m), 3.85 (2H, d, J=7.3 Hz), 4.87 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.96 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.69 (2H, d, J=8.5 Hz).
1186	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.19-0.23 (2H, m), 0.45-0.49 (2H, m), 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.86-1.93 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.48-3.62 (2H, m), 3.67-3.75 (1H, m), 3.84 (2H, d, J=7.3 Hz), 4.86 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.96 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.5 Hz).
1198	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.86 (9H, s), 1.03 (6H, t, J=5.6 Hz), 1.86-1.90 (1H, m), 3.48-3.68 (2H, m), 3.70-3.75 (3H, m), 4.84 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.92 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.20 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.65 (2H, d, J=8.1 Hz).
1201	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.86 (9H, s), 1.01 (6H, t, J=5.6 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.48-3.68 (2H, m), 3.70-3.76 (3H, m), 4.84 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.94 (1H, d, J=8.6 Hz), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
1213	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.03 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.88 (3H, s), 1.84-1.90 (1H, m), 3.46-3.75 (3H, m), 4.45 (2H, s), 4.83 (1H, s), 4.90-4.95 (2H, m), 6.87 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1216	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.01 (6H, t, J=7.1 Hz), 1.67 (3H, s), 1.84-1.90 (1H, m), 2.39 (3H, s), 3.46-3.75 (3H, m), 4.44 (2H, s), 4.83 (1H, s), 4.90-4.94 (2H, m), 6.87 (1H, br-s), 7.21 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
1228	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.75 (3H, d, J=6.6 Hz), 0.90 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (6H + 3H x 1/2, t, J=6.6 Hz), 1.13 (3H x 1/2, d, J=6.6 Hz), 1.82-1.91 (1H, m), 3.45-3.65 (2H, m), 3.69-3.77 (1H, m), 4.56-4.61 (1H, m), 4.75 (1H, t, J=8.1 Hz), 6.94 (1H, d, J=8.0 Hz), 7.20-7.24 (2H, m), 7.68 (2H, t, J=7.6 Hz).

240
231

Tabla 2-8: Datos Analíticos

Comp. No.	Datos Analíticos
1231	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.75 (3H, d, J=6.6 Hz), 0.89 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (6H + 3H x 1/2, t, J=6.6 Hz), 1.14 (3H x 1/2, d, J=6.6 Hz), 1.82-1.91 (1H, m), 2.38 (3H, s), 3.45-3.65 (2H, m), 3.69-3.76 (1H, m), 4.56-4.62 (1H, m), 4.75 (1H, t, J=8.1 Hz), 6.95 (1H, d, J=9.0 Hz), 7.20-7.23 (2H, m), 7.68 (2H, t, J=7.6 Hz).
1258	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.6 Hz), 1.86-1.92 (1H, m), 2.05 (3H, s), 2.62 (2H, t, J=6.8 Hz), 3.47-3.73 (3H, m), 4.15-4.24 (2H, m), 4.89 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.84 (1H, br-s), 7.22 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.67 (2H, d, J=8.1 Hz).
1261	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 1.00 (6H, t, J=7.6 Hz), 1.86-1.91 (1H, m), 2.07 (3H, s), 2.39 (3H, s), 2.62 (2H, t, J=6.8 Hz), 3.47-3.72 (3H, m), 4.15-4.23 (2H, m), 4.89 (1H, d, J=8.5 Hz), 6.81 (1H, br-s), 7.23 (2H, d, J=8.1 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.1 Hz).
1273	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.88 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.02 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 2.40 (3H, s), 3.13-3.18 (2H, m), 3.41-3.45 (1H, m), 3.66-3.70 (2H, m), 4.34-4.40 (1H, m), 4.49-4.54 (1H, m), 5.20 (1H, d, J=8.1 Hz), 6.64 (1H, br-s), 7.26 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.65 (2H, d, J=7.8 Hz).
1276	¹ H NMR (CDCl ₃ , ppm): 0.99 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.01 (3H, d, J=6.6 Hz), 1.83-1.90 (1H, m), 2.40 (3H, s), 2.81 (3H, s), 3.13-3.18 (2H, m), 3.41-3.45 (1H, m), 3.66-3.70 (2H, m), 4.34-4.40 (1H, m), 4.49-4.55 (1H, m), 5.19 (1H, d, J=8.1 Hz), 6.66 (1H, br-s), 7.24 (2H, d, J=7.8 Hz), 7.66 (2H, d, J=7.8 Hz).

