



**Industria y Comercio**

**SUPERINTENDENCIA**

Delegatura de Propiedad Industrial

Division de Nuevas Creaciones

**PCT**  
SOLICITUD

**PATENTE DE INVENCION**

**04-34536**

21 EXPEDIENTE No

54 TITULO DERIVADOS DE FENETILAMIDA DE ACIDO CARBOXILICO  $\alpha$ -OXI, A D J 1

ESTERILIZADOS

51 CLASIFICACION INTERNACIONAL 2.1.1

71 SOLICITANTE SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO BASILEA, SUIZA

74 APODERADO JIMENA ESCOBAR URIBE

22 BOGOTA, D C , ABRIL , 2004

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE  
PCT  
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

1

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Capítulo I.

☒

Capítulo II.

2

S LICITANTE  
(71)

Nombre: Syngenta Participations AG  
Dirección: Schwarzwaldallee 215, CH-4058  
Basilea

Nacionalidad o Domicilio: Basilea, Suiza  
Lugar de Constitución : Suiza  
Teléfono: Fax:  
E-mail

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número

3

REPRESENTANTE  
APODERADO  
(74)

Nombre: JIMENA ESCOBAR URIBE

Dirección: Cra. 11A No. 94-76 (Of. 305)

Teléfono: 6 162051/61 Fax: 6 161889

E-mail: tm-patent@escobaruribe.com

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒

NIT ☐

C.E. ☐

Otro ☐

Número 39.779.452 T.P.68.228

4

INVENTOR (ES)  
(72)

Nombre: VER ANEXOS

Dirección:

Nacionalidad o domicilio:

5 PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP02/12845 Fecha Noviembre 15, 2002

Publicación Internacional No. WO 03/042167 A1 Fecha Mayo 22, 2003

6 TÍTULO (54) DERIVADOS DE FENETILAMIDA DE ACIDO CARBOXÍLICO  $\alpha$ -OXIGENADOS O  $\alpha$ -TIOLADOS.

7 Clasificación Internacional (51) C07C 235/34

8 Prioridad

SI ☒ NO ☐

(33) País de Origen  
REINO UNIDO

(32) Fecha

Noviembre 16, 2001

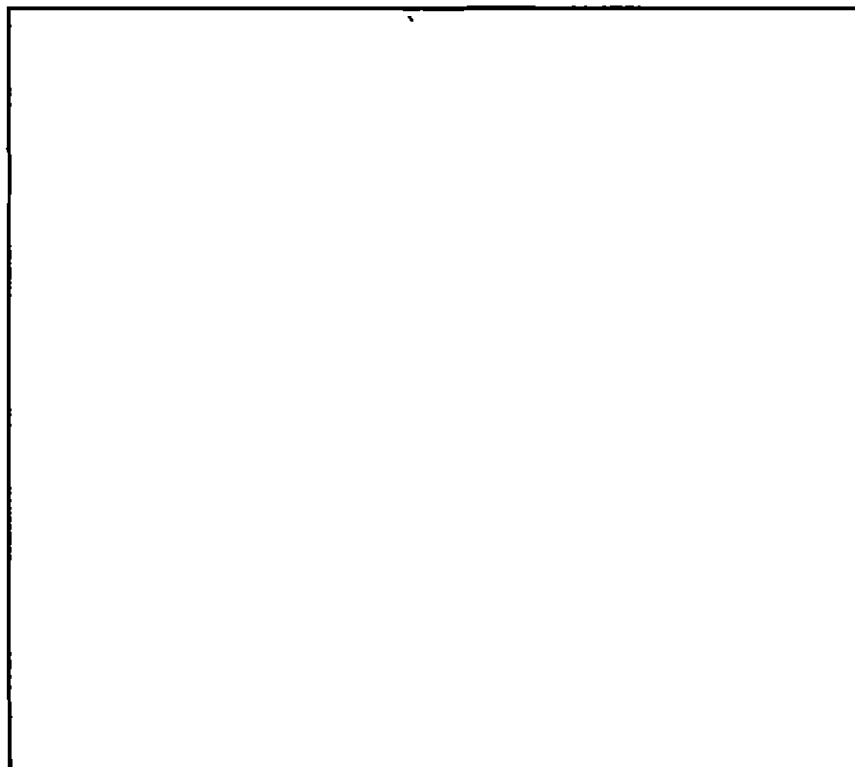
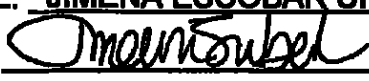
(31) Número de Solicitud

0127556.9

9 Comprobante de pago No. 04 - 24.817

Fecha Marzo 25, 2004

- ☐ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☐ 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 internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA).
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso copia de contrato de acceso.
- ☐ De ser el caso, documento que acredite 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 12 X 12 .
- ☐ 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.
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional
- ☐ Otros

**11 FIGURA CARACTERÍSTICA****12 Solicito la concesión de la patente**NOMBRE: JIMENA ESCOBAR URIBEFIRMA: 

C.C. 39.779.452 de Usaquén T.P. 68.228

2655/PCT

2155

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO  
Radicación : 04034536 00000000 Folios: 146  
Fecha (ASB): 2004-04-15 14:07:42  
Trámite : 011 PCT-PATENT 379 FASE NDC1 411 PRESENTAL  
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

NIT 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA 04 - 24 817  
FECHA 1 MARZO 23 DE 2004

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE             | TIPO PAGO    | BANCO         | CUENTA      | Nº PAGO | FECHA PGO  | Vr PAGO    |
|-------------------------|--------------|---------------|-------------|---------|------------|------------|
| ESCOBAR URIBE ASOCIADOS | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | 050-00110-6 | 6689742 | 23/03/2004 | 13 629 000 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT | CONTENIDO               | CONCEPTO                           | TOTAL CONCEPTO |
|------|-------------------------|------------------------------------|----------------|
| 1    | 50005-01-01 SOLICITUDES | 1 TRAMITES DE SOL DE PATENTE DE IN | 422,000 00     |
|      |                         | TOTAL                              | 9 422 000 00   |

SON CUATROCIENTOS VEINTIDOS MIL PESOS

RESPONSABLE 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No \_\_\_\_\_

**ANEXOS**

**INVENTORES**

- 1.) **ZELLER, Martin**  
( Syngenta Crop Protection Muenchwilen AG, Breitenloh 5, CH-4333 Muenchwilen, Suiza );
- 2.) **LAMBERTH, Clemens**  
( Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea, Suiza );
- 3.) **KRIZ, Miroslav**  
( Synkola Consortium, Mlynska dolina-areal PvF UK, 84215 Bratislava, Checoslovakia ).

Solicito expresamente a nombre de la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**, sociedad constituida de conformidad con las leyes de Suiza, domiciliada en Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea, Suiza, el otorgamiento de Patente para la invención titulada **"DERIVADOS DE FENETILAMIDA DE ACIDO CARBOXÍLICO  $\alpha$ -OXIGENADOS O  $\alpha$ -TIOLADOS"**.

Clase: C07C 235/34



**JIMENA ESCOBAR URIBE**

**C.C. 39.779.452 de Usaquen.**

**T.P. 68.228**

**GENERAL**  
**POWER OF ATTORNEY**  
**DOCUMENTO DE PODER**

The undersigned

acting on behalf of and representing  
**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**, a company  
Incorporated under the law of Switzerland

domiciled at Basel, Switzerland

hereby appoints  
**JIMENA ESCOBAR-URIBE and/or IGNACIO ESCOBAR-URIBE**

domiciled at Bogota, Colombia  
**CARRERA 11 A No. 94-76 OF. 305-306**

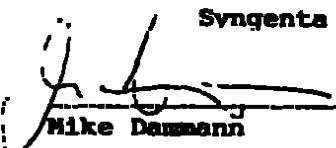
as our true and legal attorneys with the necessary powers: 1. to apply to the administrative, judicial and police authorities of the Republic of Colombia, in any instance or appeal, for obtaining registration of patents, utility models, industrial designs, commercial emblems and names, trademarks, domain names, copyrights and neighbouring rights, plant varieties, health licenses as well as their assignments, extensions, renewals, changes of name and domicile; 2. to prepare, apply for, obtain, execute and register contracts, licenses, authorizations and registrations of any kind; 3. to intervene as plaintiffs or defendants, in any instance or appeal, before any judge, court, tribunal, corporation, public officer or authority in any judicial, administrative or police action, such as: actions dealing with commercial emblems and names; oppositions against trademark registrations; caducity and nullity actions; recovery actions, actions arising from obtainment and working of license agreements; actions dealing with unfair competition; criminal actions; actions claiming indemnity for damages, complaints or remarks on all sort of industrial property matters; the performance of precautionary measures, and in any other similar action, measure or appeal related to industrial property matters, copyrights and neighbouring rights and obtentor of plant varieties' rights.

To this effect, we hereby authorize them to file applications, make descriptions, amendments, protests, declarations, oppositions, cancellations, appeals and claims; to pay taxes, quotas and liens as provided by law; to waive or abandon granted rights or rights in process of being granted, to receive all kind of documents and securities; to issue the respective releases and, in general to take, before said authorities, pertinent steps to the above-mentioned purposes and take all measures they may deem advisable to protect our interests, with all other necessary legal faculties, and we hereby declare as good and valid whatever the attorneys should do to our benefit.

This power comprises the authority to ratify or confirm on our behalf any action, as well as the faculty of receiving, desisting, transacting, compromising, conciliating, substituting and revoking substitutions, taking notifications and appointing judicial or extra-judicial attorneys.

Signed at **Basel, Switzerland**  
on **February 7, 2001**

**Syngenta Participations AG**

  
**Mike Dammann**

**Trademark Specialist**

  
**Annette Wanner**

**Application Specialist**

El suscrito

obrando en nombre y representación de  
**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**,  
constituida y organizada según las leyes de  
Suiza.

con domicilio en Basilea, Suiza

nombra a  
**JIMENA ESCOBAR-URIBE y/o IGNACIO ESCOBAR-URIBE**

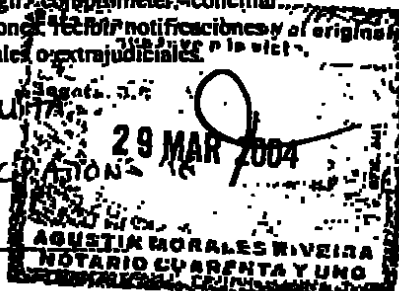
domiciliados en Bogotá, Colombia  
**CARRERA 11 A No. 94-76 OF. 305-306**

apoderados verdaderos y legales con poder especial, amplio y suficiente: 1. para recabar de las oficinas y autoridades colombianas administrativas, judiciales y de policía en cualquier instancia o recurso, la obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, registro de marcas, nombres de dominio, registro de derechos de autor y derechos conexos, registro de variedades vegetales, depósito de nombres comerciales y enseñanzas, registros sanitarios, así como sus trasposos, prórrogas, renovaciones, cambios de nombre y de domicilio; 2. elaborar, tramitar, solicitar, obtener, realizar, ejecutar y registrar contratos, licencias, autorizaciones y registros de cualesquiera clase; 3. intervenir como demandante o como demandado en cualquier instancia y recurso, y ante cualquier juez, entidad, corporación, funcionario público o autoridad en acciones judiciales, administrativas y de policía, tales como acciones derivadas del nombre o enseña comerciales; observaciones u oposición al registro de marcas; acciones de caducidad y nulidad; acciones reivindicatorias; acciones derivadas de la obtención o explotación de licencias; acciones de competencia desleal; demandas penales y civiles; acciones de indemnización de perjuicios, reclamos u observaciones a cualquier asunto sobre propiedad industrial; el ejercicio de medidas cautelares y cualesquiera otras acciones, medidas o recursos similares relacionados con la propiedad industrial, los derechos de autor y derechos conexos y los derechos de obtentor de variedades vegetales.

A este efecto, los facultamos para elevar solicitudes, formular descripciones, enmiendas, protestas, declaraciones, oposiciones, cancelaciones, apelaciones y reclamos; pagar impuestos, cuotas y gravámenes prescritos por la ley; renunciar o desistir a derechos concedidos o en curso de concesión; recibir toda clase de documentos y valores dando el descargo respectivo, y, en general, para dar ante dichas autoridades todos los pasos necesarios al efecto indicado y tomar todas las medidas que creyeran conducentes al resguardo de nuestros intereses, con todas las demás facultades necesarias y por este documento desde ahora declaramos válido y bueno todo cuanto los apoderados hicieren en nuestro beneficio.

Este poder comprende la facultad de ratificar o confirmar en nuestro nombre lo actuado, así como la facultad de desistir, transigir, comprometer, conciliar, sustituir y revocar sustituciones, tomar notificaciones y al original, nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales.

Firmado en **Basilea, Suiza**  
el **7 Febrero 2001**  
**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**



## LEGALIZATION

I, the undersigned Notary Public, residing in Basle (Switzerland), certify as true and authentic the signatures applied on the back of this document by **Messrs. Mike Dammann**, German citizen, residing in Elmendingen (Germany), and **Mrs. Annette Wanner**, French citizen, residing in Wentzwiller (France).

These two persons are authorized to represent, the first as Trademark Specialist, the second as Application Specialist the **Syngenta Participations AG**, a company limited by shares legally domiciled in Basle, with their joint signature by two according to a special power of attorney.

I know the named and their signatures personally.

Basle, this 1<sup>st</sup> (fourteenth) day of February 2001 (two thousand-one).

*[Handwritten signatures]*

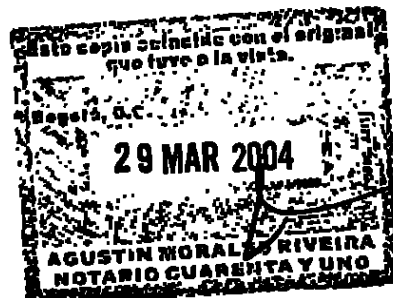
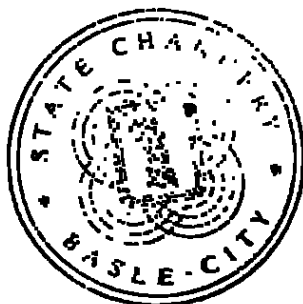
Leg.Prot.Nr. 655/2001

### Legalization

We hereby certify that the signature of Mr. *D. in. C. H. 1006* notary public in Basle (Switzerland), who is personally known to us, is genuine.

Basle, 15. Feb. 2001

No. *2648* *[Signature]*





Consulado de Colombia

Berna

AUTENTICACION DE FIRMA No 0233

BERNA 15 DE FEBRERO DEL 2001

El Suscrito Segundo Secretario Encargado  
de las funciones consulares de la embajada de la república de  
Colombia

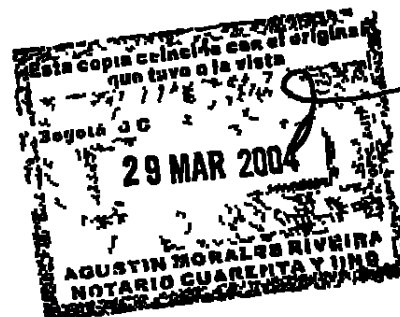
CERTIFICA

Que la señora **HEIDI FISCHER** que autoriza el presente documento ejercia legalmente en la fecha expresada las funciones de Oficial de la Cancilleria de Estado del Cantón de Basilea y que la firma y sello que en el documento aparecen como suyos son los que usa y acostumbra en sus actos oficiales de acuerdo con el registro que se lleva en este Consulado

El Suscrito Segundo Secretario Encargado de las Funciones Consulares de la Embajada no asume responsabilidad alguna por el contenido del documento autenticado

  
Jose Ignacio Arbetáez M

- Pagado Impuesto de Timbre US\$ 7 00
- Pagado Derechos Consulares US\$ 15 00



0549111  
2004 MAR 29  
NOTARIO AGUSTIN RODRIGUEZ RIVERA  
NOTARIO AGUSTIN RODRIGUEZ RIVERA

0549111  
2004 MAR 29  
NOTARIO AGUSTIN RODRIGUEZ RIVERA  
NOTARIO AGUSTIN RODRIGUEZ RIVERA

0549111  
2004 MAR 29  
NOTARIO AGUSTIN RODRIGUEZ RIVERA  
NOTARIO AGUSTIN RODRIGUEZ RIVERA

Traducción oficial hecha por Jimena Escobar Uribe, traductora e intérprete oficial según resolución No 0369 del Ministerio de Justicia, del documento que lleva el sello de legalización No 416459 de marzo 8 de 2001 y firmado por el Jefe de Legalizaciones en Santafé de Bogotá D C (firma ilegible), el cual corresponde a un documento de poder en inglés con su correspondiente traducción al español (razón por la cual no se hace traducción del mismo texto), otorgado por la sociedad SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, constituida y organizada según las leyes de Suiza, domiciliada en Basilea, Suiza a Jimena Escobar-Urbe y/o Ignacio Escobar-Urbe y firmado en Basilea Suiza el 7 de febrero de 2001 por Mike Dammann, Especialista en Marcas y por Annette Wanner, Especialista en Solicitudes

-----

### LEGALIZACIÓN

Yo, el suscrito Notario Público, residente en Basilea (Suiza) certifico como verdaderas y auténticas las firmas inscritas en el reverso de este documento por los señores Mike Dammann, ciudadana alemán residente en Elmeldingen (Alemania) y la señora Annette Wanner, ciudadana francesa, residente en Wentzwiller (Francia)

Estas dos personas están autorizadas para representar el primero como Especialista de Marcas la segunda como Especialista de Solicitudes, a Syngenta Participations AG una sociedad limitada por acciones legalmente domiciliada en Basilea, con su firma conjunta por dos de acuerdo con un poder especial

Conozco a las nombradas y a sus firmas personalmente

Basilea, este 14 (decimocuarto) día de febrero de 2001 (dos mil uno)

(fdo) Firma ilegible  
Sello oficial notarial  
Conrad Haab I U D  
Leg Prot 655/2001

#### Legalización(Sello)

Por medio del presente certificamos que la firma del señor(ilegible) notario público en Basilea (Suiza) quien es personalmente conocido por nosotros, es genuina

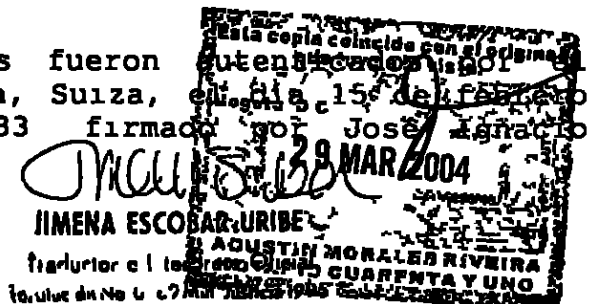
Basilea, 15 de febrero de 2001

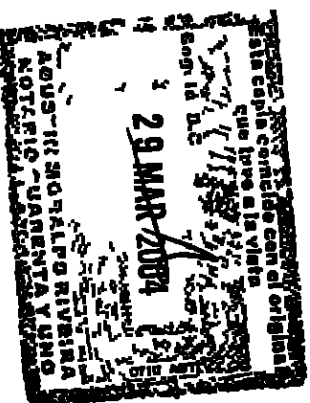
No 2'648

Cancillería de Estado del Cantón de la Cuidad de Basilea (sello oficial)

(fdo) Heidi Fischer

La firma y sello precedentes fueron autenticados por el Consulado de Colombia en Berna, Suiza, el día 15 de febrero de 2001 bajo el número 0233 firmado por José Ignacio Arbeláez M





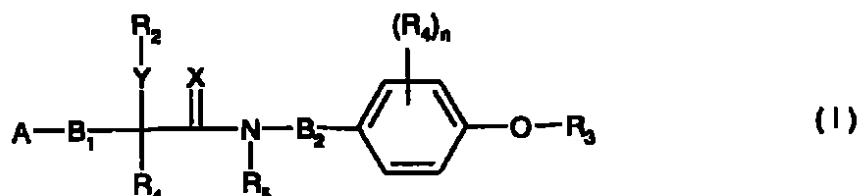
*Wm*  
*2004*  
*11-23*

521  
523  
103

21 1 12  
*M. J. J.*  
14 14  
14 14

**RESUMEN:**

La invención se refiere a derivados de fenetilamida de ácido carboxílico  $\alpha$ -oxigenados o  $\alpha$ -tiolados de fórmula general I



incluyendo sus isómeros ópticos y mezclas de tales isómeros, en donde A representa arilo optativamente sustituido o heteroarilo optativamente sustituido; X es oxígeno o azufre; Y es oxígeno o azufre; R<sub>1</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo o halocicloalquilo; R<sub>2</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-alquenilo, alcoxi-alquinilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o aril-alquilo optativamente sustituido, aril-alquenilo optativamente sustituido, aril-alquinilo optativamente sustituido o ariloxi-alquilo optativamente sustituido; R<sub>3</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-alquenilo, alcoxi-alquinilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es aril-alquilo optativamente sustituido, aril-alquenilo optativamente sustituido, aril-alquinilo optativamente sustituido, ariloxi-alquilo optativamente sustituido, heteroaril-alquilo optativamente sustituido, heteroaril-alquenilo optativamente sustituido o heteroaril-alquinilo optativamente sustituido; R<sub>4</sub> es alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi-alquilo, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, alquiltio, alcanollo, alquilamino, dialquilamino, alcoxicarbonilo, en donde todos los

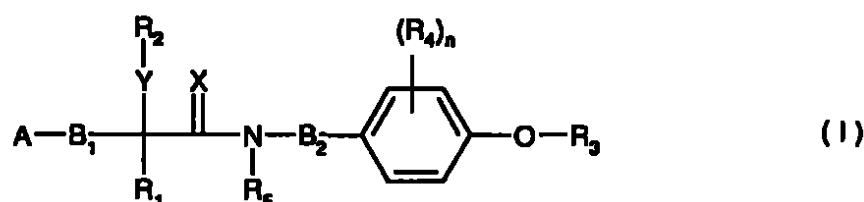
grupos alquilo, alquenilo o alquinilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es halógeno, ciano, nitro, amino, formilo o carboxilo;  $R_5$  es hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo; n es un número entero 0, 1, 2, 3 o 4;  $B_1$  representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde q es un número entero 2, 3 o 4; r es un número entero 0, 1, 2, 3; s es un número entero 1, 2 o 3, siempre que (r + s) sea 1, 2 o 3; Z es  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$ ,  $-SO_2-$ ,  $NR_6-$ ,  $-CO-$ ,  $-OOC-$ ,  $-COO-$ ,  $-NR_6-CO-$  o  $-CO-NR_6-$ ;  $R_6$  es hidrógeno o alquilo;  $R_{10}$ ,  $R_{11}$ ,  $R_{12}$  y  $R_{13}$  independientemente entre sí son hidrógeno o alquilo; y  $B_2$  es un puente alquilenilo.

Estos compuestos poseen propiedades protectoras útiles y pueden emplearse en forma ventajosa en la práctica agrícola para el control o prevención de la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos, especialmente hongos.

**DERIVADOS DE FENETILAMIDA DE ACIDO CARBOXÍLICO  $\alpha$ -OXIGENADOS**  
**O  $\alpha$ -TIOLADOS**

La presente invención se refiere a novedosos derivados de fenetilamida de ácido carboxílico  $\alpha$ -oxigenados o  $\alpha$ -tiolados de fórmula I. Se refiere a la preparación de los nuevos compuestos activos y a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de estos compuestos como ingrediente activo. La invención se refiere además a la preparación de dichas composiciones y al uso de los compuestos o de las composiciones para controlar o evitar la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos, especialmente hongos.

La invención se refiere a derivados de fenetilamida de ácido carboxílico  $\alpha$ -oxigenados o  $\alpha$ -tiolados de fórmula general I



incluyendo sus isómeros ópticos y mezclas de tales isómeros, en donde

A representa anillo optativamente sustituido o heteroarillo optativamente sustituido;

X es oxígeno o azufre;

Y es oxígeno o azufre;

R<sub>1</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo o halocicloalquilo;

R<sub>2</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-alquenilo, alcoxi-alquinilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o aril-alquilo optativamente sustituido, aril-alquenilo optativamente sustituido, aril-alquinilo optativamente sustituido o ariloxi-alquilo optativamente sustituido;

$R_3$  es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-alquenilo, alcoxi-alquinilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es aril-alquilo optativamente sustituido, aril-alquenilo optativamente sustituido, aril-alquinilo optativamente sustituido, ariloxi-alquilo optativamente sustituido, heteroaril-alquilo optativamente sustituido, heteroaril-alquenilo optativamente sustituido o heteroaril-alquinilo optativamente sustituido,

$R_4$  es alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi-alquilo, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, alquiltio, alcanollo, alquilamino, dialquilamino, alcoxicarbonilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo o alquinilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es halógeno, ciano, nitro, amino, formilo o carboxilo;

$R_5$  es hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo;

$n$  es un número entero 0, 1, 2, 3 o 4;

$B_1$  representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde

$q$  es un número entero 2, 3 o 4;

$r$  es un número entero 0, 1, 2, 3;  $s$  es un número entero 1, 2 o 3, siempre que  $(r + s)$  sea 1, 2 o 3;

$Z$  es  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$ ,  $-SO_2-$ ,  $NR_6-$ ,  $-CO-$ ,  $-OOC-$ ,  $-COO-$ ,  $-NR_6-CO-$  o  $-CO-NR_6-$ ;

$R_6$  es hidrógeno o alquilo;

$R_{10}$ ,  $R_{11}$ ,  $R_{12}$  y  $R_{13}$  independientemente entre sí son hidrógeno o alquilo; y

$B_2$  es un puente alquilenio.

En la definición antes proporcionada, arilo incluye anillos de hidrocarburos aromáticos como ser fenilo, naftilo, antracenilo, fenantrenilo y bifenilo como ser 1,3-bifenilo y 1,4-bifenilo, siendo fenilo el preferido. La misma definición es aplicable donde arilo es parte de ariloxi.

Heteroarilo representa sistemas de anillos aromáticos que comprenden sistemas mono-, bi- o tricíclicos en donde al menos un átomo de oxígeno, nitrógeno o azufre está presente como un miembro del anillo. Ejemplos son furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotienilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indazolilo, benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinnolinilo y naftiridinilo.

Los grupos arilo y heteroarilo antes mencionados pueden ser optativamente sustituidos. Esto significa que pueden llevar uno o más sustituyentes idénticos o diferentes. Normalmente, no más de tres sustituyentes están presentes al mismo tiempo. Ejemplos de sustituyentes de grupos arilo o heteroarilo son: alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, fenilo y fenil-alquilo, siendo posible a su vez para todos los grupos precedentes llevar uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes; alcoxi; alqueniloxi; alquiniloxi; alcoxialquilo; haloalcoxi; alquiltio; haloalquiltio; alquilsulfonilo; formilo; alcanolilo; hidroxilo; halógeno; ciano; nitro; amino; alquilamino; dialquilamino; carboxilo; alcóxicarbonilo; alquenilóxicarbonilo; o alquinilóxicarbonilo. Ejemplos típicos incluyen 4-clorofenilo, 4-bromofenilo, 3,4-diclorofenilo, 4-cloro-3-fluorfenilo, 3-cloro-4-fluorfenilo, 4-metilfenilo, 4-etilfenilo, 4-propargiloxifenilo, 1-naftilo, 2-naftilo, 4-bifenililo, 4'-cloro-4-bifenililo, 5-cloro-tien-2-ilo, 5-metil-tien-2-ilo, 5-metil-fur-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidro-1-naftilo, 5,6,7,8-tetrahidro-2-naftilo, 3,4-dioxometilenil-fenilo, 3,4-dioxoetilenil-fenilo, 6-benzotienilo, 7-benzotienilo, 3-metilfenilo, 4-fluorfenilo, 4-etenilfenilo, 4-etinilfenilo, 4-propilfenilo, 4-isopropilfenilo, 4-ter.butilfenilo, 4-etoxifenilo, 4-etiniloxifenilo, 4-fenoxifenilo, 4-metiltienilo, 4-metilsulfonilfenilo, 4-cianofenilo, 4-nitrofenilo, 4-metoxycarbonil-fenilo, 3-bromofenilo, 3-clorofenilo, 2-

clorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 3,4,5-triclorofenilo, 3,4-difluorfenilo, 3,4-dibromofenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3-cloro-4-cianofenilo, 4-cloro-3-cianofenilo, 3-bromo-4-metilfenilo, 4-metoxi-3-metilfenilo, 3-fluor-4-metoxifenilo, 4-cloro-3-metilfenilo, 4-cloro-3-trifluormetil-fenilo, 4-bromo-3-clorofenilo, 4-trifluormetilfenilo, 4-trifluormetoxifenilo, 4-metoxifenilo, 4'-metil-4-bifenililo, 4'-trifluormetil-4-bifenililo, 4'-bromo-4-bifenililo, 4'-ciano-4-bifenililo, 3',4'-dicloro-4-bifenililo, etc.

Nuevamente, los mismos sustituyentes opcionales pueden estar presentes donde arilo es parte de ariloxi o ariltio.

Los grupos alquilo, alquenilo o alquinilo optativamente sustituidos pueden llevar uno o más sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo, alcoxi, alquiltio, cicloalquilo, fenilo, nitro, ciano, hidroxilo, mercapto, alquilcarbonilo o alcoxicarbonilo. Esto también es aplicable donde alquilo, alquenilo o alquinilo es parte de otro sustituyente como ser alcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, alqueniloxi, alqueniltio, alquenilsulfinilo, alquenilsulfonilo, alquiniloxi, alquiniltio, alquinilsulfinilo y alquinilsulfonilo.

Preferentemente, el número de sustituyentes no es más de tres con la excepción de halógeno, donde los grupos alquilo pueden ser perhalogenados.

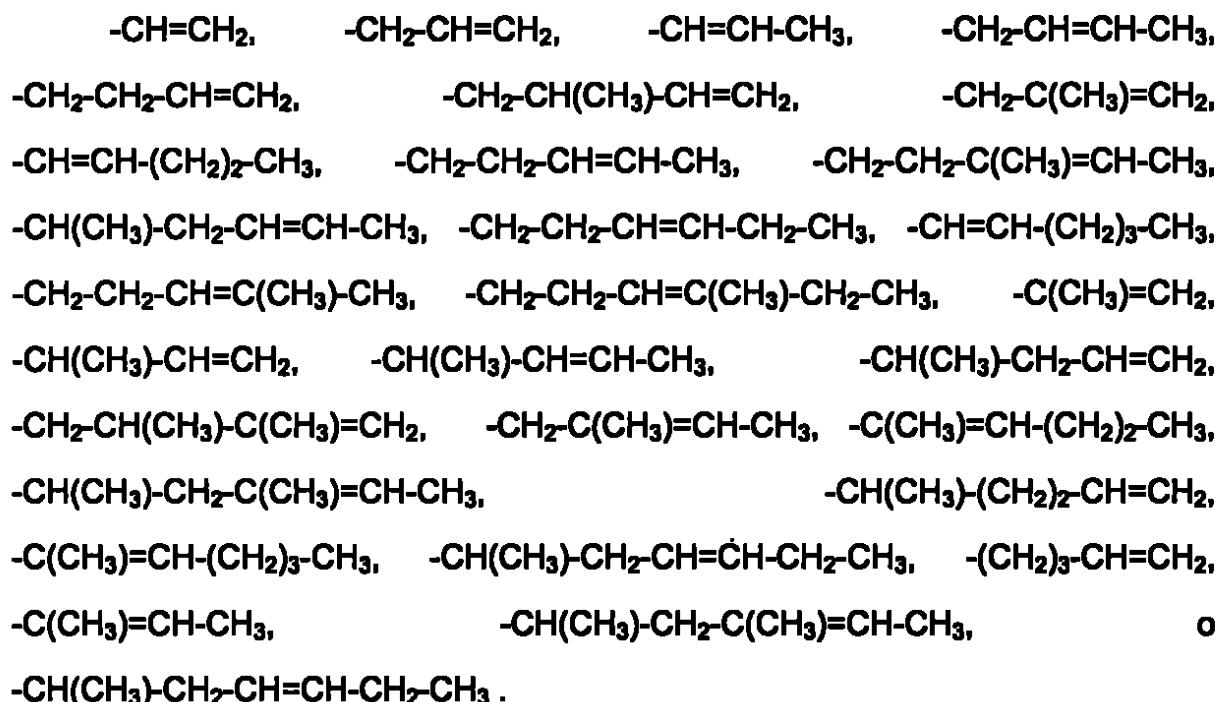
En las definiciones antes proporcionadas, "halo" o "halógeno" incluye flúor, cloro, bromo y yodo.

Los radicales alquilo, alquenilo y alquinilo pueden ser de cadena recta o ramificados. Esto es aplicable también a las partes alquilo, alquenilo o alquinilo de otros grupos que contienen alquilo, alquenilo o alquinilo. Dependiendo de la cantidad de átomos de carbono mencionados, alquilo por si solo o como parte de otro sustituyente debe entenderse como siendo, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo, decilo, undecilo, dodecilo y sus

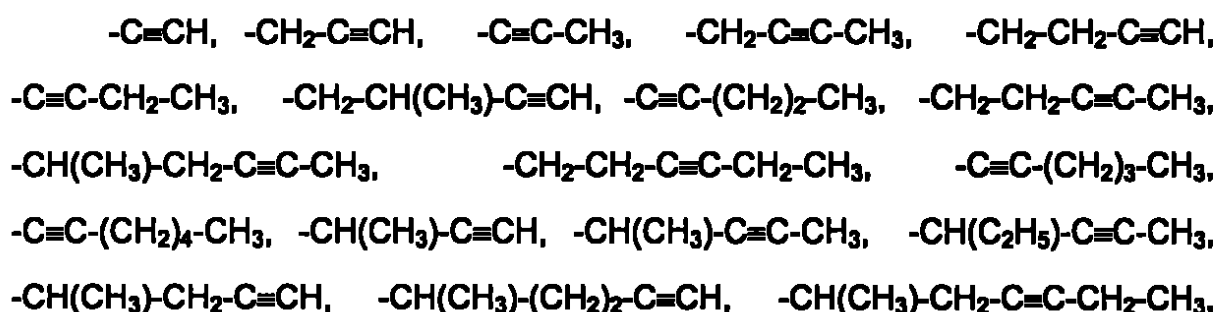
isómeros, por ejemplo isopropilo, isobutilo, ter-butilo o sec-butilo, isopentilo o ter-pentilo.

Cicloalquilo por ejemplo es, dependiendo de la cantidad de átomos de carbono mencionados, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, biciclohexilo, cicloheptilo, bicicloheptilo, ciclooctilo o biciclooctilo.

Dependiendo de la cantidad de átomos de carbono mencionados, alquenilo como un grupo o como un elemento estructural de otros grupos debe entenderse como siendo, por ejemplo,



Alquinilo como un grupo o como un elemento estructural de otros grupos es, por ejemplo



$-(CH_2)_3-C\equiv CH$ , o  $-CH(CH_3)-CH_2-C\equiv C-CH_2-CH_3$ , dependiendo de la cantidad de átomos de carbono presentes.

Un grupo haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo o halocicloalquilo puede contener uno o más átomos de halógeno (iguales o diferentes), y por ejemplo puede representar  $CHCl_2$ ,  $CH_2F$ ,  $CCl_3$ ,  $CH_2Cl$ ,  $CHF_2$ ,  $CF_3$ ,  $CH_2CH_2Br$ ,  $C_2Cl_5$ ,  $CH_2Br$ ,  $CHClBr$ ,  $CF_3CH_2$ ,  $CH_2CH_2Cl$ ,  $CH_2CH_2F$ ,  $CH_2CHF_2$ ,  $CH_2-C=CHCl$ ,  $CH=CCl_2$ ,  $CH=CF_2$ ,  $CH_2-C=CCl$ ,  $CH_2-C\equiv C-CF_3$ , etc.

$B_1$  y  $B_2$  caracterizan porciones bivalentes de la estructura molecular de fórmula I, que tienen la función de miembros puente. Típicamente, estas porciones tienen una estructura lineal, aunque también pueden ser ramificadas y pueden llevar otros sustituyentes. Ejemplos incluyen los miembros puente de la fórmula  $-CH(R_{20})-(CH_2)_p-$ , en donde  $R_{20}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$  y  $p$  es un número entero 0 o 1 para el  $B_2$  puente. También puede representar un puente alquileo  $C_1-C_4$  por ejemplo, aunque también se extiende a aquellos miembros puente que son interrumpidos o enlazados mediante un heteroátomo, preferentemente oxígeno o azufre. Ejemplos típicos incluyen  $-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-$ ,  $-CH(CH_3)-CH_2-$ ,  $-CH(CH_3)-$ ,  $-O-CH_2-$ ,  $-S-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-CH_2-$ ,  $CH(CH_3)-CH_2-$ ,  $-SO_2-CH_2-$ ,  $-CH_2-O-CH_2-$ , o  $CH(CH_3)-$ . Ejemplos para  $B_1$  incluyen los miembros enlazantes  $-CH_2-CH_2-$ ,  $-CH(CH_3)-CH_2-$ ,  $-CH_2-CH_2-CH_2-$ ,  $CH(CH_3)-CH_2-$  o  $CH_2-CH(CH_3)-$ .

La presencia de por lo menos un átomo de carbono asimétrico en los compuestos de fórmula I significa que los compuestos pueden aparecer en formas ópticamente isoméricas y enantioméricas. Como resultado de la presencia de un doble enlace  $C=C$  alifático posible, el isomerismo geométrico también puede producirse. La Fórmula I tienen el propósito de incluir todas las formas isoméricas posibles y mezclas de las mismas. Donde no se especifica ningún isómero

específico, se quiere hacer referencia a las mezclas de diastereómeros o racematos, según lo obtenible de los métodos de síntesis.

Los subgrupos preferidos de compuestos de fórmula I son aquellos en donde

A es fenilo, naftilo, 1,3-bifenilo, 1,4-bifenilo, fluorenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxifenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, indazolilo, benzofuranilo, benzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo o isoquinolinilo, cada uno sustituido optativamente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo, fenil-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueniloxi C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiniloxi C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo- C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcanolfo- C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxycarbonilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueniloxicarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiniloxicarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, di-alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, hidroxilo, halógeno, ciano, nitro, amino y radicales formilo, en donde a su vez los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo y cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con uno o más átomos de halógeno; o

A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxifenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo- C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, bencilo, alcoxi- C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalcoxi- C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcanolfo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxycarbonilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, hidroxilo, halógeno, ciano, nitro y formilo; o

A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxfenilo, tienilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo  $C_1-C_{10}$ , haloalquilo  $C_1-C_{10}$ , alquenilo  $C_2-C_{10}$ , alquinilo- $C_2-C_{10}$ , bencilo, alcoxi- $C_1-C_{10}$ , haloalcoxi- $C_1-C_{10}$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , haloalquiltio  $C_1-C_{10}$ , alcanolfo- $C_1-C_{10}$ , alcoxicarbonilo- $C_1-C_{10}$ , halógeno, ciano, nitro y formilo; o

A es fenilo o tienilo, optativamente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo- $C_1-C_4$ , alquenilo- $C_2-C_4$ , alcoxi- $C_1-C_4$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , alcanolfo- $C_1-C_4$ , halógeno y ciano; o

A es fenilo, optativamente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo- $C_1-C_4$ , halógeno y ciano; o

X es oxígeno; o

Y es oxígeno; o

$R_1$  representa hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$  o cicloalquilo- $C_3-C_8$ , en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo y cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o

$R_1$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_3-C_{10}$  o haloalquinilo- $C_3-C_{10}$ ; o

$R_1$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_8$ , alquenilo- $C_3-C_8$ , o alquinilo- $C_3-C_8$  o

$R_1$  es hidrógeno; o

$R_2$  representa hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$ , cicloalquilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquilo- $C_1-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ -alquilo- $C_1-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ -alquenilo- $C_3-C_{10}$  o alcoxi- $C_1-C_8$ -alquinilo- $C_3-C_{10}$ , en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o representa aril-alquilo- $C_1-C_8$  optativamente sustituido,

aril-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido, aril-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido o ariloxi-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> optativamente sustituido; o

R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenil-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, fenil-alquenilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o fenil-alquinilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, en donde fenilo puede estar optativamente mono o disustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcanollo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxycarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, ciano, nitró y formilo; o

R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sub>2</sub> es hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; o

R<sub>2</sub> es hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; o

R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o representa aril-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> optativamente sustituido, aril-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido, aril-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido, ariloxi-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> optativamente sustituido, heteroaril-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> optativamente sustituido, heteroaril-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> o heteroaril-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido; o

$R_3$  representa hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$ , cicloalquilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquilo- $C_1-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquenilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquinilo- $C_3-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ -alquilo- $C_1-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ -alquenilo- $C_3-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ -alquinilo- $C_3-C_8$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_3-C_{10}$ , haloalquinilo- $C_3-C_{10}$ , fenil-alquilo- $C_1-C_8$ , fenil-alquenilo- $C_1-C_8$  o fenil-alquinilo- $C_1-C_8$ , en donde los grupos fenilo están optativamente mono- o disustituídos con radicales seleccionados del grupo que comprende alquilo- $C_1-C_8$ , alquenilo- $C_2-C_8$ , alquinilo- $C_2-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ , haloalcoxi- $C_1-C_8$ , alquiltio- $C_1-C_8$ , haloalquiltio- $C_1-C_8$ , alcanóilo- $C_1-C_8$ , alcóxicarbonilo- $C_1-C_8$ , halógeno, ciano, nitro y formilo; o

$R_3$  representa hidrógeno, alquilo- $C_1-C_8$ , alquenilo- $C_3-C_8$ , alquinilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquinilo- $C_3-C_4$ , alcoxi- $C_1-C_4$ -alquinilo- $C_3-C_4$ , haloalquilo- $C_1-C_8$  o haloalquinilo- $C_3-C_8$ ; o

$R_3$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_8$ , alquenilo- $C_3-C_8$ , alquinilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquinilo- $C_3-C_4$  o alcoxi- $C_1-C_4$ -alquinilo- $C_3-C_4$ ; o

$R_3$  es alquilo- $C_1-C_4$ , alquenilo- $C_3-C_4$  o alquinilo- $C_3-C_4$ ; o

$R_4$  es alquilo- $C_1-C_8$ , alquenilo- $C_3-C_8$ , alquinilo- $C_3-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ -alquilo- $C_1-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ , alqueniloxi- $C_3-C_8$ , alquiniloxi- $C_3-C_8$ , alquiltio- $C_1-C_8$ , alcanóilo- $C_1-C_8$ , alquilamino- $C_1-C_8$ , dialquilamino- $C_1-C_8$  o alcóxicarbonilo- $C_1-C_8$ , en donde todos los grupos alquilo, alquenilo o alquinilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es halógeno, ciano, nitro, amino, formilo o carboxilo; o

$R_4$  es alquilo- $C_1-C_8$ , haloalquilo- $C_1-C_8$ , alcoxi- $C_1-C_8$ , alqueniloxi- $C_3-C_8$ , alquiniloxi- $C_3-C_8$ , alquiltio- $C_1-C_8$ , halógeno, ciano o nitro; o

$R_4$  es alcoxi- $C_1-C_8$ , alqueniloxi- $C_3-C_8$ , alquiniloxi- $C_3-C_8$  o halógeno; o

$R_4$  es 3-alcoxi- $C_1-C_8$ ; o

$R_4$  es 3-metoxi o 3-etoxi; o

$R_5$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_8$ , alquenilo- $C_3-C_8$  o alquinilo- $C_3-C_8$ ; o

$R_5$  es hidrógeno o alquilo- $C_1-C_4$ ; o

$R_5$  es hidrógeno o metilo; o

$R_5$  es hidrógeno; o

$B_1$  representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde  $R_{10}$ ,  $R_{11}$ ,  $R_{12}$  y  $R_{13}$  independientemente entre sí son hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$ ,  $q$  es un número entero 2, 3 o 4;  $r$  es un número entero 0, 1, 2, 3;  $s$  es un número entero 1, 2 o 3, siempre que  $(r + s)$  sea 1, 2 o 3;  $Z$  es  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $NR_6-$ ,  $-CO-$ ,  $-OOC-$ ,  $-COO-$ ,  $-NR_6-CO-$  o  $-CO-NR_6-$  y  $R_6$  es hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$ ; o

$B_1$  representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde  $R_{10}$ ,  $R_{11}$ ,  $R_{12}$  y  $R_{13}$  independientemente entre sí son hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$ ,  $q$  es el número entero 2,  $r$  es el número entero 0;  $s$  es el número entero 1, y  $Z$  es  $-O-$ ,  $-S-$  o  $-CO-$ ; o

$B_1$  se selecciona entre  $-CH_2-CH_2-$ ,  $-O-CH_2-$  y  $-S-CH_2-$ ; o

$n$  es un número entero entre 0 y 2; o

$n$  es un número entero 0 o 1; o

$n$  es el número entero 1; o

$B_2$  es un puente alquileo- $C_1-C_6$ ; o

$B_2$  es un puente alquileo de la fórmula  $-CH(R_{20})-(CH_2)_p-$ , en donde  $R_{20}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$  y  $p$  es un número entero 0, 1 o 2; o

$B_2$  es  $-CH_2-CH_2-$ ,  $CH(CH_3)-CH_2-$  o  $CH(CH_3)-$ ; o

$B_2$  es  $-CH_2-CH_2-$ .

Otros subgrupos preferidos son aquellos en donde

$A$  es fenilo, naftilo, 1,3-bifenilo, 1,4-bifenilo, fluorenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxfenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, indazolilo, benzofuranilo, benzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo,

quinolinilo o isoquinolinilo, cada uno optativamente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, fenilo, fenil-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquilsulfonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcanolfo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alqueniloxicarbonilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquiniloxicarbonilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquilamino-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, di-alquilamino-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, hidroxilo, halógeno, ciano, nitro, amino y radicales formilo, en donde, a su vez, los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo y cicloalquilo pueden estar sustituidos optativamente con uno o más átomos de halógeno; y X es oxígeno o azufre; e Y es oxígeno o azufre; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> o cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo y cicloalquilo pueden estar sustituidos optativamente con halógeno; y R<sub>2</sub> es hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo y cicloalquilo pueden estar sustituidos optativamente con halógeno; o representa aril-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> optativamente sustituido, aril-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido, aril-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido o ariloxi-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> optativamente sustituido; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o representa aril-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> optativamente sustituido, aril-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido, aril-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> optativamente sustituido, ariloxi-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> optativamente sustituido, heteroaril-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> optativamente sustituido, heteroaril-alquenilo-

$C_3-C_{10}$  optativamente sustituido o heteroaril-alquinilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido; y  $R_4$  es alquilo- $C_1-C_6$ , alquenilo- $C_3-C_6$ , alquinilo- $C_3-C_6$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcoxi- $C_1-C_6$ , alqueniloxi- $C_3-C_6$ , alquiniloxi- $C_3-C_6$ , alquiltio- $C_1-C_6$ , alcanollo- $C_1-C_6$ , alquilamino- $C_1-C_6$ , dialquilamino- $C_1-C_6$  o alcoxicarbonilo- $C_1-C_6$ , en donde todos los grupos alquilo, alquenilo o alquinilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es halógeno, ciano, nitro, amino, formilo o carboxilo; y  $R_3$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_6$ , alquenilo- $C_3-C_6$  o alquinilo- $C_3-C_6$ ; y  $B_2$  es un puente alquilenilo- $C_1-C_6$ ; y  $n$  es un número entero de 0 a 2.

Entre estos compuestos son preferidos aquellos en donde A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxifenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_2-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_2-C_{10}$ , alquinilo- $C_2-C_{10}$ , bencilo, alcoxi- $C_1-C_{10}$ , haloalcoxi- $C_1-C_{10}$ , alqueniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , haloalquiltio- $C_1-C_{10}$ , alquilsulfonilo- $C_1-C_{10}$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcanollo- $C_1-C_{10}$ , alcoxicarbonilo- $C_1-C_{10}$ , hidroxilo, halógeno, ciano, nitro y formilo.