Ejemplos de Formulaciones y Ensayos

Los ejemplos de las formulaciones y los ensayos de actividad de los fungicidas de acuerdo con la invención serán mostrados adelante. En los siguientes ejemplos, el termino "parte" en lo sucesivo utilizado significa "parte en peso" o "% del peso".

Ejemplo de gránulos de la formulación 1

Treinta partes del compuesto de la invención (30), 22 partes de la bentonita, 45 partes de talco, 3 partes de Sorpol 5060 (tensoactivo: Toho Chemical Industry Co., Ltd., nombre de marca) y una pequeña cantidad de antiespumante fue amasada uniformemente, granulada con una máquina granulante de canasta, y secada para obtener 100 partes de gránulos.

Ejemplo de los gránulos de Formulación 2

Quince partes del compuesto de la invención (141), 60 partes de bentonita, 21 partes de talco, 1 parte de un dodecil bencenosulfonato de sodio, una parte de polioxietileno alquilaliléter y dos partes de

ligninsulfonato de sodio se mezclaron, se amasaron uniformemente con la adición de una cantidad adecuada de agua, se granularon con una máquina granulante de canasta, y se secaron para obtener 100 partes de gránulos.

Ejemplo de la formulación 3: polvo humectable

Cincuenta partes del compuesto de la invención (290), 40 partes de carbonato de calcio, 5 partes de Sorpol 5039 (una mezcla de tensoactivo aniónico y carbono blanco: Toho Chemical Industry Co., Ltd., nombre de marca) y cinco partes de carbón blanco fueron mezclados y molidos uniformemente para obtener un polvo humectable.

Ejemplo del polvo humectable de la formulación 4

Treinta partes del compuesto de la invención (526), 63 partes de caolinita, 5 partes de Sorpol 5039 (una mezcla de tensoactivo aniónico y carbono blanco: Toho Chemical Industry Co., Ltd., nombre de marca) y dos partes de carbono blanco fueron mezclados y molidos uniformemente para obtener el polvo humectable.

Ejemplo de la emulsión de la Formulación 5

Veinte partes del compuesto de la invención (674), 54 partes de xileno, 20 partes de N,N-dimetilformamida y 5 partes de Sorpol 2680 (tensoactivo) se mezclaron uniformemente para obtener un concentrado en emulsión.

Ejemplo fluible de la Formulación 6

De todos los ingredientes de 40 partes del compuesto de la invención (742), 5 partes de Sorpol 3353 (un tensoactivo no iónico: Toho Chemical Industry Co., Ltd., nombre de marca), 5 partes de solución acuosa al 1% de goma xantano, 40 partes de agua y 10 partes de etilenglicol, aquellos excepto el ingrediente activo se disolvieron uniformemente, y luego el compuesto de la invención se agregó. Después de agitación completa, la mezcla fue molida en húmedo con un molino de arena para obtener un fluible.

Ejemplo del Polvo de la Formulación 7

Cinco partes del compuesto de la invención (807) y 95 partes de arcilla se mezclaron para obtener polvo.

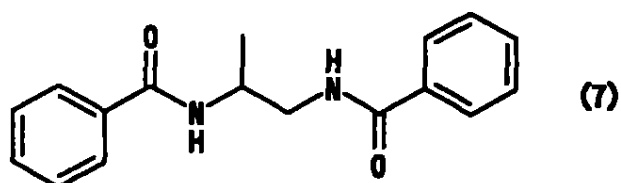
Ejemplo de Ensayo 1: ensayo del efecto de control de ráfaga de arroz (ensayo de aplicación de pulverizado) una solución diluida de un polvo humectable preparado a 500 ppm de acuerdo con la formulación del ejemplo 4 se aplicó a una olla de arroz (variedad: Koshihikari; etapa de dos hojas) y secado al aire. La planta fue puesta en una habitación con clima artificial (condiciones establecidas: 22° C, ciclo de luz oscuridad de 12 horas) e inoculado por pulverizado con una suspensión de esporas de *Pyricularia oryzae*. El cuarto con temperatura artificial fue mantenido con alta humedad, y la planta se examinó después de 7 días. El valor preventivo se calculó mediante la siguiente ecuación y el efecto de control se evaluó con base en los criterios mostrados en la tabla siguiente. Los resultados se muestran en la tabla 3.