Otros subgrupos preferidos son aquellos en los cuales A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxifenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_2-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_2-C_{10}$ , alquinilo- $C_2-C_{10}$ , bencilo, alcoxi- $C_1-C_{10}$ , haloalcoxi- $C_1-C_{10}$ , alqueniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , haloalquiltio- $C_1-C_{10}$ , alquilsulfonilo- $C_1-C_{10}$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcanollo- $C_1-C_{10}$ , alcoxicarbonilo- $C_1-C_{10}$ , hidroxilo, halógeno, ciano, nitro y formilo; y X es oxígeno o azufre; e Y es oxígeno o azufre; y  $R_1$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_3-C_{10}$  o haloalquinilo- $C_3-C_{10}$ ; y  $R_2$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo-

C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenil-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, fenil-alquenilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o fenil-alquinilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, en donde fenilo puede ser optativamente mono o disustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcanollo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halógeno, ciano, nitro y formilo; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenil-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, fenil-alquenilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o fenil-alquinilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, en donde los grupos fenilo están optativamente mono- o disustituidos con radicales seleccionados del grupo que comprende alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcanollo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halógeno, ciano, nitro y formilo; y R<sub>4</sub> es alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alqueniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquiniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halógeno, ciano o nitro; y R<sub>5</sub> es hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y n es un número entero de 0 a 2; y B<sub>2</sub> es un puente alquilenos de la fórmula  $-\text{CH}(\text{R}_{20})-(\text{CH}_2)_p-$ , en donde R<sub>20</sub> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y p es un número entero 0, 1 o 2; o en donde

A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxfenilo, tienilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, bencilo, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcanollo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>,

halógeno, ciano, nitro y formilo; y X es oxígeno o azufre; e Y es oxígeno o azufre; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>4</sub> es alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alqueniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquiniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o halógeno; y R<sub>5</sub> es hidrógeno o alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y B<sub>1</sub> representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>12</sub> y R<sub>13</sub> independientemente entre sí son hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, q es un número entero 2, r es el número entero 0; s es el número entero 1, y Z es -O-, -S- o -CO-; y n es el número entero 0 o 1; y B<sub>2</sub> es un puente alquileo de la fórmula  $-CH(R_{20})-(CH_2)_p-$ , en donde R<sub>20</sub> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y p es un número entero 0, 1 o 2; o en donde

A es fenilo o tienilo, optativamente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcanoflo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno y ciano; y X es oxígeno; e Y es oxígeno; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>4</sub> es 3-alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; y R<sub>5</sub> es hidrógeno o metilo; y B<sub>1</sub> se selecciona entre  $-CH_2-CH_2-$ ,  $-O-CH_2-$  y  $-S-CH_2-$ ; y n es el número entero 0 o 1; y B<sub>2</sub> es  $-CH_2-CH_2-$ ,  $CH(CH_3)-CH_2-$  o  $CH(CH_3)-$ ; o en donde

A es fenilo, optativamente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

halógeno y ciano; y X e Y son ambos oxígeno; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno; y R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>3</sub> representa alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>4</sub> es 3-metoxi o 3-etoxi; y R<sub>5</sub> es hidrógeno; y B<sub>1</sub> se selecciona entre -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -O-CH<sub>2</sub>- y -S-CH<sub>2</sub>-; y n es el número entero 1; y B<sub>2</sub> es -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-.

Los compuestos individuales preferidos son:

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-butiramida,

4-(4-fluor-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

4-(4-fluor-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

2-etoxi-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-

butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-2-prop-iniloxi-propionamida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,

3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-etil-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

2-etoxi-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(4-fluor-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-fluor-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

2-etoxi-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-  
propionamida,

3-benciloxi-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-benciloxi-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]- propionamida,

3-benciloxi-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]- propionamida,

3-benciloxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida, y

3-(4-cloro-benciloxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-  
iniloxi-propionamida,

Los enantiómeros ópticamente puros de estos compuestos son mayormente obtenidos como mezclas de las formas R y S. Sin embargo, es posible obtener los enantiómeros puros ya sea mediante métodos de separación clásicos o por métodos de síntesis estereoselectivos. En la preparación práctica, se puede obtener mezcla enantioenriquecida de ambas formas, mientras que a escala de laboratorio se pueden obtener enantiómeros analíticamente puros, como ser:

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,  
 (R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-  
 butiramida,  
 (R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,  
 (R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,  
 (R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,  
 (R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-fluor-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-fluor-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
 butiramida,  
 (R)-2-etoxi-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-cloro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-cloro-fenil)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
 butiramida,  
 (R)-4-(4-cloro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-  
 iniloxi-butiramida,  
 (R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-  
 propionamida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-2-prop-iniloxi-propionamida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-etil-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-2-etoxi-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-2-etoxi-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-benciloxi-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-benciloxi-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-benciloxi-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-benciloxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida, y

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida, y

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,  
(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,  
(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,  
(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-butiramida,  
(S)-4-(4-fluor-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,  
(S)-4-(4-fluor-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,  
(S)-2-etoxi-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,  
(S)-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,  
(S)-4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,  
(S)-4-(4-cloro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,  
(S)-4-(4-cloro-fenil)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,  
(S)-4-(4-cloro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,  
(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,  
(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,  
(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-2-prop-iniloxi-propionamida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-etil-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-2-etoxi-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-2-etoxi-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-feniltio)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-feniltio)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-feniltio)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-feniltio)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-benciloxi-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-benciloxi-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-benciloxi-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-benciloxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

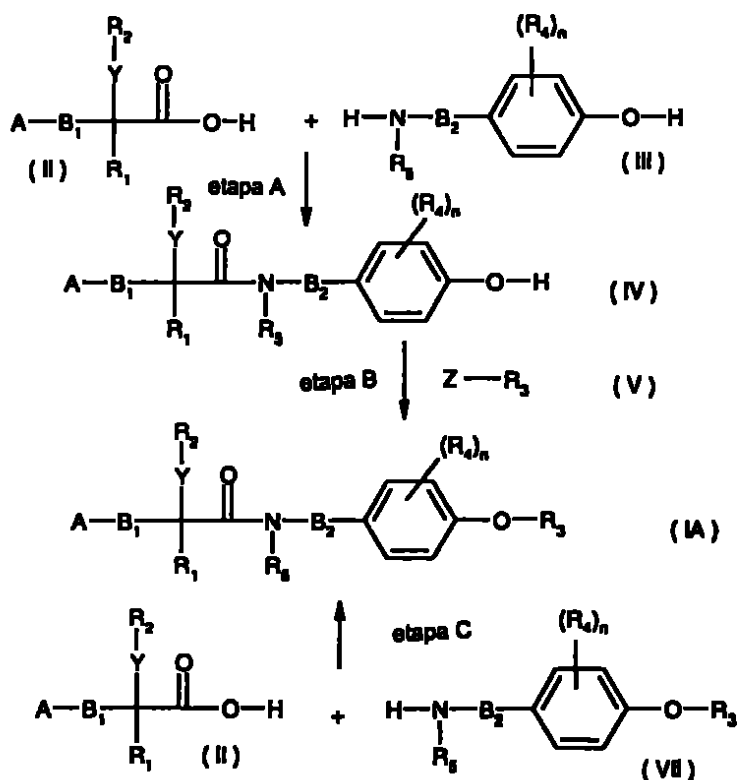
(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida, y

(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida.

Ciertos derivados de ácido mandélico han sido propuestos para controlar hongos destructivos de las plantas (por ejemplo en WO 94/29267 en WO 96/17840 y en PCT/EP01/05530). La acción de esas preparaciones no es satisfactoria, sin embargo, en todos los aspectos y necesidades de las prácticas agrícolas. Sorprendentemente, con la estructura del compuesto de fórmula I, se han encontrado nuevos tipos de microbiocidas que tienen un alto nivel de actividad.

Los compuestos de fórmula I se pueden obtener de acuerdo con uno de los procesos de los Esquemas 1 a 5:

**Esquema 1:**



**Paso A:** Un ácido de fórmula II o un derivado activado con carboxi de un ácido de fórmula II en donde A, B<sub>1</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> e Y son según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar con una amina de fórmula III en donde B<sub>2</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub> son según lo definido para la fórmula I, optativamente en presencia de una base y optativamente en presencia de un agente diluyente.

Los derivados activados con carboxi del ácido de fórmula II son todos los compuestos que tienen un grupo carboxilo activado como un haluro ácido, como ser un cloruro ácido; como anhídridos simétricos o mixtos, como ser anhídridos mixtos con O-alkilcarbonatos; como ésteres activados, como ser p-nitrofenilésteres o N-hidroxisuccinimidésteres, o incluso ésteres normales, como ser metilésteres, etilésteres, n-propilésteres, iso-propilésteres, n-butilésteres, ter-

butilésteres, neo-pentilésteres o iso-amilésteres; como así también formas activadas formadas in situ del ácido de fórmula II con agentes condensantes, como ser díciclohexilcarbodiimida, carbonildiimidazol, hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxi-tris(dimetilamino)fosfonio, hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-bis(pentametilen)uronio, hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-bis(tetrametilen)uronio, hexafluorofosfato de O-benzotriazol-1-il-N,N,N',N'-tetrametiluronio o hexafluorofosfato de benzotriazol-1-iloxi-tripirrolidinofosfonio. Los anhídridos mixtos de los ácidos de la fórmula II se pueden preparar mediante reacción de un ácido de fórmula II con ésteres de ácido clorofórmico como alquilésteres del ácido clorofórmico, como ser cloroformiato de etilo o cloroformiato de isobutilo, optativamente en presencia de una base orgánica o inorgánica como una amina terciaria, como ser trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, piridina, N-metil-piperidina o N-metil-morfolina.

La presente reacción se lleva a cabo preferentemente en un disolvente como hidrocarburos aromáticos, no aromáticos o halogenados, como ser clorohidrocarburos, por ejemplo diclorometano o tolueno; cetonas, por ejemplo, acetona; ésteres, por ejemplo acetato de etilo; amidas por ejemplo N,N-dimetilformamida; nitrilos por ejemplo acetonitrilo; o éteres por ejemplo dietiléter, ter-butil-metiléter, dioxano o tetrahidrofurano o agua. También es posible utilizar mezclas de estos disolventes. La reacción se lleva a cabo optativamente en presencia de una base orgánica o inorgánica como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina, N,N-diisopropil-etilamina, piridina, N-metil-piperidina o N-metil-morfolina, como un hidróxido de metal o un carbonato de metal, preferentemente un hidróxido alcalino o un carbonato alcalino, como ser hidróxido de litio, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio a temperaturas que oscilan entre  $-80^{\circ}\text{C}$  y  $+150^{\circ}\text{C}$ , preferentemente a temperaturas que oscilan entre  $-40^{\circ}\text{C}$  y  $+40^{\circ}\text{C}$ .

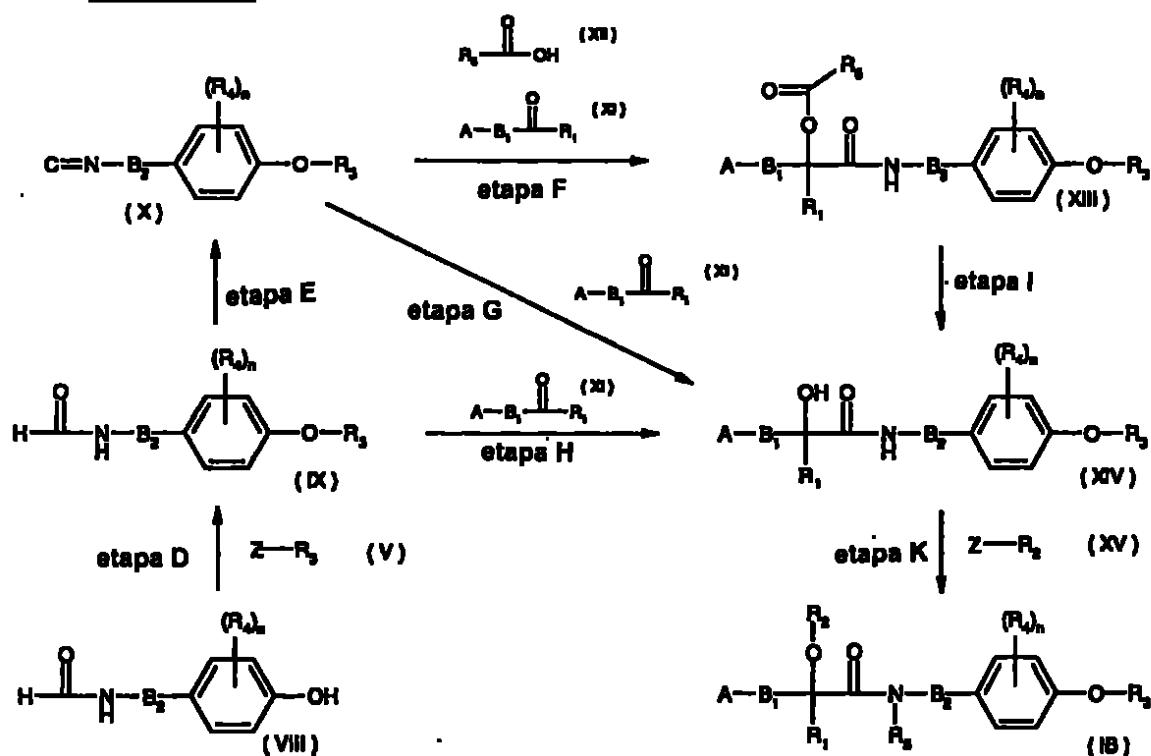
**Paso B:** Los compuestos de fórmula IA se pueden preparar como producto final haciendo reaccionar un fenol de fórmula IV en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> e Y son según lo definido para la fórmula I con un compuesto de fórmula V en donde R<sub>3</sub> es según lo definido para la fórmula I y en donde Z es un grupo saliente como un haluro como ser cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato.

La reacción se lleva a cabo ventajosamente en un disolvente como hidrocarburos aromáticos, no aromáticos o halogenados, como ser clorohidrocarburos, por ejemplo, diclorometano o tolueno; cetonas, por ejemplo, acetona o 2-butanona; ésteres por ejemplo acetato de etilo, éteres, por ejemplo, dietiléter, ter-butil-metiléter, dioxano o tetrahidrofurano; amidas por ejemplo N,N-dimetilformamida; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo; alcoholes, por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, n-butanol o ter-butanol; sulfóxidos, por ejemplo, dimetilsulfóxido o agua. También es posible utilizar mezclas de estos disolventes. La reacción se lleva a cabo optativamente en presencia de una base orgánica o inorgánica como una amina terciaria, como ser trietilamina, N,N-diisopropil-etilamina, piridina, N-metil-piperidina o N-metil-morfolina, como un hidróxido de metal, un carbonato de metal o un alcóxido de metal, preferentemente un hidróxido alcalino, un carbonato alcalino o un alcóxido alcalino, como ser hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, metóxido de sodio, metóxido de potasio, etóxido de sodio, etóxido de potasio, ter-butóxido de sodio o ter-butóxido de potasio a temperaturas que oscilan entre -80°C y +200°C, preferentemente a temperaturas que van de 0°C a +120°C.

**Paso C:** Alternativamente al paso A y al paso B, un ácido de fórmula II o un derivado activado con carboxi de un ácido de fórmula II en donde A, B<sub>1</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> e Y son según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar con una amina de

fórmula VII en donde  $B_2$ ,  $R_3$ ,  $R_4$  y  $R_5$  son según lo definido para la fórmula I bajo las mismas condiciones según lo definido para el paso A, optativamente en presencia de una base y optativamente en presencia de un agente diluyente.

**Esquema 2:**



**Paso D:** Un compuesto de fórmula VIII en donde  $B_2$  y  $R_4$  son según lo definido para la fórmula I es alquilado con un compuesto de fórmula V (véase el Esquema 1) en donde  $R_3$  y  $Z$  son según lo definido para el Esquema 1 bajo las mismas condiciones a lo definido para el paso B en el Esquema 1.

**Paso E:** Un compuesto de fórmula IX en donde  $B_2$ ,  $R_3$  y  $R_4$  son según lo definido para la fórmula I es deshidratado a un isocianuro de fórmula X en donde  $B_2$ ,  $R_3$  y  $R_4$  son según lo definido para la fórmula I bajo condiciones conocidas per se (D. Seebach, G. Adam, T. Gees, M. Schiess, W. Weigang, Chem. Ber. 1988, 121, 507).

**Paso F:** Un isocianuro de fórmula X en donde  $B_2$ ,  $R_3$  y  $R_4$  son según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar en una reacción Passerini de tres

componentes (J. March, *Advanced Organic Chemistry*, 5ta ed., Wiley, 2001, p. 1252) con un aldehído o cetona de fórmula XI, en donde A, B<sub>1</sub> y R<sub>1</sub> son según lo definido para la fórmula I en presencia de un ácido carboxílico XII en donde R<sub>6</sub> es hidrógeno o alquilo inferior, típicamente ácido acético, para dar una O-acil- $\alpha$ -hidroxiamida de fórmula XIII, en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido para la fórmula I y R<sub>6</sub> es hidrógeno o alquilo inferior.

**Paso G:** Alternativamente al paso F, un isocianuro de fórmula X en donde B<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar con un aldehído o cetona de fórmula XI, en donde A, B<sub>1</sub> y R<sub>1</sub> son según lo definido para la fórmula I en presencia de tetracloruro de titanio para dar una  $\alpha$ -hidroxiamida de la fórmula XIV (donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> tienen el mismo significado al definido anteriormente) bajo condiciones conocidas per se (D. Seebach, G. Adam, T. Gees, M. Schiess, W. Weigang, *Chem. Ber.* 1988, 121, 507; O. Ort., U. Döller, W. Reissel, S. D. Lindell, T. L. Hough, D. J. Simpson, J. P. Chung, *Pesticide Sci.* 1997, 50, 331).

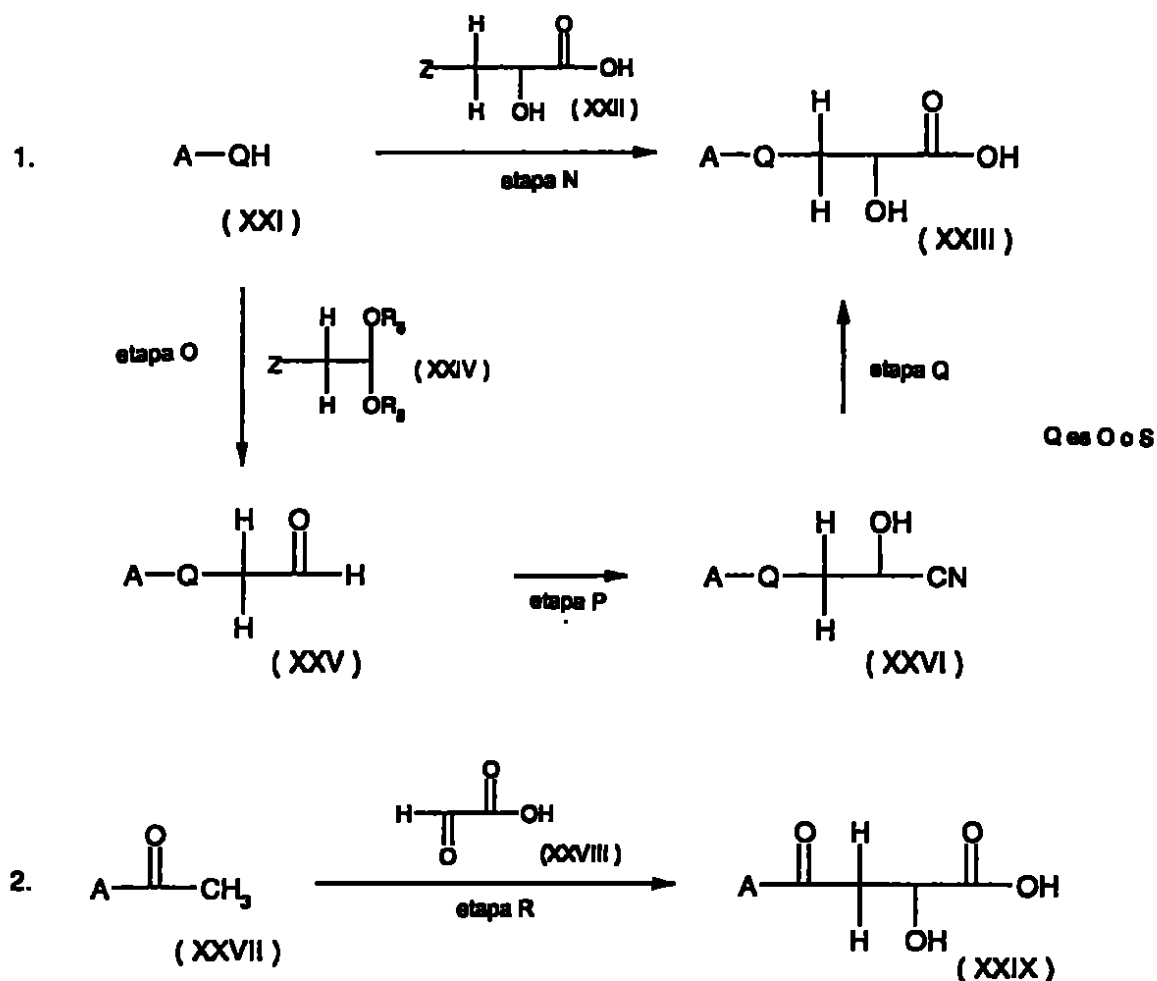
**Paso H:** Alternativamente al paso E y al paso F, un compuesto de fórmula IX, en donde B<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido para la fórmula I se trata con un equivalente de fosgeno (por ejemplo, trifosgeno) y una base (por ejemplo trietilamina) y en un segundo paso, sin aislamiento del intermediario isocianuro, se trata adicionalmente con tetracloruro de titanio y un aldehído o cetona de fórmula XI, en donde A, B<sub>1</sub> y R<sub>1</sub> son según lo definido para la fórmula I bajo condiciones conocidas per se (WO 96/17840) para dar una  $\alpha$ -hidroxiamida de la fórmula XIV, en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido para la fórmula I.

**Paso I:** Una O-acil- $\alpha$ -hidroxiamida de fórmula XIII en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido anteriormente y R<sub>6</sub> es hidrógeno o alquilo inferior se hidroliza a una  $\alpha$ -hidroxiamida de fórmula XIV, en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son

según lo definido para la fórmula I bajo condiciones clásicas (J. March, Advanced Organic Chemistry, 4ta ed., Wiley, 1992).

**Paso K:** Una  $\alpha$ -hidroxiamida de fórmula XIV, en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar con un compuesto XV en donde R<sub>2</sub> es alquilo, alquenoilo o alquiniilo y Z es un grupo saliente como un haluro como ser cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato a un compuesto de fórmula IB en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y R<sub>4</sub> son según lo definido para la fórmula I y bajo las mismas condiciones a lo definido para el paso B en el Esquema 1.

**Esquema 3:** Preparación de  $\alpha$ -hidroxi-ácidos (ejemplos de fórmula II):



**Paso N:** Un fenol o tiofenol de fórmula XXI en donde A es según lo definido para la fórmula I y Q es oxígeno o azufre se hace reaccionar con un derivado de

ácido láctico de fórmula XXII en donde Z es un grupo saliente como un haluro como ser un cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato para dar un  $\alpha$ -hidroxi-ácido de fórmula XXIII en donde A es como se definió para la fórmula I en presencia de una base como ser hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o carbonato de potasio bajo condiciones conocidas per se (US 4.451.474).

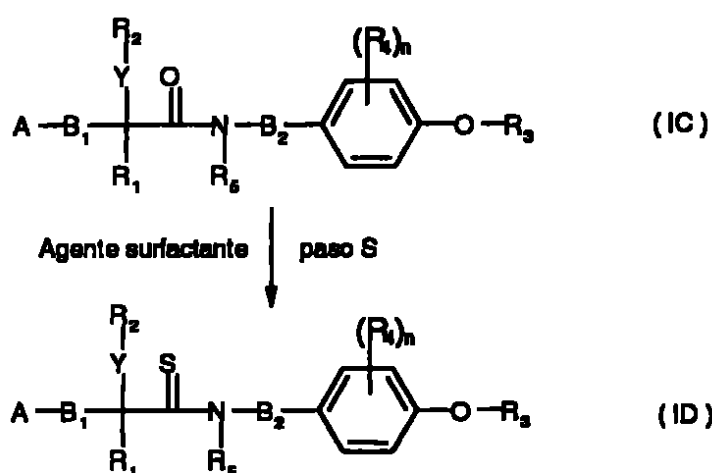
Paso O: Alternativamente al paso N, un fenol o tiofenol de fórmula XXI en donde A es según lo definido para la fórmula I y Q es oxígeno o azufre se hace reaccionar con un derivado de acetaldehído de fórmula XXIV en donde Z es un grupo saliente como un haluro como ser un cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato y R<sub>8</sub> es hidrógeno o alquilo inferior a un aldehído de fórmula XXV en donde A es según lo definido para la fórmula I en presencia de una base como ser hidruro de sodio, metóxido de sodio, etóxido de sodio, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio y disociación de acetales subsiguientes con la ayuda de un ácido como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico bajo condiciones conocidas per se (J. Brussee, W.T. Loos, C.G. Kruse, A. Van der Gen, Tetrahedron, 1990, 46, 979).

Paso P: Un aldehído de fórmula XXV en donde A es según lo definido para la fórmula I se transforma en una cianohidrina de fórmula XXVI en donde A es según lo definido para la fórmula I con un cianuro inorgánico como cianuro de sodio o cianuro de potasio, preferentemente en presencia de una base como ser bicarbonato de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de calcio o monofosfato de sodio.

Paso Q: Una cianohidrina de fórmula XXVI en donde A es según lo definido para la fórmula I se hidroliza a un  $\alpha$ -hidroxiácido de fórmula XXIII en donde A es según lo definido para la fórmula I en presencia de un ácido como ácido clorhídrico, ácido nítrico o ácido sulfúrico.

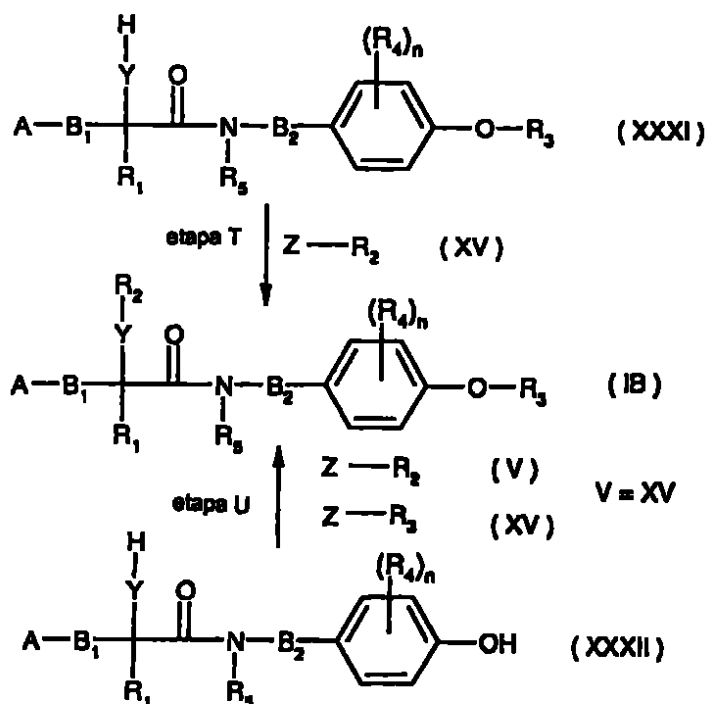
**Paso R:** Una acetofenona de fórmula XXVII en donde A es según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar con un derivado de ácido glioxílico de fórmula XXVIII, que puede ser ácido glioxílico mismo o monohidrato de ácido glioxílico, a un  $\alpha$ -hidroxi- $\alpha$ -ceto-ácido de fórmula XXIX bajo condiciones conocidas per se (M. Bianchi, A. Butti, Y. Christidis, J. Perronnet, F. Barzaghi, R. Cesana, A. Nencioni, Eur. J. Med. Chem., 1988, 23, 45).

**Esquema 4:**



**Paso S:** Una amida de fórmula VI en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub> son según lo definido anteriormente se transforma en una tioamida de fórmula XXX, en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y R<sub>5</sub> son según lo definido para la fórmula I con un agente sulfurante, como un compuesto de azufre fosforoso, por ejemplo, pentasulfuro de fósforo o 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetán-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson), en un agente diluyente inerte, como un disolvente orgánica inerte como ser hidrocarburos aromáticos, no aromáticos o halogenados, por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno o cloroformo, a temperaturas que van desde -80°C a +200°C, preferentemente a temperaturas que van desde 0 a +100°C.

**Esquema 5:**



**Paso T:** Una amida de fórmula IB en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> e Y son según lo definido para la fórmula I se puede obtener mediante reacción de una amida de fórmula XXXI, en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> e Y son según lo definido para la fórmula I con un compuesto de fórmula XV en donde R<sub>2</sub> es según lo definido para la fórmula I y en donde Z es un grupo saliente como un haluro como ser cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato bajo las mismas condiciones según lo definido para el paso B en el Esquema 1.

**Paso U:** Una amida de fórmula XXXII en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>4</sub> e Y son según lo definido para la fórmula I se hace reaccionar con un compuesto XV en donde R<sub>2</sub> es según lo definido para la fórmula I y en donde Z es un grupo saliente como un haluro como ser cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato y que es igual a un compuesto V en donde R<sub>3</sub> es según lo definido para la fórmula I y Z también es un grupo saliente como un haluro como ser cloruro o bromuro o un éster sulfónico como ser un tosilato, mesilato o triflato a un compuesto de fórmula IB en donde A, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, e Y son

según lo definido para la fórmula I y bajo las mismas condiciones según lo definido para el paso B en el Esquema 1.

Los compuestos de fórmula I son aceites o sólidos a temperatura ambiente y se distinguen por sus propiedades microbiocidas valiosas. Se pueden utilizar en el sector agrícola o campos relacionados preventivamente y curativamente en el control de microorganismos destructores de las plantas. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención se distinguen a bajos índices de concentración no solo por su excelente actividad microbiocida, especialmente fungicida, sino además por ser especialmente bien tolerados por las plantas.

Sorprendentemente, se ha descubierto ahora que los compuestos de fórmula I tienen por razones prácticas un espectro microbiocida muy ventajoso en el control de microorganismos fitopatógenos, especialmente hongos. Poseen propiedades curativas y preventivas muy ventajosas y se utilizan en la protección de numerosas plantas de cultivo. Con los compuestos de fórmula I es posible inhibir o destruir microorganismos fitopatógenos que aparecen sobre diversos cultivos de plantas útiles o sobre partes de tales plantas (fruta, brote, hojas, tallos, tubérculos, raíces), mientras que las partes de las plantas que crecen posteriormente también siguen siendo protegidas, por ejemplo, contra hongos fitopatógenos.

Los novedosos compuestos de fórmula I demostraron ser efectivos contra géneros específicos de la clase de hongo Fungi imperfecti (por ejemplo, Cercospora), Basidiomycetes (por ejemplo, Puccinia) y Ascomycetes (por ejemplo, Erysiphe y Venturia) y especialmente contra Oomycetes (por ejemplo, Plasmopara, Peronospora, Pythium y Phytophthora). Por lo tanto, representan en la protección de plantas una adición valiosa a las composiciones para controlar hongos fitopatógenos. Los compuestos de fórmula I también se pueden utilizar como recubrimientos para proteger semillas (fruta, tubérculos, granos) y recortes

de plantas de infecciones fungales y contra hongos fitopatógenos que aparecen en la tierra.

La invención se refiere además a composiciones que comprenden compuestos de fórmula I como ingrediente activo, especialmente composiciones protectoras de las plantas, y se refiere a su utilización en el sector agrícola o en campos relacionados.

Adicionalmente, la presente invención incluye la preparación de esas composiciones, en donde el ingrediente activo es homogéneamente mezclado con una o más de las sustancias o grupos de sustancias descritas en la presente. También se incluye un método para el tratamiento de plantas el cual se distingue por la aplicación de los compuestos novedosos de fórmula I o de las novedosas composiciones.

Los cultivos objetivo a ser protegidos dentro del alcance de esta invención comprenden, por ejemplo, las siguientes especies de plantas: cereales (trigo, cebada, centeno, avenas, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolacha (remolacha y remolacha de forraje); pomos, fruta de hueso y fruta blanda (manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas, frutillas, frambuesa, mora); plantas leguminosas (habas, lentejas, arvejas, semillas de soja); plantas oleaginosas (colza, mostaza, amapola, olivas, girasoles, coco, plantas de aceite de ricino, semillas de cacao, maní); cucurbitáceas (alubias, pepinos, melones); plantas fibrosas (algodón, lino, cáñamo, yute); fruta cítrica (naranjas, limones, pomelos, mandarinas); vegetales (espinaca, lechuga, espárrago, acelga, zanahoria, cebolla, tomate, papa, pimienta roja); laurácea (palta, canela, alcanfor) y plantas como ser tabaco, nueces, café, caña de azúcar, té, pimienta, viñedos, lúpulos, bananas y plantas de cauchos naturales y también plantas ornamentales.

Los compuestos de fórmula I son normalmente utilizados en la forma de composiciones y se pueden aplicar en la zona o planta que se va a tratar en forma

simultánea o sucesivamente con otros ingredientes activos. Esos otros ingredientes activos pueden ser fertilizantes, donadores de micronutrientes u otras preparaciones que influyen en el crecimiento de las plantas. También es posible utilizar herbicidas selectivos o insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, agentes combatientes de moluscos o mezclas de diversas de esas preparaciones, si se desea, junto con otros portadores, surfactantes u otros adyuvantes promotores de la aplicación empleados habitualmente en la tecnología de la formulación.

Los compuestos de fórmula I se pueden mezclar con otros fungicidas, dando como resultado en algunos casos actividades sinérgicas inesperadas. Tales mezclas no se encuentran limitadas a dos ingredientes activos (uno de fórmula I y uno de la lista de otros fungicidas), sino por el contrario muchas comprenden más de un ingrediente activo del componente de fórmula I y más de un otro fungicida. La mezcla de componentes los cuales son particularmente adecuados para este propósito incluyen por ejemplo azoles, como ser azaconazol, BAY 14120, bitertanol, bromuconazol, cyproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalil, imibenconazol, ipconazol, metconazol, myclobutanil, pefurazoato, penconazol, pyrifenox, prochloraz, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol; carbinos de pirimidinilo, como ser, ancymidol, fenarimol, nuarimol; 2-amino-pirimidinas, como ser bupirimato, dimetirimol, etirimol; morfollinas, como ser dodemorf, fenpropidina, fenpropimorf, espiroxamina, tridemorf; anilino-pirimidinas, como ser cyprodinil, mepanipirim, pyrimetanil; pirroles, como ser fenpiclonil, fludioxonil; fenilamidas, como ser benalaxil, furalaxil, metalaxil, R-metalaxil, ofurace, oxadixilo; bencimidazoles, como ser benomil, carbendazim, debacarb, fuberidazol, tiabendazol; dicarboximidas, como ser, clozolinato, diclozolina,

iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina; carboxamidas, como ser carboxin, fenfuram, flutolanil, mepronil, oxicarboxin, tifulzamida; guanidinas, como ser guazatina, dodina, iminoctadina; estrobilurinas, como ser azoxiestrobina, kresoxim-metilo, metominoestrobina, SSF-129, trifloxiestrobina, picoxiestrobina, BAS 500F (nombre propuesto piracloestrobina), BAS 520; ditiocarbamatos, como ser ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram; N-halometiltiotetrahidroftalimidas, como ser captafol, captan, diclofluanida, fluormidas, folpet, tolifluanida; compuestos de Cu, como ser mezcla de Bordeaux, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, mancopper, cobre de oxina; derivados de nitrofenol, como ser dinocap, nitrotal-isopropilo; derivados organo-p, como ser edifenfos, iprobenfos, isoprotiolano, fosdifen, pirazofos, tolclofos-metilo; diversos otros, como ser acibenzolar-S-metilo, anilazina, bentiavalicarb, blasticidin-S, quinometionato, cloroneb, clorotalonil, ciflufenamid, cimoxanil, diclone, diclomezine, dicloran, dietofencarb, dimetomorf, SYP-LI90 (nombre propuesto: flumorf), ditianon, etaboxam, etridiazol, famoxadone, fenamidone, fenoxanil, fentina, ferimzone, fluazinam, flusulfamida, fenhexamida, fosetil-aluminio, himexazol, iprovalicarb, IKF-916 (clazofamida), kasugamicina, metasulfocarb, metrafenona, nicobifen (nueva propuesta: boscalid), pencicurón, ftalida, polixinas, probenazol, propamocarb, piroquilon, quinoxifen, quintozeno, azufre, triazóxido, triciclazol, triforine, validamicina, zoxamida (RH7281).

En las mezclas antes mencionadas, la relación de mezcla de los ingredientes activos se seleccionada en forma tal que alcance el control opcional del microorganismo fitopatógeno en las plantas huéspedes. Esta relación es en general entre 100:1 y 1:100, más preferentemente entre 10:1 y 1:10 de un compuesto de fórmula I respecto al segundo fungicida. Las mezclas pueden no solo comprender uno de los ingredientes activos de combinación mencionados,

sino que pueden comprender más de un ingrediente activo adicional seleccionado del grupo especificado, formando de ese modo por ejemplo mezclas de 3 vías o de 4 vías.

Los portadores y surfactantes adecuados pueden ser sólidos o líquidos y corresponden a las sustancias empleadas convencionalmente en la tecnología de las formulaciones, como ser, por ejemplo, sustancias naturales o minerales regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, agentes de la adhesión, espesantes, aglutinantes o fertilizantes. Tales portadores y aditivos son descritos, por ejemplo, en WO 95/30651.

Un método preferido de aplicación de un compuesto de fórmula I, o una composición agroquímica que comprende al menos uno de esos compuestos, es aplicación al follaje (aplicación foliar), la frecuencia y el índice de aplicación dependen del riesgo de infestación por el patógeno en cuestión. Los compuestos de fórmula I también pueden ser aplicados a granos de semillas (recubrimiento) impregnando los granos con una formulación líquida del ingrediente activo o recubriéndolos con una formulación sólida.

Los compuestos de fórmula I se utilizan en forma no modificada o, preferentemente, junto con los adyuvantes empleados convencionalmente en la tecnología de la formulación, y son para ese propósito formulados en forma ventajosa de manera conocida, por ejemplo, en concentrados emulsionables, pastas que se pueden revestir, soluciones que se pulverizan directamente o que se diluyen, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvillo, gránulos, y por encapsulación en por ejemplo sustancias poliméricas. Como en el caso de la naturaleza de las composiciones, los métodos de aplicación, como ser pulverizado, atomizado, espolvoreo, esparcido, revestimiento o vertido, se escogen de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias prevalecientes.

Las proporciones ventajosas de aplicación son normalmente entre 1 g y 2 kg de ingrediente activo (i.a.) por cada hectárea (ha), preferentemente entre 10 g y 1 kg de i.a./ha, especialmente entre 25 g y 750 g de i.a./ha. Cuando se utilizan como recubrimientos de semillas, las proporciones de entre 0,001 g y 1,0 g de ingrediente activo por kg de semilla se utilizan en forma ventajosa.

Las formulaciones, es decir, las composiciones, preparaciones o mezclas que comprenden el o los compuestos (el o los ingredientes activos) de fórmula I y, cuando resulta apropiado, un adyuvante sólido o líquido, se preparan en forma conocida, por ejemplo, mediante mezclado homogéneo y/o trituración del ingrediente activo con cargas, por ejemplo, disolventes, portadores sólidos y, cuando resulta apropiado, compuestos tensioactivos (surfactantes).

Los surfactantes adicionales habitualmente utilizados en la tecnología de la formulación son conocidos por el experto en la técnica o se pueden encontrar en la bibliografía técnica relevante.

Las composiciones agroquímicas generalmente comprenden de 0,01 a 99% en peso, preferentemente de 0,1 a 95% en peso, de un compuesto de fórmula I, 99,99 a 1% en peso, preferentemente de 99,9 a 5% en peso, de un adyuvante sólido o líquido, y de 0 a 25% en peso, preferentemente de 0,1 a 25% en peso, de un surfactante.

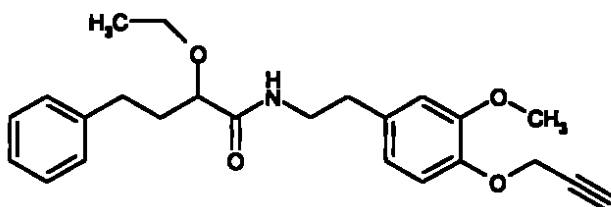
Mientras que los productos comerciales serán formulados preferentemente como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas.

Las composiciones también pueden comprender otros ingredientes, como ser estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y agentes de la adhesión, como así también fertilizantes u otros ingredientes activos para obtener efectos especiales.

Los Ejemplos que siguen ilustran la invención antes descrita, sin limitar su alcance de ninguna manera. Las temperaturas se proporcionan en grados Celsius. Ph representa fenilo.

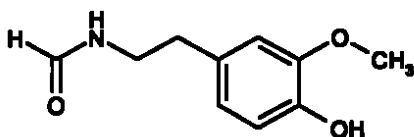
**Ejemplos de Preparación:**

**Ejemplo 1: 2-Etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inoiloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida**



(Compuesto E1.02)

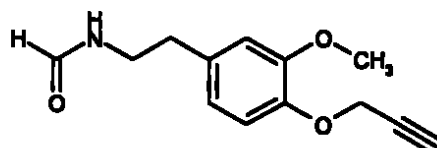
**a) N-[2-(4-Hidroxi-3-metoxi-fenil)-etil]-formamida**



Se agrega ácido fórmico (230 g, 5,0 mol) por goteo a anhídrido acético (383 g, 3,75 mol) a 0°C. Esta mezcla se agita durante 2 horas a +55°C y se enfría posteriormente nuevamente a 0°C. Se agrega tetrahidrofurano (500 ml) a esta temperatura seguido por clorhidrato de 4-(2-amino-etil)-2-metoxi-fenol (50 g, 0,25 mol). La suspensión blanca resultante se agita durante 18 horas a +75°C, cambiando a una solución amarilla. La mezcla de reacción es evaporada y el residuo es sometido a cromatografía evaporativa para dar N-[2-(4-Hidroxi-3-metoxi-fenil)-etil]-formamida.

$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,85 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,57 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,82 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ ), 5,69 (bs, 1H, NH), 6,67 – 7,09 (m, 3H, CH arom.), 8,12 (s, 1H, CHO).

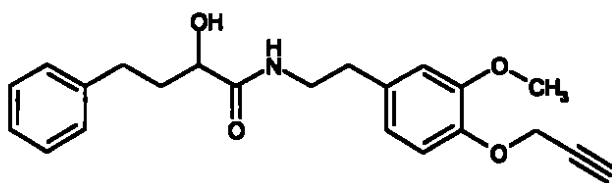
b) N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-formamida



Se agrega metóxido de sodio (32 ml de una solución 5,4 M en metanol, 0,17 mol) a una solución de N-[2-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-etil]-formamida (32 g, 0,16 mol) en metanol (400 ml). Se agrega bromuro de propargilo (20 g, 0,17 mol) y la mezcla se somete a reflujo durante 4 horas. Después de la evaporación, el residuo es tomado en acetato de etilo (400 ml) y se lava con agua (2 x 200 ml). La capa orgánica se seca sobre sulfato de magnesio y se evapora. El residuo se somete a cromatografía evaporativa para dar la N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-formamida.

$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,44 (t, 1H,  $\text{C}\equiv\text{CH}$ ), 2,73 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,51 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,82 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ ), 4,69 (m, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 5,53 (bs, 1H, NH), 6,62 – 6,95 (m, 3H, CH arom.), 8,09 (s, 1H, CHO).

c) 2-Hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida



(Compuesto E1.01)

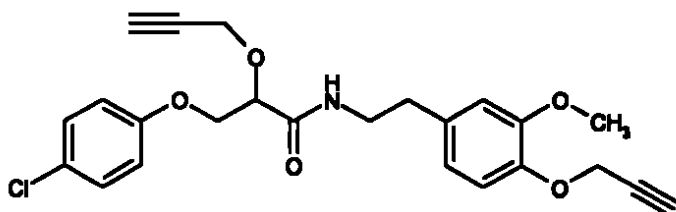
Se disuelven N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-formamida (8,0 g, 34 mmol) y trietilamina (8,3 g, 82 mmol) en diclorometano (80 ml). Se agrega bis(triclorometil) carbonato (trifosgeno, 4,0 g, 14 mmol) en diclorometano (40 ml) a +5°C. La mezcla se agita durante 4 horas a +5°C y luego se enfría a -78°C. Una solución de tetracloruro de titanio (7,0 g, 38 mmol) en diclorometano (70 ml) se agrega y la mezcla se agita durante 2 horas a -40°C. Se agrega por goteo 3-fenilpropionaldehído (4,8 g, 36 mmol) en diclorometano (50 ml) y la mezcla es agitada durante 17 horas a temperatura ambiente. La mezcla es hidrolizada con HCl 5N (25 ml), se agita durante 30 minutos a temperatura ambiente y se lava con agua. Después de la evaporación de la capa orgánica, el residuo es sometido a cromatografía evaporativa (acetato de etilo/ hexano 6:3) para dar 2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida (Compuesto E1.01).

<sup>1</sup>H-RMN (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>): 1,93 (q, 1H, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>), 2,13 (m, 1H, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>), 2,51 (t, 1H, C=CH), 2,70 – 2,83 (m, 4H, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>), 3,55 (q, 2H, CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>), 3,82 (s, 3H, OCH<sub>3</sub>), 4,15 (q, 1H, CHOH), 4,73 (d, 2H, OCH<sub>2</sub>), 6,53 (bs, 1H, NH), 6,73 – 7,31 (m, 8H, CH arom.)

d) Se agrega lentamente yoduro de etilo (1,5 g, 10 mmol) a temperatura ambiente a una mezcla de 2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida (3,0 g, 8,2 mmol), solución de hidróxido de sodio al 30% (7,0 ml, 41 mmol) y cantidades catalíticas de bromuro de tetrabutilamonio (50 mg) en 30 ml de diclorometano. La reacción se agita durante 16 horas a +40°C. Posteriormente, la mezcla es evaporada y el residuo se diluye con agua y diclorometano. Las fases son separadas y la fase acuosa se extrae tres veces con diclorometano. La capa orgánica combinada se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de sodio y se evapora. El aceite remanente es purificado por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/ hexano 1:1) para dar 2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida (Compuesto E1.02).

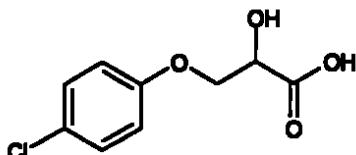
$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 1,19 (t, 3H,  $\text{CH}_3$ ), 1,88 – 2,12 (m, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 2,51 (t, 1H,  $\text{C}\equiv\text{CH}$ ), 2,70 (q, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 2,82 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,43 (dq, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,55 (q, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_3$ ), 3,71 (q, 1H, CHO), 3,88 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ ), 4,73 (d, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 6,67 (bs, 1H, NH), 6,72 – 7,31 (m, 8H, CH arom.).

**Ejemplo 2:** 3-(4-Cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida



(Compuesto E1.26)

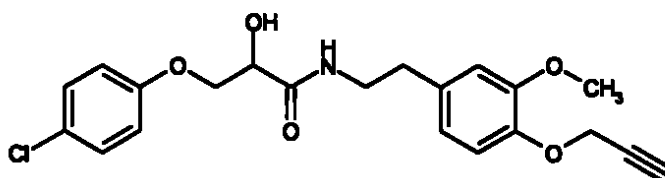
**a) Ácido 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-propiónico**



Una mezcla de ácido 3-cloroláctico (5,0 g, 40 mmol) y 4-clorofenol (9,3 g, 72 mmol) en 40 ml de hidróxido de sodio 3,3 N se agita bajo reflujo durante 2 horas. Subsiguientemente, la mezcla de reacción se enfría hasta temperatura ambiente y se acidifica hasta pH 3 con ácido clorhídrico concentrado. Los cristales blancos resultantes son filtrados y disueltos en agua caliente. Esta solución caliente es ajustada hasta pH 1 con ácido sulfúrico concentrado. Luego de enfriamiento, se recoge el ácido 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-propiónico como cristales claros.

$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 3,93 (d, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 4,14 (t, 1H,  $\text{CHOH}$ ), 6,74 (d, 2H, CH arom.), 7,12 (d, 2H, CH arom.). P.f.: 136°C.

b) 3-(4-Cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida



(Compuesto E1.24)

Se disuelven clorhidrato de 2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etilamina (5,0 g, 20 mmol) y N,N-diisopropiletilamina (10 g, 78 mmol) en 70 ml de N,N-dimetilformamida. A esta solución se agrega sucesivamente ácido 3-(4-clorofenoxi)-2-hidroxi-propiónico (4,3 g, 20 mmol) y hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris-(dimetilamino)-fosfonio (9,5 g, 22 mmol). La mezcla de reacción se agita durante 16 horas a temperatura ambiente, posteriormente se vuelca en agua helada y se extrae varias veces con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de sodio y se evapora al vacío. El aceite remanente es purificado por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo / hexano 6:4) para dar 3-(4-clorofenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida (Compuesto E1.24).