Valor preventivo (%) = $(1 - \frac{\text{el número de lesiones en el área de terreno tratado}}{\text{número de lesiones en área no tratada}}) \times 100$

Efecto	Valor preventivo
A	100%
B	80% o más y menos del 100%
C	50% o más y menos del 80%
D	menos del 50%

Como un control, se utilizaron los siguientes químicos.

Formulación general (7):



Formulación general (8):

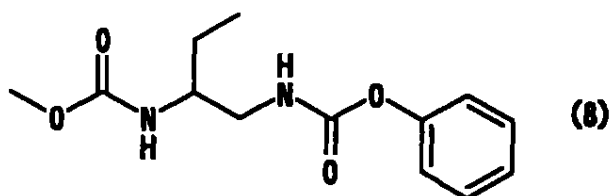


Tabla 3-1: Ensayo del Efecto de control de ráfaga de
arroz (ensayo de aplicación de pulverizado)

Comp. No.	Grado de Efecto
4	A
26	A
30	A
66	A
215	A
216	A
236	A
237	A
238	A
239	A
240	A
241	A
242	A
243	A
245	A
246	A
247	A
279	A
284	A
289	A
290	A
384	A
387	A
464	B
469	B

470	A
471	A
504	B
526	A
530	A
596	A
600	A
636	A
674	A
677	A
739	A
742	A
804	A
807	A
1049	A
1050	A
1063	A
1066	A
1078	A
1081	A
1123	A
1126	A
1138	A
1141	A
1153	A
1156	A
1168	A
1171	A
1183	A
1186	A
1198	A

1201	A
1213	A
1216	A
1228	A
1231	A
1258	A
1261	A
1273	A
1276	A
Fórmula (7)	D
Fórmula (8)	D

Ejemplo de Ensayo 2: Ensayo de efecto de control de ráfaga de arroz (Aplicación a superficie de agua)

Plántulas de arroz (variedad: Koshihikari; etapa de 3 hojas) se plantaron en 1/5000 son ollas Wagner y crecieron durante una semana en un invernadero. Los gránulos preparados de acuerdo con la formulación del ejemplo 2 se aplicaron a la superficie del agua en cada olla a una proporción de 3 kg/10 acres. Después de 30 días de aplicación, una suspensión de líquido de esporas de *Pyricularia oryzae* se rociaron directamente a las plantas de arroz. Las plantas de arroz fueron ubicadas bajo condiciones de 25° C y alta humedad durante una

semana, y el número de lesiones se revisó. El valor preventivo se calculó por medio de la siguiente ecuación y el efecto de control se evaluó con base en el siguiente estándar. Los resultados son mostrados en la tabla 4. como control, se utilizó el mismo químico que en el ejemplo de ensayo 1.

Valor preventivo (%) = $(1 - \frac{\text{el número de lesiones en la gráfica tratada}}{\text{el número de lesiones en la gráfica no tratada}}) \times 100$

Efecto	Valor preventivo
A	80% a 100%
B	50% o más y menos del 80%
C	menos del 50%

Tabla 4-1: Ensayo de efecto de control de ráfaga de arroz
(Aplicación a la superficie del agua)

Comp. No.	Grado de Efecto
4	A
26	A
30	A

241

66	A
215	A
216	A
236	A
237	A
238	A
239	A
240	A
241	A
242	A
243	A
245	A
246	A
247	A
279	A
284	A
289	A
290	A
384	A
387	A
464	B
469	B
470	A
471	A
504	B
526	A
530	A
596	A
600	A
636	A
674	A

677	A
739	A
742	A
804	A
807	A
1049	A
1050	A
1063	A
1066	A
1078	A
1081	A
1123	A
1126	A
1138	A
1141	A
1153	A
1156	A
1168	A
1171	A
1183	A
1186	A
1198	A
1201	A
1213	A
1216	A
1228	A
1231	A
1258	A
1261	A
1273	A
1276	A