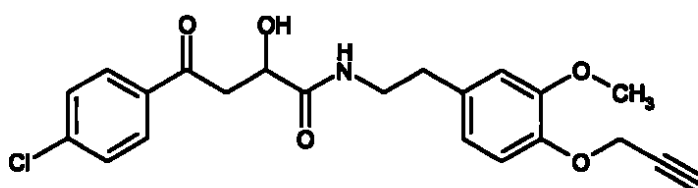
$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,52 (t, 1H,  $\text{C}\equiv\text{CH}$ ), 2,82 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,60 (q, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,87 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ ), 4,12 (m, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 4,23 (q, 1H,  $\text{CHOH}$ ), 4,76 (d, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 6,73- 7,29 (m, 8H, NH, CH arom.).

c) Una solución al 80% de bromuro de propargilo en tolueno (1,6 g, 11 mmol) se agrega lentamente a temperatura ambiente a una mezcla de 3-(4-clorofenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida (3,5 g, 8,7 mmol), solución de hidróxido de sodio al 30% (4,5 ml, 44 mmol) y cantidades catalíticas de bromuro de tetrabutylamonio (50 mg) en 30 ml de diclorometano. La reacción se agita durante 16 horas a  $+40^\circ\text{C}$ . Posteriormente, la mezcla se

evapora y el residuo se diluye con agua y diclorometano. Las fases se separan y la fase acuosa se extrae tres veces con diclorometano. La capa orgánica combinada se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de sodio y se evapora. El aceite remanente se purifica por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo / hexano 1 : 1) para dar 3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida (Compuesto E1.24).

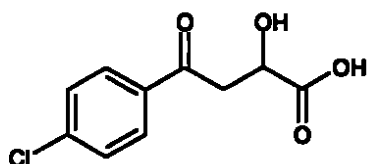
$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,38 (t, 1H,  $\text{C}=\text{CH}$ ), 2,43 (t, 1H,  $\text{C}=\text{CH}$ ), 2,73 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,50 (q, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,81 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ ), 4,11 (q, 1H,  $\text{CHO}$ ), 4,22 – 4,32 (m, 4H,  $\text{OCH}_2$ ), 4,68 (d, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 6,52 (bs, 1H, NH), 6,67 – 7,20 (m, 8H, NH, CH arom.).

**Ejemplo 3: 4-(4-Cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-oxo-butiramida**



(Compuesto E1.10)

**a) Acido 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-4-oxo-butírico**



Una mezcla de monohidrato de ácido glioxílico (4,6 g, 50 mmol) y 4-cloroacetofenona (15,4 g, 0,1 mol) se calienta a  $+95^\circ\text{C}$  bajo presión reducida (50 mbar) durante 3 horas. Durante este tiempo, el agua es eliminada continuamente. Después del enfriamiento, la mezcla de reacción es tomada en solución de

carbonato de sodio acuosa y extraída con éter dietílico. La capa acuosa es acidificada con ácido clorhídrico al 15% y extraída con acetato de etilo. La capa acuosa se seca sobre sulfato de sodio y se evapora, el residuo es cristalizado a partir de acetato de etilo / hexano para obtener ácido 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-4-oxo-butírico.

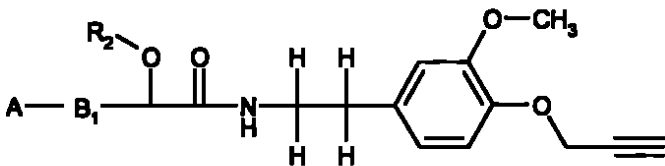
$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 3,41 (dd, 1H,  $\text{CH}_2$ ), 3,53 (dd, 1H,  $\text{CH}_2$ ), 4,65 (q, 1H,  $\text{CHOH}$ ), 7,38 – 7,92 (m, 4H, CH arom.).

b) Clorhidrato de 2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etilamina (5,4 g, 22 mmol) y N,N-diisopropiletilamina (11 g, 83 mmol) se disuelven en 70 ml de N,N-dimetilformamida. A esta solución se agregan sucesivamente ácido 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-4-oxo-butírico (4,8 g, 21 mmol) y hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris-(dimetilamino)-fosfonio (10 g, 23 mmol). La mezcla de reacción se agita durante 16 horas a temperatura ambiente, posteriormente se vuelca sobre agua con hielo y se extrae varias veces con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lava con salmuera, se seca sobre sulfato de sodio y se evapora al vacío. El aceite remanente se purifica por cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo / hexano 6 : 4) para dar 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-oxo-butiramida (Compuesto E1.10).

$^1\text{H}$ -RMN (300 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ): 2,51 (t, 1H,  $\text{C}\equiv\text{CH}$ ), 2,82 (t, 2H,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ), 3,27 (dd, 1H,  $\text{CH}_2$ ), 3,53 – 3,66 (m, 3H,  $\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ) 3,90 (s, 3H,  $\text{OCH}_3$ ), 4,62 (q, 1H,  $\text{CHOH}$ ), 4,74 (d, 2H,  $\text{OCH}_2$ ), 6,72 – 7,92 (m, 8H, NH, CH arom.).

De acuerdo con los procedimientos de los Ejemplos E1, E2 y E3 se obtienen los compuestos indicados en la tabla E1.

Tabla E1: (Ph designa fenilo)



| No.   | A                     | B                                          | R <sub>2</sub>                   | <sup>1</sup> H-NMR                                                                                                                                                                                           |
|-------|-----------------------|--------------------------------------------|----------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| E1.01 | Ph                    | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -         | H                                | 1.93 (q, 1H), 2.13 (m, 1H), 2.51 (t, 1H), 2.70 – 2.83 (m, 4H), 3.55 (q, 2H), 3.82 (s, 3H), 4.09 (q, 1H), 4.73 (d, 2H), 6.73 – 7.31 (m, 8H).                                                                  |
| E1.02 | Ph                    | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -         | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.19 (t, 3H), 1.88 – 2.12 (m, 2H), 2.51 (t, 1H), 2.70 (q, 2H), 2.82 (t, 2H), 3.43 (dq, 2H), 3.55 (q, 2H), 3.71 (q, 1H), 3.88 (s, 3H), 4.73 (d, 2H), 6.72 – 7.31 (m, 8H).                                     |
| E1.03 | Ph                    | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -         | CH <sub>2</sub> C=C<br>H-        | 2.06 (q, 1H), 2.20 (m, 1H), 2.54 (t, 1H), 2.59 (t, 1H), 2.78 (q, 2H), 2.89 (t, 2H), 3.62 (q, 2H), 3.92 (s, 3H), 4.05 (q, 1H), 4.19 (d, 2H), 4.81 (d, 2H), 6.82 – 7.39 (m, 8H).                               |
| E1.04 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -         | H                                | 1.82 (q, 1H), 2.05 (m, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.42 (t, 1H), 2.59 – 2.73 (m, 4H), 3.46 (q, 2H), 3.75 (s, 3H), 4.00 (q, 1H), 4.66 (d, 2H), 6.82 – 7.20 (m, 7H).                                                    |
| E1.05 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -         | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>  | 1.06 (t, 3H), 1.77 – 1.98 (m, 2H), 2.24 (s, 3H), 2.41 (t, 1H), 2.58 (q, 2H), 2.73 (t, 2H), 3.35 (q, 2H), 3.48 (q, 2H), 3.81 (q, 1H), 3.78 (s, 3H), 4.82 (d, 2H), 6.63 – 7.20 (m, 7H).                        |
| E1.06 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -         | -<br>CH <sub>2</sub> C=C<br>H    | 1.83 – 2.03 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.38 (t, 1H), 2.42 (t, 1H), 2.56 (q, 2H), 2.72 (t, 2H), 3.47 (q, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.86 (q, 1H), 4.02 (d, 2H), 4.63 (d, 2H), 6.64 – 7.20 (m, 7H).                        |
| E1.07 | Ph                    | -<br>CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> - | H                                | 1.32 (d, 3H), 1.84 (m, 1H), 2.17 (m, 1H), 2.51 (t, 1H), 2.76 (q, 2H), 3.00 (q, 1H), 3.49 (q, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.09 (m, 1H), 4.74 (d, 2H), 6.72 – 7.34 (m, 8H).                                             |
| E1.08 | Ph                    | -<br>CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> - | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.09 (t, 3H), 1.29 (d, 3H), 1.83 (m, 1H), 2.07 (m, 1H), 2.51 (t, 1H), 2.82 (q, 2H), 2.98 (q, 1H), 3.28 – 3.59 (m, 4H), 3.86 (s, 3H), 4.13 (q, 1H), 4.74 (d, 2H), 6.60 – 7.32 (m, 8H).                        |
| E1.09 | Ph                    | -CH(CH <sub>3</sub> )CH<br>z               | -<br>CH <sub>2</sub> C=C<br>H    | 1.33 (d, 2H), 1.93 (m, 1H), 2.19 (m, 1H), 2.44 (t, 1H), 2.53 (t, 1H), 2.83 (q, 2H), 3.07 (q, 1H), 3.56 (q, 2H), 3.92 (s, 3H), 4.00 (dd, 1H), 4.09 (dd, 1H), 4.20 (q, 1H), 4.81 (d, 2H), 6.74 – 7.40 (m, 8H). |
| E1.10 | 4-Cl-Ph               | -C(=O)CH <sub>2</sub> -                    | H                                | 2.51 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.27 (dd, 1H), 3.53 – 3.66 (m, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.62 (q, 1H), 4.74 (d, 2H), 6.72 – 7.92 (m, 7H).                                                                               |

|       |                       |                         |                                  |                                                                                                                                                     |
|-------|-----------------------|-------------------------|----------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| E1.11 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -C(=O)CH <sub>2</sub> - | H                                | 2.52 (s, 3H), 2.81 (t, 1H), 2.92 (t, 2H), 3.38 (dd, 1H), 3.62 - 3.73 (m, 3H), 4.00 (s, 3H), 4.70 (q, 1H), 4.84 (d, 2H), 6.84 - 7.97 (m, 7H).        |
| E1.12 | Ph                    | -OCH <sub>2</sub> -     | H                                | 2.72 (t, 1H), 3.03 (t, 2H), 3.79 (q, 2H), 4.06 (s, 3H), 4.32 (q, 2H), 4.45 (q, 1H), 4.94 (d, 2H), 6.92 - 7.58 (m, 8H).                              |
| E1.13 | Ph                    | -OCH <sub>2</sub> -     | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.22 (t, 3H), 2.51 (t, 1H), 2.83 (t, 2H), 3.52 - 3.63 (m, 4H), 3.90 (s, 3H), 4.10 - 4.19 (m, 3H), 4.76 (d, 2H), 6.75 - 7.32 (m, 8H).                |
| E1.14 | Ph                    | -OCH <sub>2</sub> -     | -<br>CH <sub>2</sub> C=C<br>H    | 2.43 (t, 1H), 2.50 (t, 1H), 2.79 (t, 2H), 3.53 (q, 2H), 3.84 (s, 3H), 4.19 (q, 1H), 4.30 (d, 2H), 4.38 (m, 2H), 4.72 (d, 2H), 6.71 - 7.28 (m, 8H).  |
| E1.15 | 4-F-Ph                | -OCH <sub>2</sub> -     | H                                | 2.39 (t, 1H), 2.89 (t, 2H), 3.45 (q, 2H), 3.73 (s, 3H), 3.98 (q, 2H), 4.06 (q, 1H), 4.61 (d, 2H), 6.58 - 6.89 (m, 7H).                              |
| E1.16 | 4-F-Ph                | -OCH <sub>2</sub> -     | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.20 (t, 3H), 2.51 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.52 - 3.70 (m, 4H), 3.89 (s, 3H), 4.07 - 4.15 (m, 2H), 4.31 (dd, 1H), 4.78 (d, 2H), 6.75 - 7.01 (m, 7H). |
| E1.17 | 4-F-Ph                | -OCH <sub>2</sub> -     | -<br>CH <sub>2</sub> C=C<br>H    | 2.48 (t, 1H), 2.53 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.58 (q, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.13 - 4.39 (m, 5H), 4.77 (d, 2H), 6.74 - 7.02 (m, 7H).                       |
| E1.18 | 2-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | H                                | 2.42 (t, 1H), 2.73 (t, 2H), 3.52 (q, 2H), 3.76 (s, 3H), 4.05 (dq, 2H), 4.18 (q, 1H), 4.64 (d, 2H), 6.61 - 7.30 (m, 7H).                             |
| E1.19 | 2-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.12 (t, 3H), 2.42 (t, 1H), 2.74 (t, 2H), 3.43 - 3.54 (m, 4H), 3.75 (q, 1H), 3.81 (s, 3H), 4.07 (q, 2H), 4.68 (d, 2H), 6.67 - 7.28 (m, 7H).         |
| E1.20 | 2-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.37 (t, 1H), 2.42 (t, 1H), 2.73 (t, 2H), 3.47 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.08 (q, 1H), 4.33 - 4.47 (m, 4H), 4.66 (d, 2H), 6.64 - 7.28 (m, 7H).         |
| E1.21 | 3-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | H                                | 2.42 (t, 1H), 2.73 (t, 2H), 3.50 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.05 (q, 2H), 4.17 (q, 1H), 4.68 (d, 2H), 6.63 - 7.18 (m, 7H).                              |
| E1.22 | 3-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.11 (t, 3H), 2.40 (t, 1H), 2.72 (t, 2H), 3.42 - 3.60 (m, 4H), 3.78 (s, 3H), 3.98 - 4.09 (m, 3H), 4.67 (d, 2H), 6.66 - 7.15 (m, 7H).                |
| E1.23 | 3-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.40 (t, 1H), 2.44 (t, 1H), 2.73 (t, 2H), 3.48 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.06 - 4.39 (m, 5H), 4.67 (d, 2H), 6.65 - 7.19 (m, 7H).                       |
| E1.24 | 4-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | H                                | 2.52 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.60 (q, 2H), 3.87 (s, 3H), 4.12 (m, 2H), 4.23 (q, 1H), 4.76 (d, 2H), 6.73 - 7.29 (m, 7H).                              |
| E1.25 | 4-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.19 (t, 3H), 2.51 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.55 - 3.69 (m, 4H), 3.89 (s, 3H), 4.06 - 4.20 (m, 3H), 4.77 (d, 2H), 6.78 - 7.28 (m, 7H).                |
| E1.26 | 4-Cl-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | -<br>CH <sub>2</sub> C=C<br>H    | 2.38 (t, 1H), 2.43 (t, 1H), 2.73 (t, 2H), 3.50 (q, 2H), 3.81 (s, 3H), 4.11 (q, 1H), 4.22 - 4.32 (m, 4H), 4.68 (d, 2H), 6.67 - 7.20 (m, 7H).         |
| E1.27 | 4-Br-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -     | H                                | 2.52 (t, 1H), 2.81 (t, 2H), 3.59 (q, 2H),                                                                                                           |

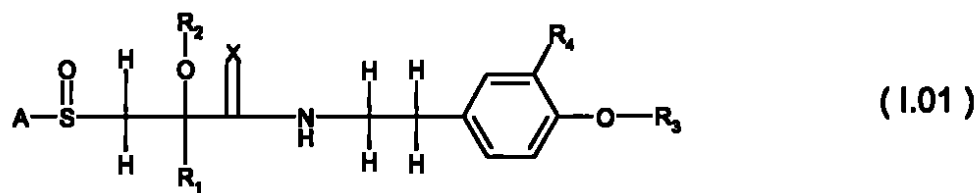
|       |                       |                                     |                                  |                                                                                                                                                                  |
|-------|-----------------------|-------------------------------------|----------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|       |                       |                                     |                                  | 3.87 (s, 3H), 4.06 – 4.23 (m, 3H), 4.76 (d, 2H), 6.72 – 7.42 (m, 7H).                                                                                            |
| E1.28 | 4-Br-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -                 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.17 (t, 3H), 2.48 (t, 1H), 2.79 (t, 2H), 3.50 – 3.66 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 4.05 – 4.26 (m, 3H), 4.73 (d, 2H), 6.72 – 7.38 (m, 7H).                             |
| E1.29 | 4-Br-Ph               | -OCH <sub>2</sub> -                 | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.72 (t, 1H), 2.77 (t, 1H), 3.05 (t, 2H), 3.81 (q, 2H), 4.13 (s, 3H), 4.39 – 4.63 (m, 5H), 4.98 (d, 2H), 6.99 – 7.63 (m, 7H).                                    |
| E1.30 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -OCH <sub>2</sub> -                 | H                                | 2.48 (s, 3H), 2.67 (t, 1H), 2.97 (t, 2H), 3.74 (q, 2H), 4.05 (s, 3H), 4.30 (m, 2H), 4.58 (q, 1H), 4.91 (d, 2H), 6.88 – 7.45 (m, 7H).                             |
| E1.31 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -OCH <sub>2</sub> -                 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.20 (t, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.51 (t, 1H), 2.83 (t, 2H), 3.53 – 3.82 (m, 4H), 3.90 (s, 3H), 4.12 (m, 2H), 4.34 (q, 1H), 4.76 (d, 2H), 6.73 – 7.30 (m, 7H).        |
| E1.32 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | -OCH <sub>2</sub> -                 | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.32 (s, 3H), 2.48 (t, 1H), 2.52 (t, 1H), 2.83 (t, 2H), 3.58 (q, 2H), 3.91 (s, 3H), 4.19 (q, 1H), 4.35 – 4.44 (m, 4H), 4.76 (d, 2H), 6.80 – 7.29 (m, 7H).        |
| E1.33 | 4-Cl-Ph               | -SCH <sub>2</sub> -                 | H                                | 2.51 (t, 1H), 2.78 (t, 2H), 3.04 (dd, 1H), 3.45 – 3.54 (m, 3H), 3.88 (s, 3H), 4.09 (q, 1H), 4.76 (d, 2H), 6.72 – 7.37 (m, 7H).                                   |
| E1.34 | 4-Cl-Ph               | -SCH <sub>2</sub> -                 | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0.99 (t, 3H), 2.41 (t, 1H), 2.70 (t, 2H), 3.02 (dd, 1H), 3.29 – 3.48 (m, 5H), 3.78 (s, 3H), 3.82 (q, 1H), 4.66 (d, 2H), 6.62 – 7.23 (m, 7H).                     |
| E1.35 | 4-Cl-Ph               | -SCH <sub>2</sub> -                 | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.31 (t, 1H), 2.40 (t, 1H), 2.68 (t, 2H), 3.08 (dd, 1H), 3.33 – 3.45 (m, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.02 – 4.10 (m, 3H), 4.64 (d, 2H), 6.62 – 7.25 (m, 7H).              |
| E1.36 | Ph                    | -CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> - | H                                | 2.53 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.57 (q, 2H), 3.78 (d, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.22 (q, 1H), 4.59 (s, 2H), 4.79 (d, 2H), 6.73 – 7.41 (m, 8H).                             |
| E1.37 | Ph                    | -CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> - | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.03 (t, 3H), 2.33 (t, 1H), 2.64 (t, 2H), 3.31 – 3.55 (m, 6H), 3.64 – 3.78 (m, 6H), 4.40 (s, 2H), 4.61 (d, 2H), 6.59 – 7.23 (m, 8H).                             |
| E1.38 | Ph                    | -CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> - | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.36 (t, 1H), 2.42 (t, 1H), 2.71 (t, 2H), 3.45 (q, 2H), 3.68 (d, 2H), 3.80 (s, 3H), 4.12 (q, 1H), 4.20 (d, 2H), 4.49 (s, 2H), 4.67 (d, 2H), 6.65 – 7.28 (m, 8H). |
| E1.39 | 4-F-Ph                | -SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - | H                                | 1.91 (m, 1H), 2.09 (m, 1H), 2.53 (t, 1H), 2.79 (t, 2H), 3.02 (m, 2H), 3.56 (q, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.26 (q, 1H), 4.75 (d, 2H), 6.71 – 7.37 (m, 7H).               |
| E1.40 | 4-F-Ph                | -SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> - | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 1.90 – 2.09 (m, 2H), 2.47 (t, 1H), 2.52 (t, 1H), 2.81 (t, 2H), 2.93 (m, 2H), 3.58 (q, 2H), 3.89 (s, 3H), 4.05 – 4.18 (m, 3H), 4.73 (d, 2H), 6.72 – 7.38 (m, 7H). |
| E1.41 | 4-F-Ph                | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -  | H                                | 1.76 (q, 1H), 1.94 (m, 1H), 2.37 (t, 1H), 2.53 – 2.68 (m, 4H), 3.49 (q, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.95 (q, 1H), 4.59 (d, 2H), 6.57 – 7.02 (m, 7H).                      |
| E1.42 | 4-F-Ph                | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -  | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.01 (t, 3H), 1.74 (q, 1H), 1.85 (m, 1H), 2.34 (t, 1H), 2.49 (t, 2H), 2.66 (t, 2H), 3.28                                                                         |

|       |                                           |                                                                           |                                  |                                                                                                                                                                                                      |
|-------|-------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------|----------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|       |                                           |                                                                           |                                  | (dq, 2H), 3.39 (q, 2H), 3.52 (q, 1H), 3.72 (s, 3H), 4.58 (d, 2H), 6.58 – 7.00 (m, 7H).                                                                                                               |
| E1.43 | 4-F-Ph                                    | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                                        | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 1.80 – 2.01 (m, 2H), 2.38 (t, 1H), 2.43 (t, 1H), 2.58 (t, 2H), 2.72 (t, 2H), 3.48 (q, 2H), 3.79 (s, 3H), 3.87 (q, 1H), 4.01 (d, 2H), 4.65 (d, 2H), 6.64 – 7.08 (m, 7H).                              |
| E1.44 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -<br>Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                                        | H                                | 1.09 (t, 3H), 1.78 (q, 1H), 1.98 (m, 1H), 2.35 (t, 1H), 2.47 (q, 2H), 2.58 (t, 2H), 2.64 (t, 2H), 3.41 (q, 2H), 3.70 (s, 3H), 3.98 (q, 1H), 4.59 (d, 2H), 6.57 – 7.00 (m, 7H).                       |
| E1.45 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -<br>Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                                        | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.16 (t, 3H), 1.25 (t, 3H), 1.92 (q, 1H), 2.05 (m, 1H), 2.50 (t, 1H), 2.59 – 2.70 (m, 4H), 2.81 (t, 2H), 3.43 (dq, 2H), 3.58 (q, 2H), 3.71 (q, 1H), 3.88 (s, 3H), 4.74 (d, 2H), 6.72 – 7.13 (m, 7H). |
| E1.46 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -<br>Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -                                        | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 1.23 (t, 3H), 1.97 (q, 1H), 2.09 (m, 1H), 2.48 (t, 1H), 2.51 (t, 1H), 2.59 – 2.69 (m, 4H), 2.80 (t, 2H), 3.55 (q, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.96 (q, 1H), 4.12 (d, 2H), 4.73 (d, 2H), 6.73 – 7.15 (m, 7H).  |
| E1.47 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -<br>Ph | -OCH <sub>2</sub> -                                                       | H                                | 1.15 (t, 3H), 2.42 (t, 1H), 2.52 (t, 2H), 2.72 (t, 2H), 3.51 (q, 2H), 3.79 (s, 3H), 4.02 – 4.13 (m, 2H), 4.33 (q, 1H), 4.68 (d, 2H), 6.64 – 7.07 (m, 7H).                                            |
| E1.48 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -<br>Ph | -OCH <sub>2</sub> -                                                       | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.32 – 1.41 (m, 6H), 2.67 (t, 1H), 2.74 (q, 2H), 2.97 (t, 2H), 3.68 – 3.77 (m, 4H), 4.03 (s, 3H), 4.27 (q, 2H), 4.49 (q, 1H), 4.92 (d, 2H), 6.91 – 7.29 (m, 7H).                                     |
| E1.49 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -<br>Ph | -OCH <sub>2</sub> -                                                       | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 1.22 (t, 3H), 2.48 (t, 1H), 2.53 (t, 1H), 2.60 (q, 2H), 2.83 (t, 2H), 3.55 (q, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.17 (q, 1H), 4.31 – 4.43 (m, 4H), 4.76 (d, 2H), 6.75 – 7.11 (m, 7H).                              |
| E1.50 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                   | -OCH <sub>2</sub> -                                                       | H                                | 2.52 (t, 1H), 2.83 (t, 2H), 3.60 (q, 2H), 3.88 (s, 3H), 4.09 – 4.25 (m, 3H), 4.77 (d, 2H), 6.73 – 7.38 (m, 7H).                                                                                      |
| E1.51 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                   | -OCH <sub>2</sub> -                                                       | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.50 (t, 1H), 2.53 (t, 1H), 2.82 (t, 2H), 3.58 (q, 2H), 3.90 (s, 3H), 4.18 (m, 2H), 4.31 – 4.43 (m, 3H), 4.77 (d, 2H), 6.74 – 7.35 (m, 6H).                                                          |
| E1.52 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                     | -SCH <sub>2</sub> -                                                       | H                                | 2.25 (s, 3H), 2.42 (t, 1H), 2.68 (t, 2H), 2.90 (dd, 1H), 3.35 – 3.44 (m, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.95 (q, 1H), 4.68 (d, 2H), 6.62 – 7.24 (m, 7H).                                                         |
| E1.53 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                     | -SCH <sub>2</sub> -                                                       | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.12 (t, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.50 (t, 1H), 2.79 (t, 2H), 3.10 (dd, 1H), 3.39 – 3.54 (m, 5H), 3.85 (s, 3H), 3.89 (q, 1H), 4.76 (d, 2H), 6.72 – 7.32 (m, 7H).                                           |
| E1.54 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                     | -SCH <sub>2</sub> -                                                       | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.24 (s, 3H), 2.33 (t, 1H), 2.42 (t, 1H), 2.70 (t, 2H), 3.05 (dd, 1H), 3.36 – 3.47 (m, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.03 – 4.12 (m, 3H), 4.68 (d, 2H), 6.63 – 7.22 (m, 7H).                                    |
| E1.55 | Ph                                        | -<br>CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub><br>- | H                                | 1.22 (q, 2H), 1.33 – 1.47 (m, 4H), 2.26 (t, 1H), 2.38 (t, 2H), 2.52 (t, 2H), 3.29 (q, 2H), 3.62 (s, 3H), 3.83 (q, 1H), 4.50 (d, 2H), 6.47 – 7.06 (m, 8H).                                            |
| E1.56 | Ph                                        | -                                                                         | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 0.99 (t, 3H), 1.28 (q, 2H), 1.41 – 1.52 (m,                                                                                                                                                          |