Fórmula (7)	C
Fórmula (8)	C

Ejemplo de Ensayo 3: Ensayo de efecto de control de ráfaga de arroz (tratamiento de caja almácigo)

Plántulas de arroz (variedad: Koshihikari; etapa de 2 hojas) elevada en una caja de almácigo para arroz (30 cm x 60 cm x 3 cm) se trató con gránulos preparados de acuerdo con la formulación del ejemplo 1 en una cantidad de 50 g por caja. Después de tres días, las plántulas de arroz se transplantaron en un 1/5000 son Wagner en área y elevadas en un invernadero. Treinta días después del transplante, la planta fue inoculada por pulverización con una suspensión de esporas de *Pyricularia oryzae*, se le permitió permanecer bajo las condiciones de 25° C y alta humedad durante una semana, y el número de lesiones se revisó. El valor preventivo se calculó por medio de la siguiente ecuación y el efecto de control se evaluó con base en el mismo criterio que en el ejemplo de ensayo 2. Los resultados son mostrados en la tabla 5. Como control, se utilizó el mismo químico que en el ejemplo de ensayo 1.

Valor preventivo (%) = (1- el número de lesiones en el
área de terreno tratada/el número de lesiones en el área
de terreno no tratada) x 100

Tabla 5-1: Ensayo de efecto de control de ráfaga de arroz
(tratamiento de caja de almácigo)

Comp. No.	Grado de Efecto
4	A
26	A
30	A
66	A
215	A
216	A
236	A
237	A
238	A
239	A
240	A
241	A
242	A
243	A
245	A
246	A
247	A
279	A
284	A

289	A
290	A
384	A
387	A
464	B
469	B
470	A
471	A
504	B
526	A
530	A
596	A
600	A
636	A
674	A
677	A
739	A
742	A
804	A
807	A
1049	A
1050	A
1063	A
1066	A
1078	A
1081	A
1123	A
1126	A
1138	A
1141	A
1153	A

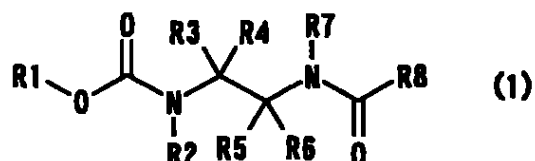
1156	A
1168	A
1171	A
1183	A
1186	A
1198	A
1201	A
1213	A
1216	A
1228	A
1231	A
1258	A
1261	A
1273	A
1276	A
Fórmula (7)	C
Fórmula (8)	C

Aplicabilidad Industrial

Los derivados de amina de acuerdo con esta invención exhiben un excelente efecto de control del tizón del arroz, pero, de otra parte, no daña cultivos útiles; por lo tanto, es muy útil como un fungicida agrícola y hortícola.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de diamina, representado por la fórmula general siguiente (1):



En donde

R1 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo el cual puede estar sustituido, un grupo heteroarilalquilo el cual puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido;

R2 y R7 representan independientemente un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo acilo;

R3 y R4 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido, o un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono incluyendo un carbón ligado;

R5 y R6 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo

alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido; siempre que en el caso sea excluido en donde R3, R4, R5 y R6 todos represente un átomo de Hidrógeno o en donde cualquiera de ellos entre R3, R4, R5 y R6 representen un grupo metilo el cual puede ser sustituido y los otros representen un átomo de Hidrógeno, y

R8 representa un grupo un grupo arilo que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido.

2. El derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

R1 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilaquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido;

R2 y R7 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido, o grupo acilo;

R3 y R4 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alqueno con 2 a 6 átomos de carbono, un arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido, o un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono que incluye un átomo de carbono ligado; y

R5 y R6 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido; siempre que el caso sea excluido en donde R3, R4, R5 y R6 todos representen un átomo de Hidrógeno o en donde cualquiera entre R3, R4, R5

257

y R6 representen un grupo metilo que puede ser sustituido y los otros representen un átomo de Hidrógeno.

3. El derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación 2, en donde

R2 y R7 representan independientemente un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o un grupo acilo;

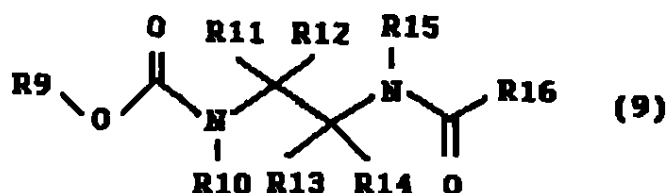
R3 y R4 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono incluyendo un átomo de carbono ligado; y

R5 y R6 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, o un grupo arilo que puede ser sustituido; siempre que el caso sea excluido en donde R3, R4, R5 y R6 todos representen un átomo de Hidrógeno o en donde uno cualquiera de R3, R4,

R5 y R6 representen un grupo metilo que puede ser sustituido y los otros representen un átomo de Hidrógeno.

4. El derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación 3, en donde R2 Y R7 representan un átomo de Hidrógeno.

5. Un derivado de diamina, representado por la fórmula general siguiente (9):



En donde R9 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, un grupo fenilo, un grupo fenilo que es sustituido en la cuarta

posición, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido;

R10 y R15 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquenilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo acilo;

Uno entre R11 y R12 representan un grupo metilo, y el otro representa un átomo de Hidrógeno;

R13 y R14 representan un átomo de Hidrógeno, respectivamente; y

R16 representa un grupo fenilo, un grupo fenilo que es sustituido en la cuarta posición o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido.

[6] El derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación 5, en donde

En donde R9 representa un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo heteroarilalquilo que puede ser sustituido, un grupo fenilo, un grupo fenilo que es sustituido en la cuarta posición, o un grupo heteroarilo que puede ser sustituido; y

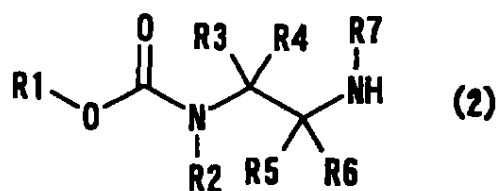
R10 y R15 representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, un grupo cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, un grupo alquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, un grupo arilalquilo que puede ser sustituido, un grupo arilo que puede ser sustituido, o un grupo acilo, independientemente.

7. El derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación 6, en donde R10 y R15 independientemente representan un átomo de Hidrógeno, un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, o un grupo acilo.

8. El derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación 7, en donde R10 y R15 representan un átomo de Hidrógeno, respectivamente.

9. Un fungicida, en donde este contiene el derivado de diamina de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 como un ingrediente activo.

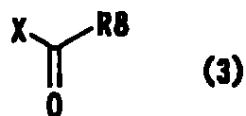
10. Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación anterior 1, en donde un compuesto que tiene la fórmula general es siguiente (2):



En donde

R1, R2, R3, R4, R5, R6 y R7 representan los mismos grupos de aquellos de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [1],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (3):

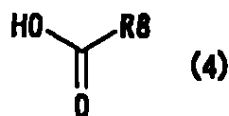


En donde

R8 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [1], y

X representa un grupo saliente.

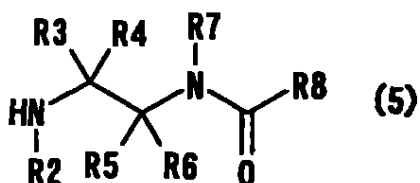
11. Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación anterior 1, en donde un compuesto de la fórmula general (2) es condensado con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (4):



En donde

R8 representa el mismo grupo de aquel de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [1].

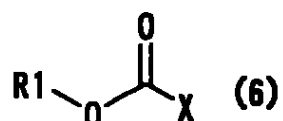
12. Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación anterior 1, en donde un compuesto que tiene la fórmula general siguiente (5):



En donde

R2, R3, R4, R5, R6, R7 y R8 representan los mismos grupos de aquellos del compuesto de acuerdo con la sección anterior [1],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (6):

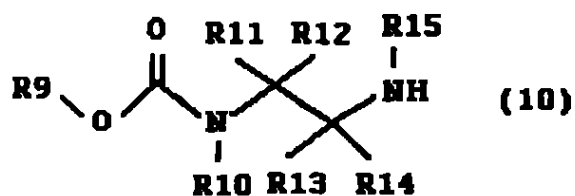


En donde

R1 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [1], y

X representa un grupo saliente.

13. Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación anterior 5, en donde un compuesto que tiene la fórmula general siguiente (10):



En donde

R9, R10, R11, R12, R13, R14 y R15 representan los mismos grupos de aquellos de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [5],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene las siguiente fórmula general (11):



En donde

R17 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [5], y

X representa un grupo saliente.

14. Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación anterior 5, en donde un

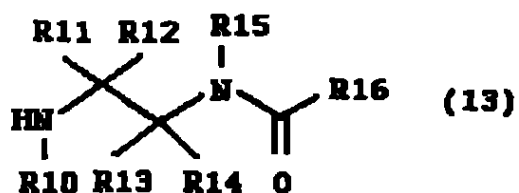
compuesto de fórmula general (10) es condensado con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (12):



En donde

R16 representa el mismo grupo de aquel de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [5].

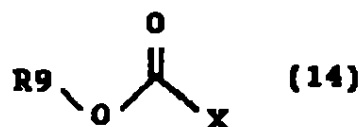
15. Un proceso para producir el derivado de diamina de acuerdo con la reivindicación anterior 5, en donde un compuesto tiene la fórmula general siguiente (13):



En donde

R10, R11, R12, R13, R14, R15 y R16 representan los mismos grupos de aquellos de los compuestos de acuerdo con la sección anterior [5],

Se hace reaccionar con un compuesto que tiene la siguiente fórmula general (14):



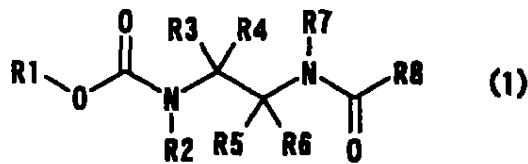
En donde

R9 representa el mismo grupo de aquel del compuesto de acuerdo con la sección anterior [5], y

X representa un grupo saliente.

RESUMEN

Un fungicida se puede suministrar mediante el uso, como un ingrediente activo, un derivado de diamina de la siguiente fórmula general (1):



En donde

R1 a R7 representan un sustituyente específico tal como un grupo alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, y R8 representa un grupo arilo, que puede ser sustituido o un grupo heteroarilo, que puede ser sustituido.

PCT

国際予備審査報告
International Preliminary Examination Report
(法第12条、法施行規則第56条)
(PCT36条及びPCT規則70)



263

出願人又は代理人 の書類記号 MC102P118A	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP02/07319	国際出願日 (日.月.年) 18.07.02	優先日 (日.月.年) 18.07.01
国際特許分類 (IPC) Int. Cl. C07C269/04, 269/06, 271/20, 271/52, C07D213/81, 213/82, 275/03, 307/68, 333/32, 333/40, 405/12, 409/12, A01N47/12		
出願人 (氏名又は名称) 三井化学株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 4 ページからなる。
- ☒ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。
(PCT規則70.16及びPCT実施規則第607号参照)
この附属書類は、全部で 3 ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。
- I ☒ 国際予備審査報告の基礎
- II ☐ 優先権
- III ☐ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- IV ☐ 発明の単一性の欠如
- V ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI ☐ ある種の引用文献
- VII ☐ 国際出願の不備
- VIII ☒ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受領した日 22.01.03	国際予備審査報告を作成した日 07.05.03	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 吉住 和之	4H 9165
電話番号 03-3581-1101 内線 3443		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (1998年7月)

282
264

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
PCT規則70.16, 70.17)

☐ 出願時の国際出願書類

☒ 明細書 第 1, 3-73 ページ、 出願時に提出されたもの
明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書 第 2 ページ、 25.04.03 付の書類と共に提出されたもの

☒ 請求の範囲 第 3-15 項、 出願時に提出されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
請求の範囲 第 1, 2 項、 25.04.03 付の書類と共に提出されたもの

☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書類と共に提出されたもの

☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書類と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった

4. 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならない、本報告に添付する。)