|       |         |                                                                           |                                  |                                                                                                                                                                                       |
|-------|---------|---------------------------------------------------------------------------|----------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|       |         | CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub><br>-      |                                  | 4H), 2.34 (t, 1H), 2.48 (t, 2H), 2.63 (t, 2H), 3.28 (q, 2H), 3.40 (q, 2H), 3.53 (q, 1H), 3.72 (s, 3H), 4.62 (d, 2H), 6.58 – 7.16 (m, 8H).                                             |
| E1.57 | Ph      | -<br>CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub><br>- | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 1.36 (q, 2H), 1.51 – 1.63 (m, 4H), 2.36 (t, 1H), 2.42 (t, 1H), 2.54 (t, 2H), 2.72 (t, 2H), 3.49 (q, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.87 (q, 1H), 4.02 (d, 2H), 4.69 (d, 2H), 6.65 – 7.23 (m, 8H). |
| E1.58 | 4-Cl-Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -                       | H                                | 2.50 (t, 1H), 2.72 (t, 2H), 2.80 (t, 2H), 3.43 (q, 2H), 3.58 – 3.69 (m, 4H), 3.88 (s, 3H), 4.09 (q, 1H), 4.73 (d, 2H), 6.69 – 7.27 (m, 7H).                                           |
| E1.59 | 4-Cl-Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -                       | -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | 1.05 (t, 3H), 2.42 (t, 1H), 2.65 – 2.78 (m, 4H), 3.31 – 3.60 (m, 8H), 3.77 (q, 1H), 3.80 (s, 3H), 4.66 (d, 2H), 6.62 – 7.19 (m, 7H).                                                  |
| E1.60 | 4-Cl-Ph | -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -                       | -<br>CH <sub>2</sub> C≡C<br>H    | 2.39 (t, 1H), 2.44 (t, 1H), 2.72 (t, 2H), 2.78 (t, 2H), 3.43 (q, 2H), 3.59 (q, 2H), 3.82 (s, 3H), 4.07 (q, 1H), 4.13 (d, 2H), 4.69 (d, 2H), 6.66 – 7.20 (m, 7H).                      |

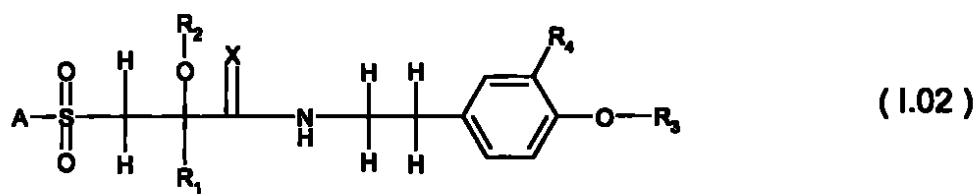
Análogamente a los ejemplos antes proporcionados se obtienen los compuestos de las tablas 1 a 64.

**Tabla 1:** Compuestos representados por la Fórmula I.01



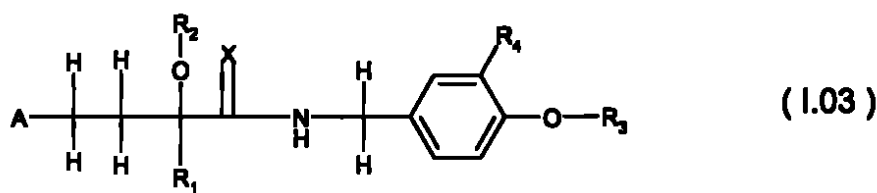
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 2:** Compuestos representados por la Fórmula I.02



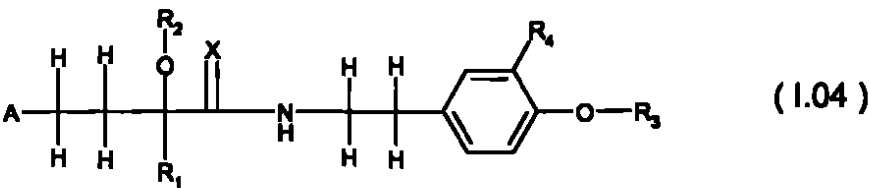
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 3:** Compuestos representados por la Fórmula I.03



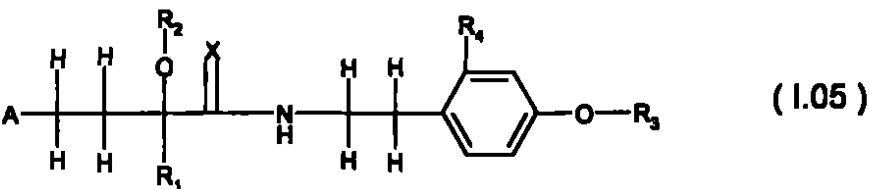
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 4:** Compuestos representados por la Fórmula I.04



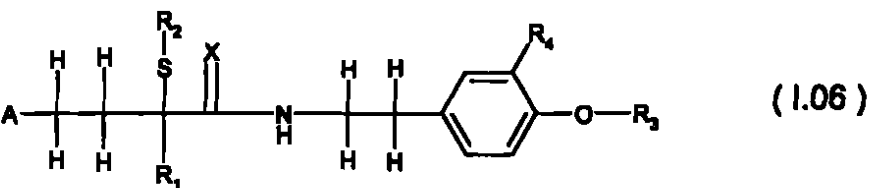
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 5: Compuestos representados por la Fórmula I.05



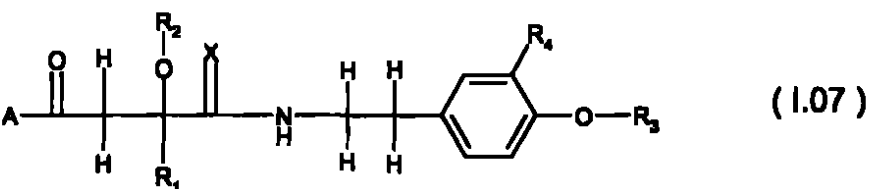
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 6: Compuestos representados por la Fórmula I.06



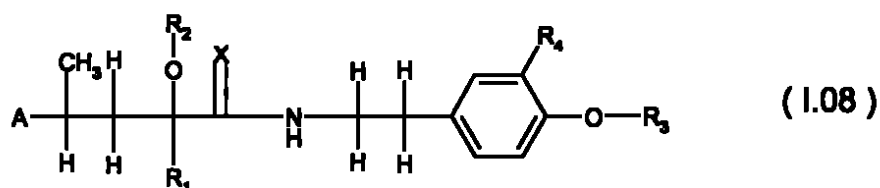
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 7: Compuestos representados por la Fórmula I.07



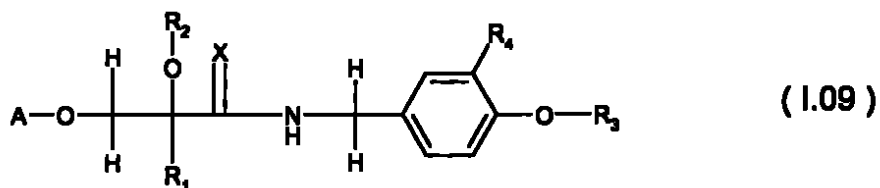
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 8:** Compuestos representados por la Fórmula I.08



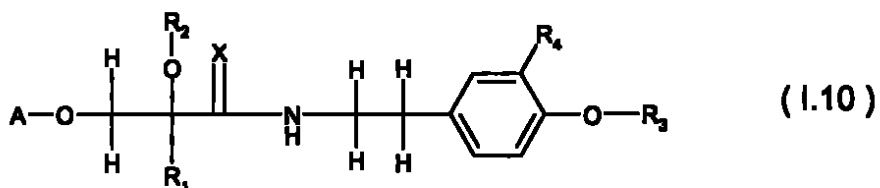
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 9:** Compuestos representados por la Fórmula I.09



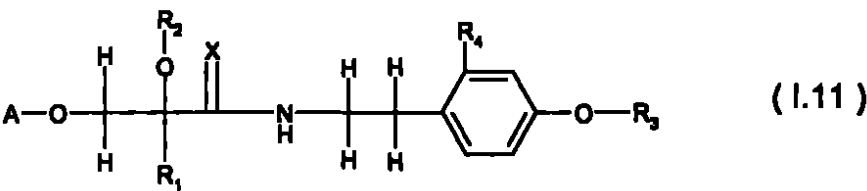
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 10:** Compuestos representados por la Fórmula I.10



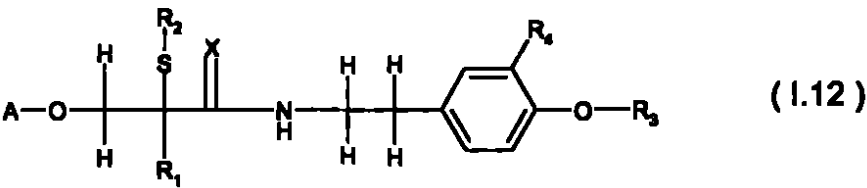
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 11:** Compuestos representados por la Fórmula I.11



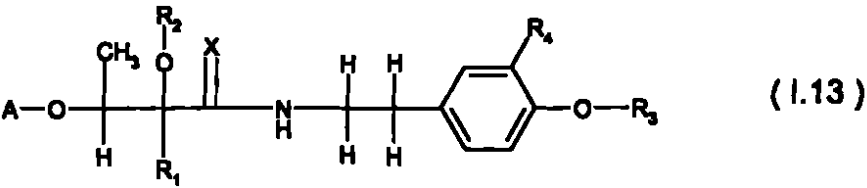
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 12: Compuestos representados por la Fórmula I.12



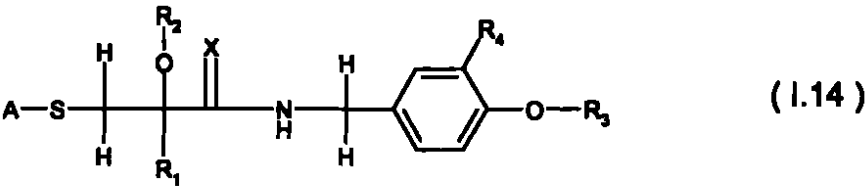
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 13: Compuestos representados por la Fórmula I.13



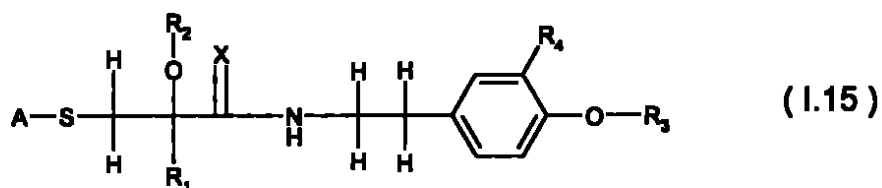
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 14: Compuestos representados por la Fórmula I.14



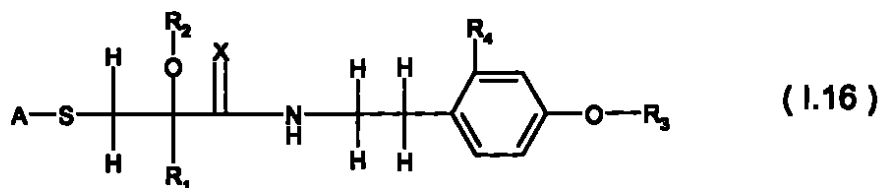
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 15: Compuestos representados por la Fórmula I.15



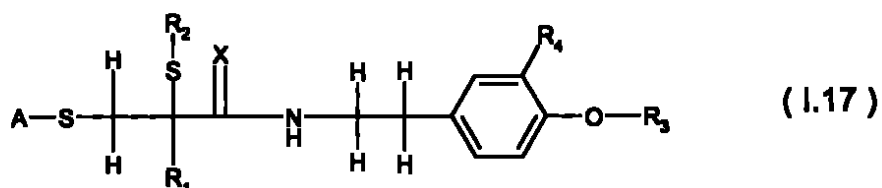
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 16: Compuestos representados por la Fórmula I.16



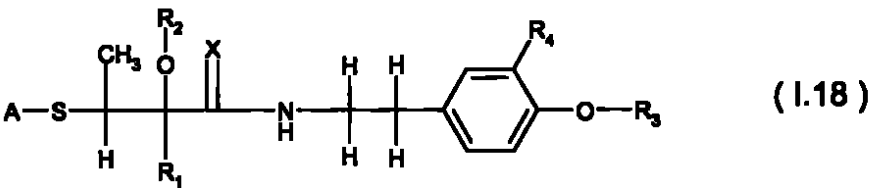
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 17: Compuestos representados por la Fórmula I.17



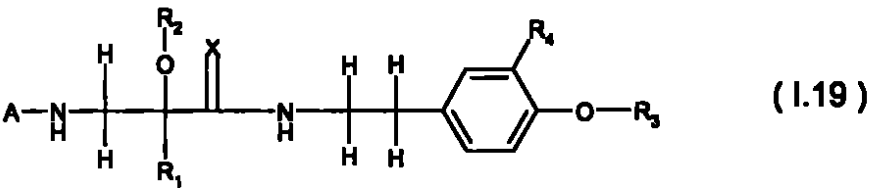
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 18: Compuestos representados por la Fórmula I.18



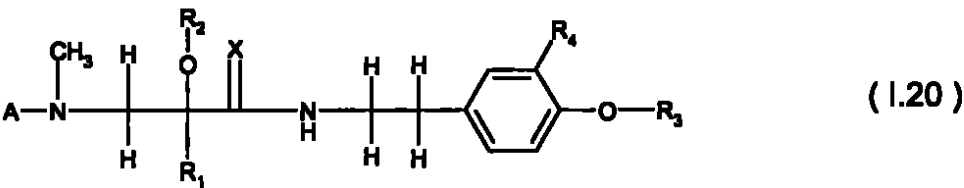
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 19: Compuestos representados por la Fórmula I.19



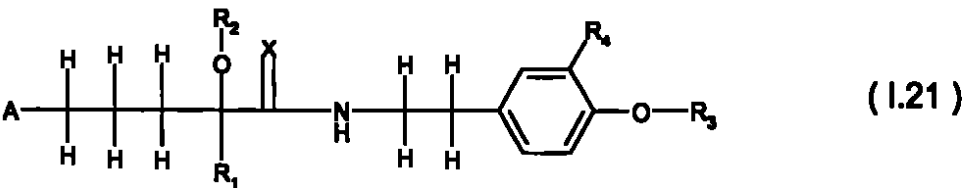
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 20: Compuestos representados por la Fórmula I.20



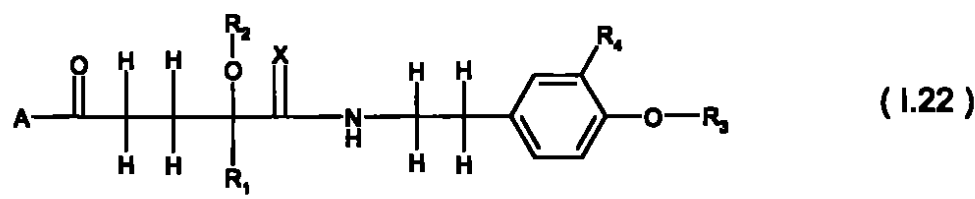
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 21: Compuestos representados por la Fórmula I.21



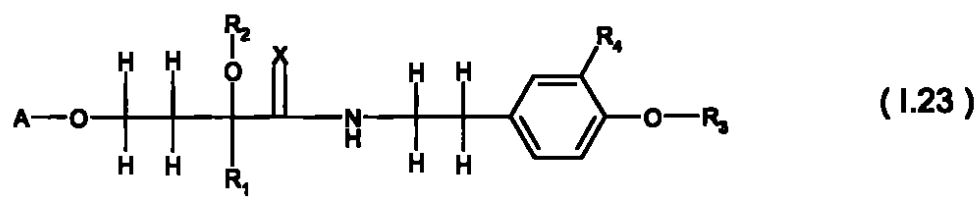
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 22: Compuestos representados por la Fórmula I.22



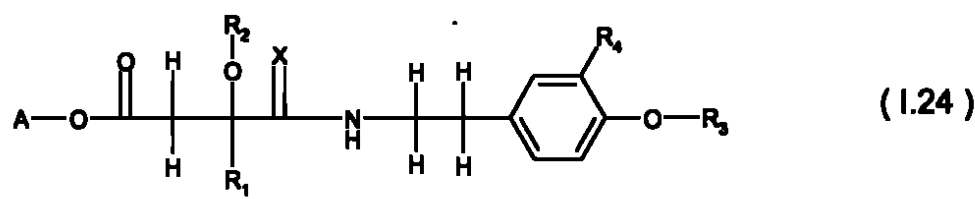
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 23: Compuestos representados por la Fórmula I.23



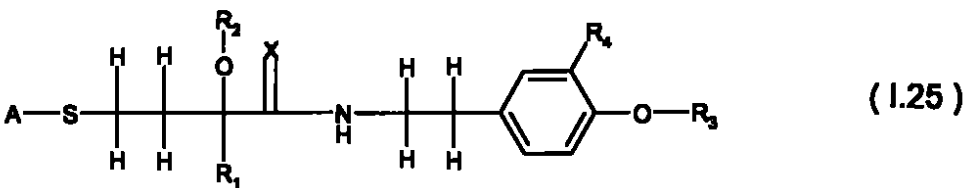
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 24: Compuestos representados por la Fórmula I.24



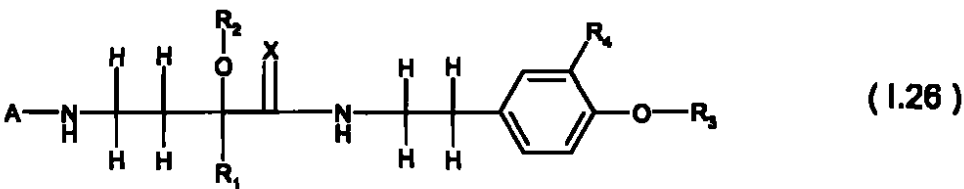
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 25: Compuestos representados por la Fórmula I.25



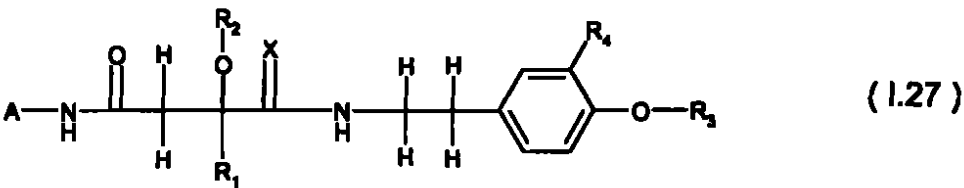
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 26: Compuestos representados por la Fórmula 1.26



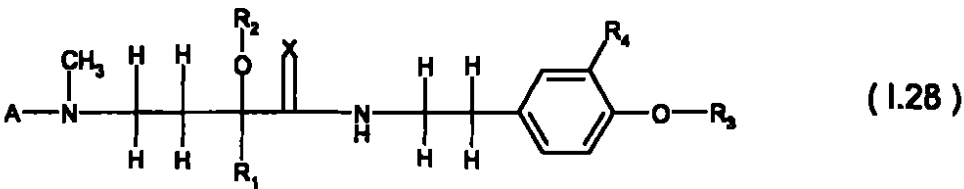
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 27: Compuestos representados por la Fórmula 1.27



en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 28: Compuestos representados por la Fórmula 1.28





$$\begin{array}{c} \text{H} & \text{H} & \text{R}_2 & \text{X} & \text{H} & \text{H} & \text{R}_4 \\ | & | & | & || & | & | & | \\ \text{A}-\text{C}-\text{S}-\text{C}-\text{C}-\text{N}-\text{C}-\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}-\text{R}_3 \\ | & | & | & & | & | & | \\ \text{H} & \text{H} & \text{O} & & \text{H} & \text{H} & \text{O} \\ & & \text{R}_1 & & & & \end{array} \quad (1.32)$$

en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 33: Compuestos representados por la Fórmula I.33**

$$\begin{array}{c} \text{H} & \text{H} & \text{R}_2 & \text{X} & \text{H} & \text{H} & \text{R}_4 \\ | & | & | & || & | & | & | \\ \text{A}-\text{C}-\text{N}-\text{C}-\text{C}-\text{C}-\text{N}-\text{C}-\text{C}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{O}-\text{R}_3 \\ | & | & | & & | & | & | \\ \text{H} & \text{H} & \text{R}_1 & & \text{H} & \text{H} & \end{array} \quad (1.33)$$

en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 34: Compuestos representados por la Fórmula I.34**

$$\text{A}-\overset{\text{O}}{\parallel}\text{N}-\underset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\underset{\text{R}_1}{\underset{\text{O}-\text{R}_2}{\text{C}}}-\overset{\text{X}}{\parallel}\text{N}-\underset{\text{H}}{\underset{\text{H}}{\text{C}}}-\underset{\text{H}}{\text{C}}-\text{C}_6\text{H}_3(\text{R}_4)-\text{O}-\text{R}_3 \quad (1.34)$$

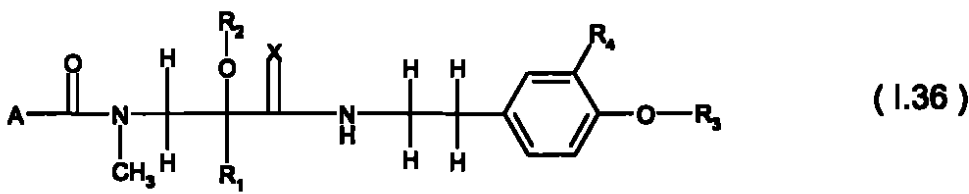
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 35: Compuestos representados por la Fórmula I.35**

$$\begin{array}{c} \text{H} \quad \text{CH}_3 \quad \text{H} \quad \text{O} \quad \text{X} \\ | \quad | \quad | \quad | \quad || \\ \text{A} - \text{C} - \text{N} - \text{C} - \text{C} - \text{N} - \text{C} - \text{C} - \text{C}_6\text{H}_4 - \text{O} - \text{R}_3 \\ | \quad | \quad | \quad | \quad | \quad | \quad | \\ \text{H} \quad \text{H} \quad \text{H} \quad \text{R}_2 \quad \text{R}_1 \quad \text{H} \quad \text{H} \end{array} \quad (1.35)$$