265

国際予備審査報告

国際出願番号 PCT/JP02/07319

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-15	有
	請求の範囲		無
進歩性 (IS)	請求の範囲	1-15	有
	請求の範囲		無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-15	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

請求の範囲 1-15 は、国際調査報告で引用されたいずれの文献にも記載されておらず、当業者にとって自明なものでもない。

266

Ⅷ. 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付けについての意見を次に示す。

請求の範囲1-7、9-15には、明細書に具体的に開示がなく、かつ明細に具体的に開示されている化合物(第2-5表)とは化学構造等が大きく異なる化合物(例えば、R1~R4がすべて特殊な官能基で置換されたヘテロアリールアルキル基であるもの等。以下単に「化学構造等が異なる化合物」という)が包含される。

しかしながら、明細書の記載及び当業者の技術常識からは、化学構造等の異なる化合物をどのように製造すればよいのか不明である上、殺菌作用が微生物との相互作用(主に代謝阻害、原形質機能阻害)であって化合物の化学構造等も殺菌活性を大きく左右することからすると、化学構造等の異なる化合物が明細書に具体的に開示されている化合物と同様の殺菌作用を有するものとも考えられない。

とすると、化学構造等の異なる化合物は明細書により十分な裏付けがなされていない化合物であるといえる。

それゆえ、請求の範囲1-7、9-15の化学構造等の異なる化合物については、新規性、進歩性又は産業上の利用可能性について有意義な見解を示すことができない。

したがって、国際予備審査報告は、請求の範囲1-7、9-15に係る発明のうち、明細書に具体的に開示されている化合物を包含する以下のものについて作成した。

a) R2、R7が水素原子であり、R3、R4の一方が水素原子かつ他方が水素原子、アルキル基、置換されていてもよいアリールアルキル基、置換されていてもよいアリール基であり、そしてR5、R6の一方が水素原子かつ他方が水素原子、アルキル基である化合物、その製造方法及びそれを有効成分とする殺菌剤

b) R10、R15が水素原子である化合物、その製造方法及びそれを有効成分とする殺菌剤

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 04 - 690
FECHA : ENERO 6 DE 2004

SUPERINTENDENCIA Y COMERCIO
Radiacion : 04002003 000000000
Fecha (AND): 2004-01-16 17:12:28 Folios: 283
Tramite : 011 PCI-PRIME 3/9 FASE NUCI 411 PROSEJUAL
Dependencia: 2820 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	10497411	06/01/2004	67,154,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	422,000.00
		TOTAL :	\$ 422,000.00

SON: CUATROCIENTOS VEINTIDOS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

660 11464-840016



FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Royal
Technologies S.A.
Sede: Calle 100 No. 100-100, San José, Costa Rica

268

Expediente No		No de Folio
04002808		
No de unidades		✓
1	CD	
2	DVD	
3	REVISTA	
4	LIBRO	
5	PERIODICO	
6	DISQUETES	
7	SOBRE DE MANILA	
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA X	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO	
10	OTROS:	

Observaciones:

un sobre y contiene
arte final

		USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION	MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.		()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.		()	()
- Descripción de la invención.		()	()
Dibujos de ser estos pertinentes.		()	()
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.		()	()
COMPLETA	INCOMPLETA	()	()

-	Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial	()	()
-	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud.	()	()
-	Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño.	()	()
-	Comprobante de pago de las tasas establecidas	()	()
COMPLETA ()		INCOMPLETA	() ()

-	Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado.	()	()
-	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud.	()	()
	Representación gráfica del esquema de trazado	()	()
	Comprobante de pago de las tasas establecidas.	()	()
	COMPLETA ()	INCOMPLETA	() ()

Firma Responsable:**Fecha:**

2020
Bogotá, D.C.,

Doctor:
Emilio Ferrero
Apoderado
Mitsui Chemical Inc.

Oficio N° 64751

ASUNTO:	Radicación N°	04-2808
	Solicitud internacional	PCT/JP2002/07319
	Fecha inicio fase nacional	18/02/2004
	Trámite	011
	Evento	379
	Actuación	430
	Folios	001

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

- ☐ La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486).

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única N° 10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la División de Nuevas Creaciones.

07 MAYO 2004

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha _____.