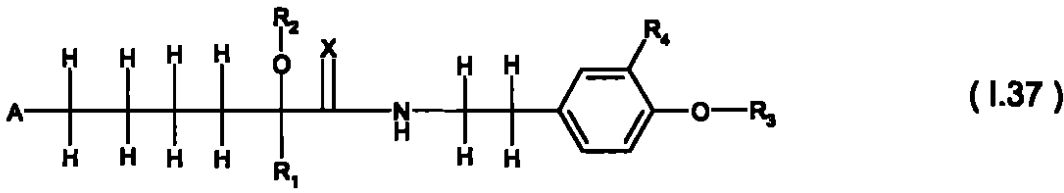
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 36:** Compuestos representados por la Fórmula I.36



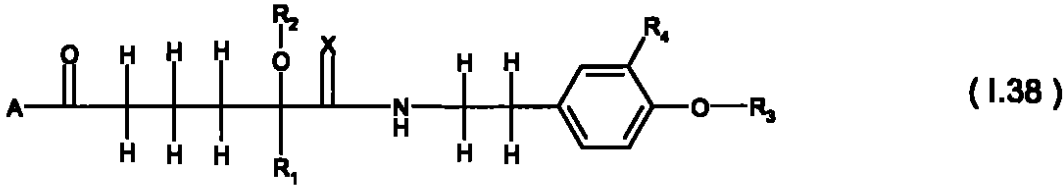
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 37:** Compuestos representados por la Fórmula I.37



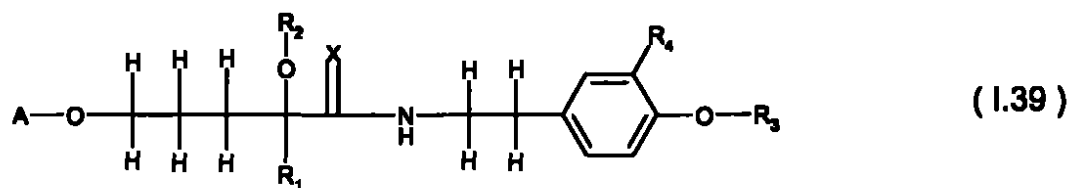
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 38:** Compuestos representados por la Fórmula I.38



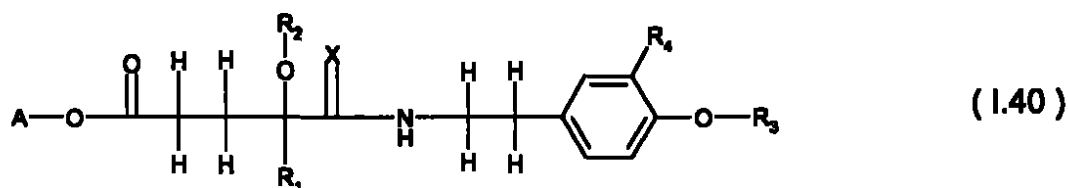
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 39:** Compuestos representados por la Fórmula I.39



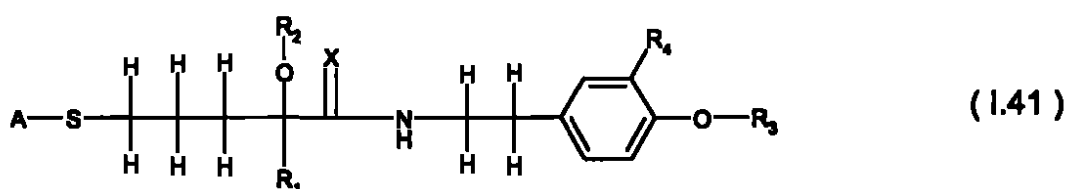
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 40: Compuestos representados por la Fórmula I.40



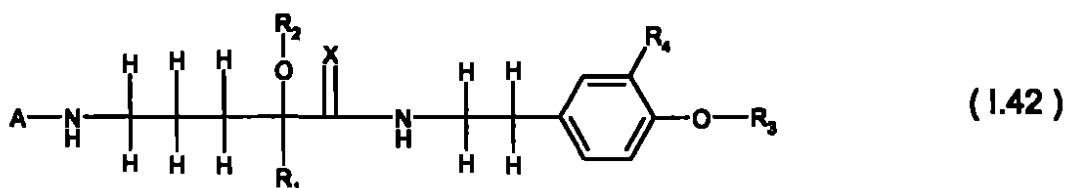
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 41: Compuestos representados por la Fórmula I.41



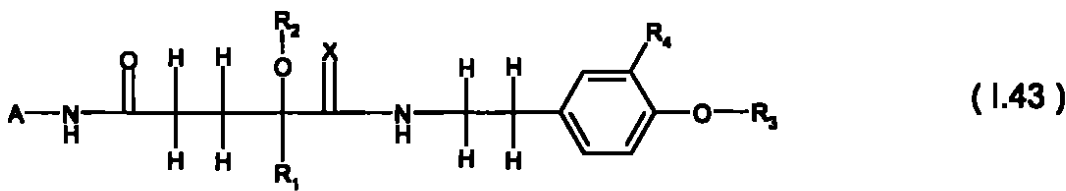
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 42: Compuestos representados por la Fórmula I.42



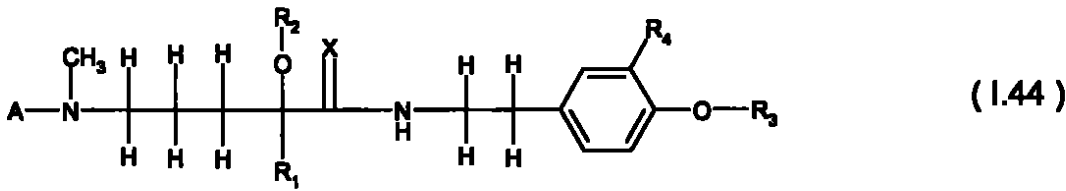
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 43: Compuestos representados por la Fórmula I.43



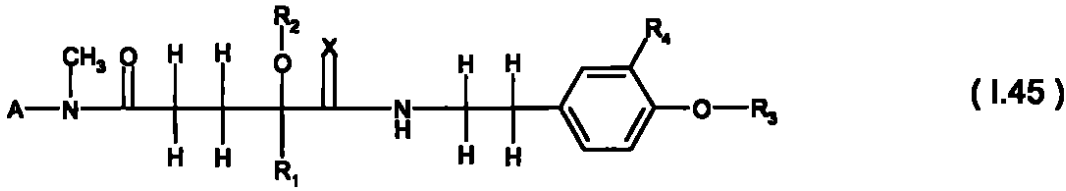
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 44: Compuestos representados por la Fórmula I.44



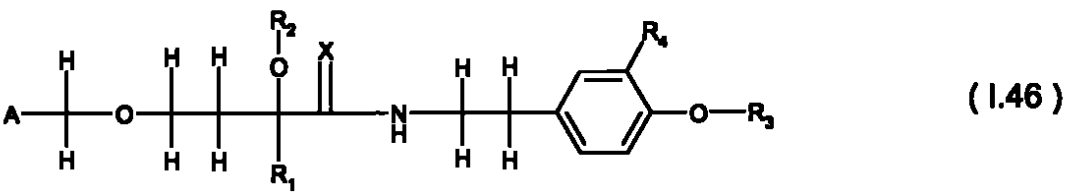
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 45: Compuestos representados por la Fórmula I.45



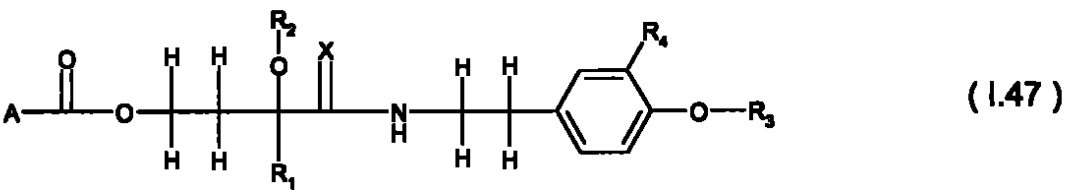
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 46: Compuestos representados por la Fórmula I.46



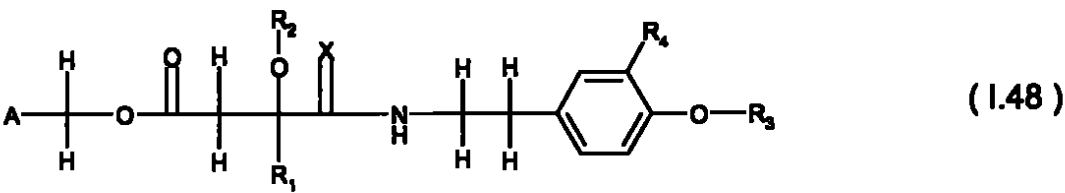
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 47: Compuestos representados por la Fórmula I.47



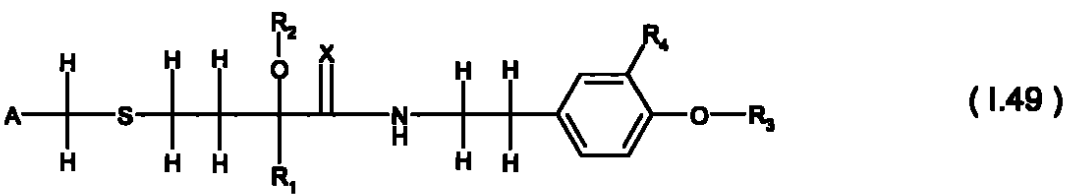
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 48: Compuestos representados por la Fórmula I.48



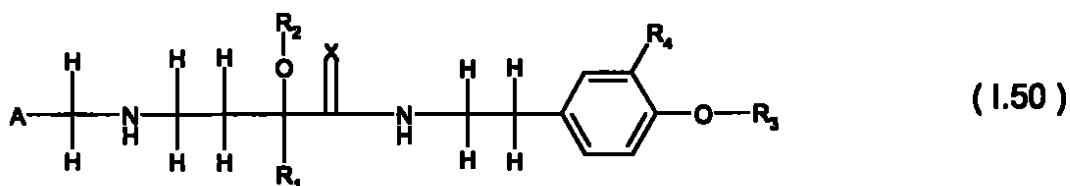
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 49: Compuestos representados por la Fórmula I.49



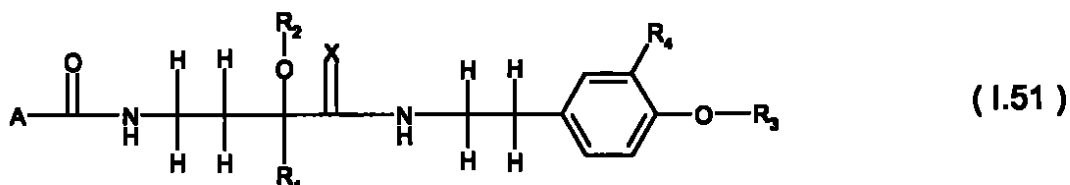
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 50: Compuestos representados por la Fórmula I.50**



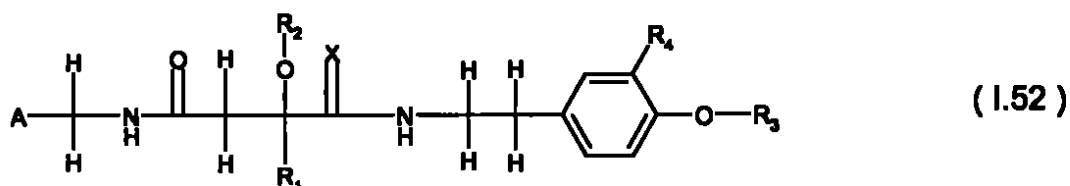
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 51: Compuestos representados por la Fórmula I.51**



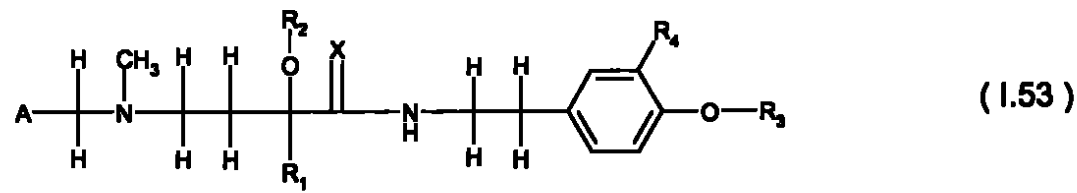
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 52: Compuestos representados por la Fórmula 1.52**



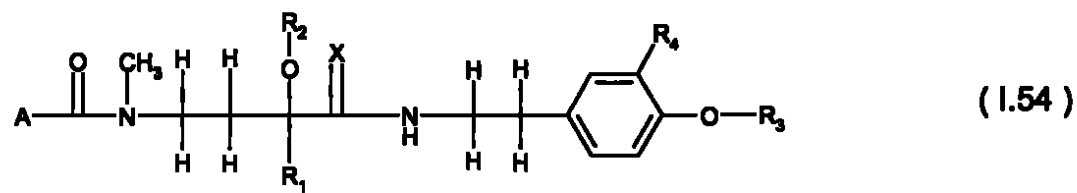
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 53: Compuestos representados por la Fórmula I.53**



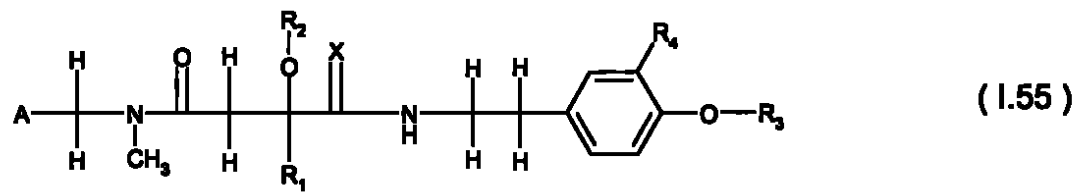
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 54: Compuestos representados por la Fórmula I.54



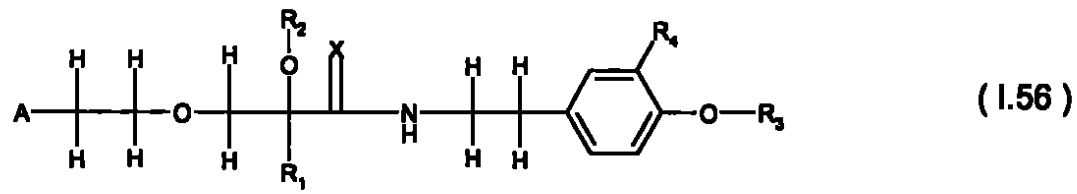
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 55: Compuestos representados por la Fórmula I.55



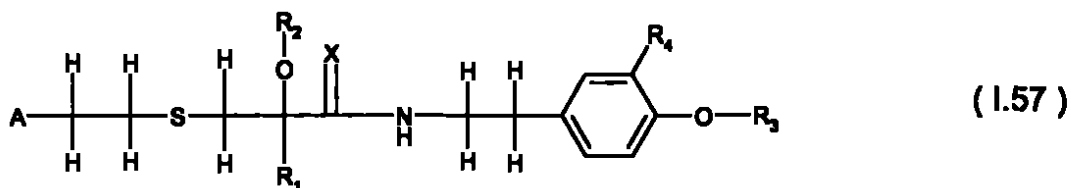
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 56: Compuestos representados por la Fórmula I.56



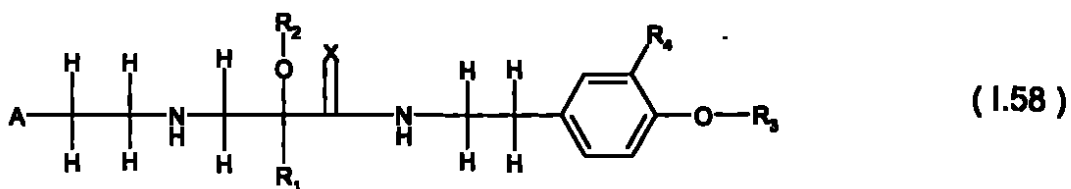
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 57:** Compuestos representados por la Fórmula I.57



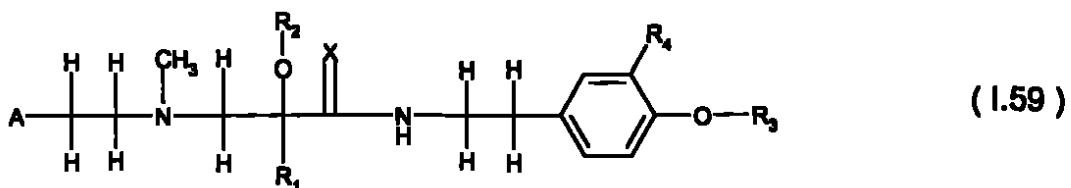
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 58:** Compuestos representados por la Fórmula I.58



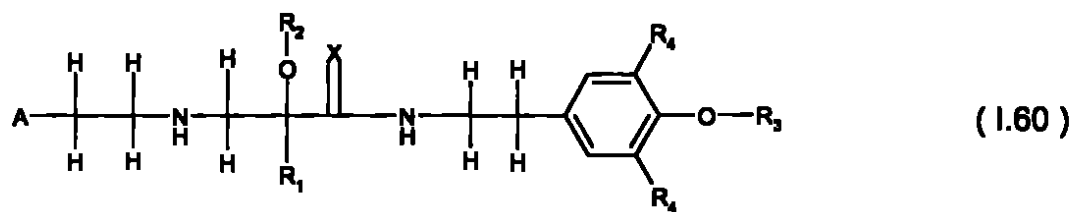
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 59:** Compuestos representados por la Fórmula I.59



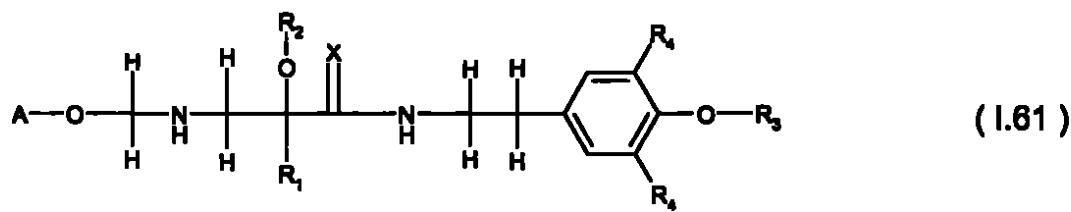
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 60:** Compuestos representados por la Fórmula I.60



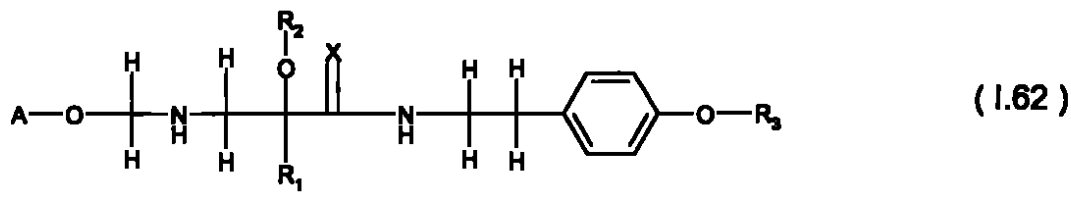
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 61: Compuestos representados por la Fórmula I.61



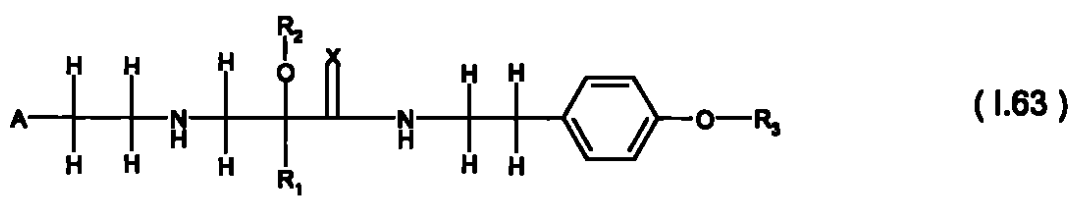
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 62: Compuestos representados por la Fórmula I.62



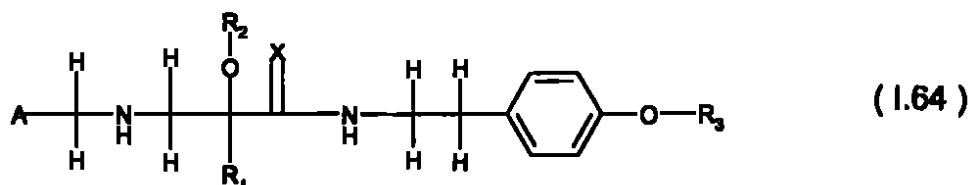
en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla 63: Compuestos representados por la Fórmula I.63



en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

**Tabla 64:** Compuestos representados por la Fórmula I.64



en donde la combinación de los grupos A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub> y X corresponde cada uno a una hilera en la tabla A.

Tabla A: (Ph designa fenilo)

| No. | A                     | R <sub>1</sub>  | R <sub>2</sub>                  | R <sub>3</sub>                    | R <sub>4</sub>   | X |
|-----|-----------------------|-----------------|---------------------------------|-----------------------------------|------------------|---|
| 001 | Ph                    | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 002 | Ph                    | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 003 | Ph                    | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C <sup>o</sup> CH | OCH <sub>3</sub> | O |
| 004 | Ph                    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 005 | Ph                    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 006 | Ph                    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 007 | Ph                    | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 008 | Ph                    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | CH <sub>3</sub>  | O |
| 009 | Ph                    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | S |
| 010 | 4-F-Ph                | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 011 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 012 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 013 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 014 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 015 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 016 | 4-F-Ph                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 017 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | CH <sub>3</sub>  | O |
| 018 | 4-F-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | S |
| 019 | 4-Cl-Ph               | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 020 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 021 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 022 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 023 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 024 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 025 | 4-Cl-Ph               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 026 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | CH <sub>3</sub>  | O |
| 027 | 4-Cl-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | S |
| 028 | 4-Br-Ph               | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 029 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 030 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 031 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 032 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>   | OCH <sub>3</sub> | O |
| 033 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 034 | 4-Br-Ph               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 035 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | CH <sub>3</sub>  | O |
| 036 | 4-Br-Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | S |
| 037 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 038 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |
| 039 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH              | OCH <sub>3</sub> | O |

|     |                                       |                 |                                 |                                 |                  |   |
|-----|---------------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 040 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 041 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 042 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 043 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 044 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>  | O |
| 045 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 046 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 047 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 048 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 049 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 050 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 051 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 052 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 053 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>  | O |
| 054 | 4-CF <sub>3</sub> -Ph                 | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 055 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 056 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 057 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 058 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 059 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 060 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 061 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 062 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>  | O |
| 063 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 064 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 065 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 066 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 067 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 068 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 069 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 070 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 071 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>  | O |
| 072 | 4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 073 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 074 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 075 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 076 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 077 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 078 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 079 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 080 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>  | O |
| 081 | 3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph               | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 082 | 2-F-Ph                                | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |

|     |                        |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 083 | 2-F-Ph                 | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 084 | 2-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 085 | 2-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 086 | 2-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 087 | 2-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 088 | 2-Cl-Ph                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 089 | 2-Cl-Ph                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 090 | 2-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 091 | 2-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 092 | 2-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 093 | 2-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 094 | 2-CH <sub>3</sub> -Ph  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 095 | 2-CH <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 096 | 2-CH <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 097 | 2-CH <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 098 | 2-CH <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 099 | 2-CH <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 100 | 2-CF <sub>3</sub> -Ph  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 101 | 2-CF <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 102 | 2-CF <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 103 | 2-CF <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 104 | 2-CF <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 105 | 2-CF <sub>3</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 106 | 2-CN-Ph                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 107 | 2-CN-Ph                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 108 | 2-CN-Ph                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 109 | 2-CN-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 110 | 2-CN-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 111 | 2-CN-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 112 | 2-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 113 | 2-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 114 | 2-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 115 | 2-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 116 | 2-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 117 | 2-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 118 | 3-F-Ph                 | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 119 | 3-F-Ph                 | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 120 | 3-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 121 | 3-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 122 | 3-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 123 | 3-F-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 124 | 3-Cl-Ph                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 125 | 3-Cl-Ph                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |

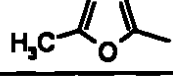
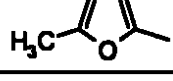
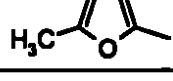
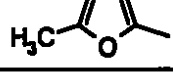
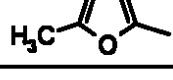
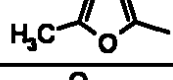
|     |                          |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|--------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 126 | 3-Cl-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 127 | 3-Cl-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 128 | 3-Cl-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 129 | 3-Cl-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 130 | 3-Br-Ph                  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 131 | 3-Br-Ph                  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 132 | 3-Br-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 133 | 3-Br-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 134 | 3-Br-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 135 | 3-Br-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 136 | 3-CH <sub>3</sub> -Ph    | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 137 | 3-CH <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 138 | 3-CH <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 139 | 3-CH <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 140 | 3-CH <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 141 | 3-CH <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 142 | 3-CF <sub>3</sub> -Ph    | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 143 | 3-CF <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 144 | 3-CF <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 145 | 3-CF <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 146 | 3-CF <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 147 | 3-CF <sub>3</sub> -Ph    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 148 | 3-CN-Ph                  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 149 | 3-CN-Ph                  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 150 | 3-CN-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 151 | 3-CN-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 152 | 3-CN-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 153 | 3-CN-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 154 | 3-CH <sub>3</sub> O-Ph   | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 155 | 3-CH <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 156 | 3-CH <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 157 | 3-CH <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 158 | 3-CH <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 159 | 3-CH <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 160 | 3-CF <sub>3</sub> O-Ph   | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 161 | 3-CF <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 162 | 3-CF <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 163 | 3-CF <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 164 | 3-CF <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 165 | 3-CF <sub>3</sub> O-Ph   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 166 | 4-CH <sub>2</sub> =CH-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 167 | 4-CH <sub>2</sub> =CH-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 168 | 4-CH <sub>2</sub> =CH-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |

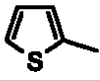
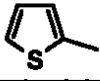
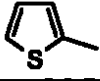
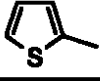
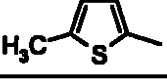
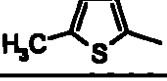
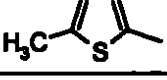
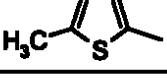
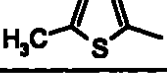
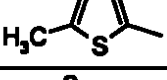
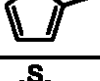
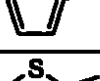
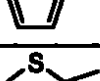
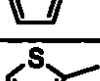
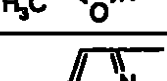
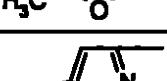
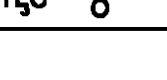
|     |                                                       |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 169 | 4-CH <sub>2</sub> =CH-Ph                              | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 170 | 4-CH <sub>2</sub> =CH-Ph                              | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 171 | 4-CH <sub>2</sub> =CH-Ph                              | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 172 | 4-CH≡C-Ph                                             | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 173 | 4-CH≡C-Ph                                             | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 174 | 4-CH≡C-Ph                                             | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 175 | 4-CH≡C-Ph                                             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 176 | 4-CH≡C-Ph                                             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 177 | 4-CH≡C-Ph                                             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 178 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 179 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 180 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 181 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 182 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 183 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 184 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-Ph               | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 185 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-Ph               | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 186 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-Ph               | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 187 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 188 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 189 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 190 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-Ph                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 191 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-Ph                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 192 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-Ph                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 193 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 194 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 195 | 4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 196 | 4-CN-Ph                                               | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 197 | 4-CN-Ph                                               | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 198 | 4-CN-Ph                                               | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 199 | 4-CN-Ph                                               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 200 | 4-CN-Ph                                               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 201 | 4-CN-Ph                                               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 202 | 4-CF <sub>3</sub> O-Ph                                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 203 | 4-CF <sub>3</sub> O-Ph                                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 204 | 4-CF <sub>3</sub> O-Ph                                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 205 | 4-CF <sub>3</sub> O-Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 206 | 4-CF <sub>3</sub> O-Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 207 | 4-CF <sub>3</sub> O-Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 208 | 4-CH <sub>3</sub> S-Ph                                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 209 | 4-CH <sub>3</sub> S-Ph                                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 210 | 4-CH <sub>3</sub> S-Ph                                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 211 | 4-CH <sub>3</sub> S-Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |

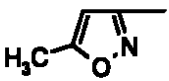
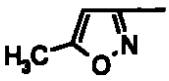
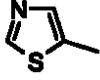
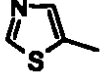
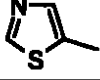
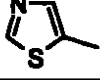
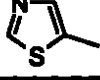
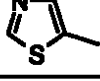
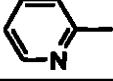
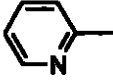
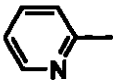
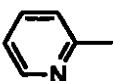
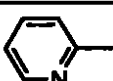
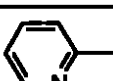
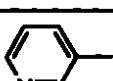
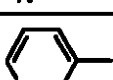
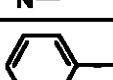
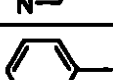
|     |                                                        |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|--------------------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 212 | 4-CH <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 213 | 4-CH <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 214 | 4-CF <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 215 | 4-CF <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 216 | 4-CF <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 217 | 4-CF <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 218 | 4-CF <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 219 | 4-CF <sub>3</sub> S-Ph                                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 220 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph                 | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 221 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph                 | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 222 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 223 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 224 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 225 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph                 | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 226 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 227 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 228 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 229 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 230 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 231 | 4-CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 232 | 3,4-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 233 | 3,4-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 234 | 3,4-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 235 | 3,4-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 236 | 3,4-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 237 | 3,4-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 238 | 3,5-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 239 | 3,5-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 240 | 3,5-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 241 | 3,5-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 242 | 3,5-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 243 | 3,5-Br <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 244 | 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 245 | 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 246 | 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 247 | 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 248 | 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 249 | 2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 250 | 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 251 | 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 252 | 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 253 | 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 254 | 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph                                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |

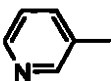
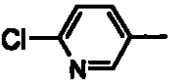
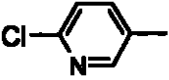
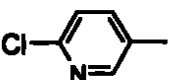
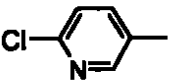
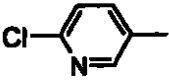
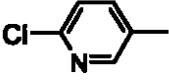
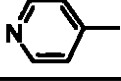
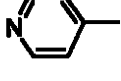
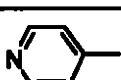
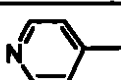
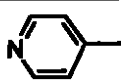
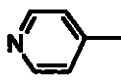
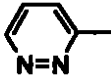
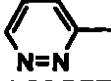
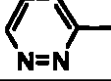
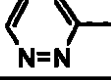
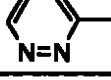
|     |                         |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 255 | 2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 256 | 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 257 | 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 258 | 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 259 | 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 260 | 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 261 | 3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 262 | 2,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 263 | 2,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 264 | 2,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 265 | 2,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 266 | 2,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 267 | 2,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 268 | 3,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 269 | 3,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 270 | 3,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 271 | 3,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 273 | 3,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 274 | 3,4-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 275 | 3,5-F <sub>2</sub> -Ph  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 276 | 3,5-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 277 | 3,5-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 278 | 3,5-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 279 | 3,5-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 280 | 3,5-F <sub>2</sub> -Ph  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 281 | 3-Br-4-F-Ph             | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 282 | 3-Br-4-F-Ph             | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 283 | 3-Br-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 284 | 3-Br-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 285 | 3-Br-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 286 | 3-Br-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 287 | 3-Cl-4-F-Ph             | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 288 | 3-Cl-4-F-Ph             | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 289 | 3-Cl-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 290 | 3-Cl-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 291 | 3-Cl-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 292 | 3-Cl-4-F-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 293 | 3-F-4-Cl-Ph             | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 294 | 3-F-4-Cl-Ph             | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 295 | 3-F-4-Cl-Ph             | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 296 | 3-F-4-Cl-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 297 | 3-F-4-Cl-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 298 | 3-F-4-Cl-Ph             | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |

|     |                                           |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 299 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 300 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 301 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 302 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 303 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 304 | 3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 305 | 3,4-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 306 | 3,4-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 307 | 3,4-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 308 | 3,4-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 309 | 3,4-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 310 | 3,4-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 311 | 3,5-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 312 | 3,5-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 313 | 3,5-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 314 | 3,5-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 315 | 3,5-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 316 | 3,5-CH <sub>3</sub> -Ph                   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 317 | 3,4-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 318 | 3,4-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 319 | 3,4-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 320 | 3,4-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 321 | 3,4-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 322 | 3,4-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 323 | 3,5-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 324 | 3,5-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 325 | 3,5-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 326 | 3,5-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 327 | 3,5-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 328 | 3,5-CH <sub>3</sub> O-Ph                  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 329 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 330 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 331 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 332 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 333 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 334 | 3-CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> O-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 335 | 3-F-4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 336 | 3-F-4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 337 | 3-F-4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 338 | 3-F-4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 339 | 3-F-4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 340 | 3-F-4-CH <sub>3</sub> O-Ph                | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |

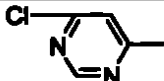
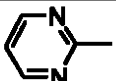
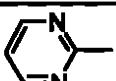
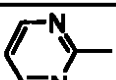
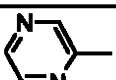
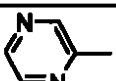
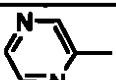
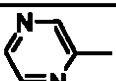
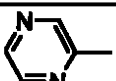
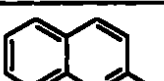
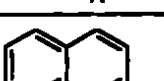
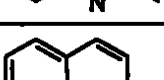
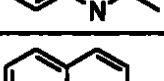
|     |                                                                                     |   |                                      |                                      |                |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------------|--------------------------------------|----------------|---|
| 341 |    | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 342 |    | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 343 |    | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 344 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 345 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 346 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 347 |    | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 348 |   | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 349 |  | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 350 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 351 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 352 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 353 |  | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 354 |  | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 355 |  | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 356 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 357 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 358 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 359 |  | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 360 |  | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |

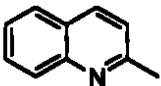
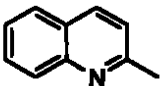
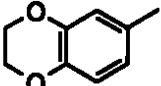
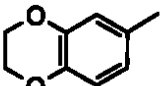
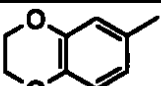
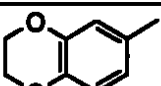
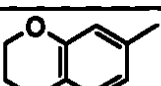
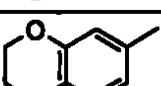
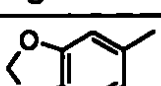
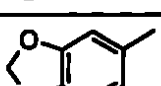
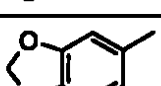
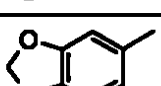
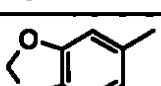
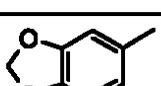
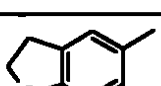
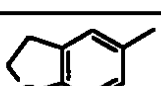
|     |                                                                                     |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 361 |    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 362 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 363 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 364 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 365 |    | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 366 |    | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 367 |    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 368 |   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 369 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 370 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 371 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 372 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 373 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 374 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 375 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 376 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 377 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 378 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 379 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 380 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |

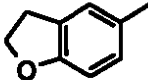
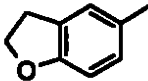
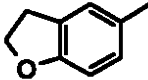
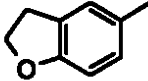
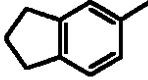
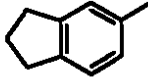
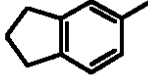
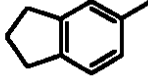
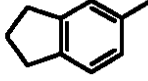
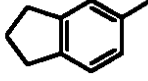
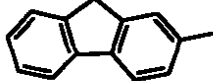
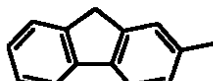
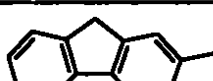
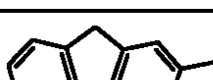
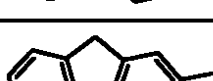
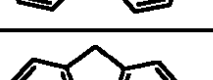
|     |                                                                                     |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 381 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 382 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 383 |    | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 384 |    | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 385 |    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 386 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 387 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 388 |   | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 389 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 390 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 391 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 392 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 393 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 394 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 395 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 396 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 397 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 398 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 399 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |

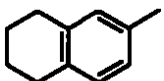
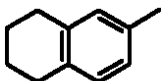
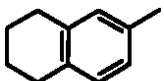
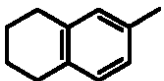
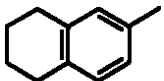
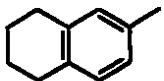
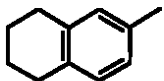
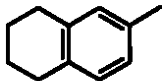
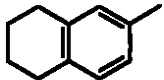
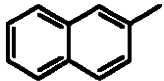
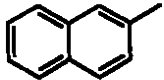
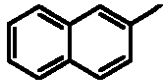
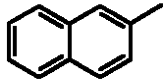
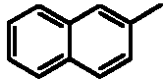
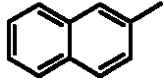
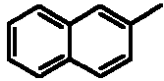
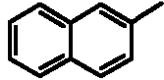
|     |                                                                                     |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 400 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 401 |    | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 402 |    | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 403 |    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 404 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 405 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 406 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 407 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 408 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 409 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 410 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 411 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 412 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 413 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 414 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 415 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 416 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 417 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |

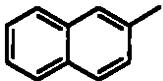
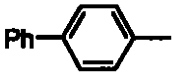
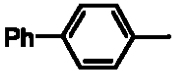
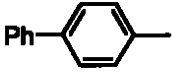
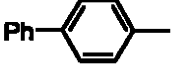
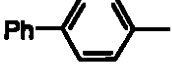
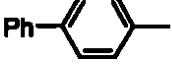
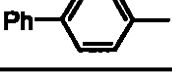
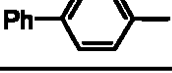


|     |                                                                                     |   |                                      |                                      |                |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------------|--------------------------------------|----------------|---|
| 436 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 437 |    | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 438 |    | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 439 |    | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 440 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 441 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 442 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 443 |   | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 444 |  | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 445 |  | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 446 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 447 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 448 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 449 |  | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 450 |  | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 451 |  | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 452 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |

|     |                                                                                     |   |                                      |                                      |                |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------------------|--------------------------------------|----------------|---|
| 453 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 454 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 455 |    | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 456 |    | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 457 |    | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 458 |    | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 459 |   | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 460 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 461 |  | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 462 |  | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 463 |  | H | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 464 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 465 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 466 |  | H | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 467 |  | H | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 468 |  | H | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |

|     |                                                                                     |   |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 469 |    | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 470 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 471 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 472 |    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 473 |    | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 474 |    | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 475 |   | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 476 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 477 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 478 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 479 |  | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 480 |  | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 481 |  | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 482 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 483 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 484 |  | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |

|     |                                                                                     |               |                                      |                                      |                |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------|--------------------------------------|--------------------------------------|----------------|---|
| 485 |    | H             | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 486 |    | H             | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 487 |    | H             | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 488 |    | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 489 |    | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 490 |    | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 491 |   | $\text{CH}_3$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 492 |  | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$  | O |
| 493 |  | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | S |
| 494 |  | H             | H                                    | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 495 |  | H             | $\text{CH}_3$                        | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 496 |  | H             | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 497 |  | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$                        | $\text{OCH}_3$ | O |
| 498 |  | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{CH}_3$             | $\text{OCH}_3$ | O |
| 499 |  | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 500 |  | $\text{CH}_3$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{OCH}_3$ | O |
| 501 |  | H             | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ | $\text{CH}_3$  | O |

|     |                                                                                     |                 |                                 |                                 |                  |   |
|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------|---------------------------------|---------------------------------|------------------|---|
| 502 |    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 503 |    | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 504 |    | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 505 |    | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 506 |    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | OCH <sub>3</sub> | O |
| 507 |    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 508 |    | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 509 |   | CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | O |
| 510 |  | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>  | O |
| 511 |  | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | OCH <sub>3</sub> | S |
| 512 | Ph                                                                                  | H               | H                               | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 513 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 514 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 515 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 516 | Ph                                                                                  | H               | H                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 517 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 518 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 519 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 520 | Ph                                                                                  | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl               | O |
| 521 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl               | O |
| 522 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl               | O |
| 523 | Ph                                                                                  | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl               | O |
| 524 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | H                               | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 525 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 526 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 527 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | Cl               | O |
| 528 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | H                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 529 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 530 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 531 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Cl               | O |
| 532 | 4-Cl-Ph                                                                             | H               | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl               | O |

|     |         |   |                                 |                                 |    |   |
|-----|---------|---|---------------------------------|---------------------------------|----|---|
| 533 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 534 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 535 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 536 | 4-Cl-Ph | H | H                               | CH <sub>3</sub>                 | Br | O |
| 537 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | Br | O |
| 538 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | Br | O |
| 539 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | Br | O |
| 540 | 4-Cl-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Br | O |
| 541 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Br | O |
| 542 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Br | O |
| 543 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | Br | O |
| 544 | 4-Cl-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 545 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 546 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 547 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 548 | 4-Cl-Ph | H | H                               | CH <sub>3</sub>                 | CN | O |
| 549 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>3</sub>                 | CN | O |
| 550 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>3</sub>                 | CN | O |
| 551 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>3</sub>                 | CN | O |
| 552 | 4-Cl-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CN | O |
| 553 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CN | O |
| 554 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CN | O |
| 555 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CN | O |
| 556 | 4-Cl-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 557 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 558 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 559 | 4-Cl-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 560 | Ph      | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 561 | Ph      | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 562 | Ph      | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 563 | Ph      | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 564 | Ph      | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 565 | Ph      | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 566 | Ph      | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 567 | Ph      | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |
| 568 | 4-Br-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 569 | 4-Br-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 570 | 4-Br-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 571 | 4-Br-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Cl | O |
| 572 | 4-Br-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 573 | 4-Br-Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 574 | 4-Br-Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 575 | 4-Br-Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH            | Br | O |
| 576 | 4-Br-Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CN | O |

|     |                       |   |                                 |                                                       |                  |   |
|-----|-----------------------|---|---------------------------------|-------------------------------------------------------|------------------|---|
| 577 | 4-Br-Ph               | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 578 | 4-Br-Ph               | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 579 | 4-Br-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 580 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Cl               | O |
| 581 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Cl               | O |
| 582 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Cl               | O |
| 583 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Cl               | O |
| 584 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Br               | O |
| 585 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Br               | O |
| 586 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Br               | O |
| 587 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | Br               | O |
| 588 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | H                               | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 589 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>3</sub>                 | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 590 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 591 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CH                                  | CN               | O |
| 592 | Ph                    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                    | OCH <sub>3</sub> | O |
| 593 | 4-Cl-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                    | OCH <sub>3</sub> | O |
| 594 | 4-Br-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                    | OCH <sub>3</sub> | O |
| 595 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>                    | OCH <sub>3</sub> | O |
| 596 | Ph                    | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡C-<br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 597 | 4-Cl-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡C-<br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 598 | 4-Br-Ph               | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡C-<br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |
| 599 | 4-CH <sub>3</sub> -Ph | H | CH <sub>2</sub> C≡CH            | CH <sub>2</sub> C≡C-<br>C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> | OCH <sub>3</sub> | O |

Las formulaciones pueden ser preparadas análogamente a las descritas en, por ejemplo, WO 95/30651.

Ejemplos Biológicos

D-1: Acción contra Plasmopara viticola sobre vides

a) Acción protectora residual

Plantones de vides son pulverizados en la etapa de 4 a 5 hojas con una mezcla de pulverización (0,02% ingrediente activo) preparada a partir de una formulación en polvo humectable del compuesto de ensayo. Después de 24 horas, las plantas tratadas son infectadas con una suspensión esporica del

hongo. La infestación de hongo es evaluada después de la incubación durante 6 días a 95-100% de humedad relativa y +20°C.

**b) Acción curativa residual**

Los plantones de vides son infectados en la etapa de 4 a 5 hojas con una suspensión esporica del hongo. Después de incubación durante 24 horas en una cámara de humedad a 95-100% de humedad relativa y +20°C, las plantas infectadas son secadas y pulverizadas con una mezcla para pulverizar (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de una formulación en polvo humectable del compuesto de ensayo. Después de haberse secado el recubrimiento para pulverizar, las plantas tratadas son colocadas en la cámara de humedad nuevamente. La infestación por hongos se evalúa 6 días después de la infección.

Los compuestos de las Tablas 1 a 64 exhiben una buena acción fungicida contra *Plasmopara viticola* en vides. Los compuestos E1.03, E1.06, E1.14, E1.17, E1.24, E1.25, E1.26, E1.29, E1.32, E1.35, E1.38, E1.43, E1.46, E1.49, E1.50, E1.51 y E1.53 a 200 ppm inhiben las infestaciones fungales en ambos ensayos D-1a) y D-1b) en 80-100%. Al mismo tiempo, las plantas no tratadas mostraron un ataque del patógeno de 80 – 100%.

**D-2: Acción contra *Phytophthora* en plantas de tomate**

**a) Acción protectora residual**

Después de un período de cultivación de 3 semanas, se pulverizan plantas de tomate con una mezcla para pulverizar (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de una formulación en polvo humectable del compuesto de ensayo. Después de 48 horas, las plantas tratadas son infectadas con una suspensión esporica del hongo. La infestación del hongo se evalúa después de incubación de las plantas infectadas durante 5 días a 90-100% de humedad relativa y +20°C.

**b) Acción sistémica**

Después de un período de cultivación de 3 semanas, las plantas de tomate se riegan con una mezcla para pulverizar (0,02% de ingrediente activo en base al volumen de la tierra) preparada a partir de una formulación en polvo humectable del compuesto de ensayo. Se tiene cuidado de que la mezcla para pulverizar no entre en contacto con las partes de las plantas que están sobre la tierra. Después de 96 horas, las plantas tratadas son infectadas con una suspensión esporica del hongo. La infestación del hongo se evalúa después de incubación de las plantas infectadas durante 4 días a 90-100% de humedad relativa y +20°C.

Los compuestos de las Tablas 1 a 64 exhiben una buena acción fungicida contra *Plasmopara viticola* en vides. Los compuestos E1.03, E1.06, E1.14, E1.17, E1.24, E1.25, E1.26, E1.28, E1.29, E1.32, E1.35, E1.41, E1.43, E1.46, E1.49, E1.50, E1.51, E1.53, E1.57 y E1.60 a 200 ppm inhiben las infestaciones fungales en ambos ensayos D-2a) y D-2b) en 80-100%. Al mismo tiempo, las plantas no tratadas mostraron un ataque del patógeno de 80 – 100%.

#### D-3: Acción contra *Phytophthora* en plantas de papa

##### a) Acción protectora residual

Plantas de papa de 2-3 semanas de edad (variedad Bintje) se pulverizan con una mezcla para pulverizar (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de una formulación en polvo humectable del compuesto de ensayo. Después de 48 horas, las plantas tratadas son infectadas con una suspensión esporica del hongo. La infestación del hongo se evalúa después de incubación de las plantas infectadas durante 4 días a 90-100% de humedad relativa y +20°C.

##### b) Acción sistémica

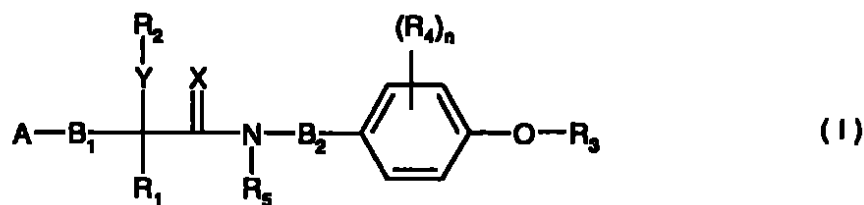
Las plantas de papa de 2-3 semanas de edad (variedad Bintje) se riegan con una mezcla para pulverizar (0,02% de ingrediente activo en base al volumen de la tierra) preparada a partir de una formulación en polvo humectable del compuesto de ensayo. Se tiene cuidado de que la mezcla para pulverizar no entre

en contacto con las partes de las plantas que están sobre la tierra. Después de 48 horas, las plantas tratadas son infectadas con una suspensión esporica del hongo. La infestación del hongo se evalúa después de incubación de las plantas infectadas durante 4 días a 90-100% de humedad relativa y +20°C. La infestación fungal es controlada efectivamente con los compuestos de las Tablas 1 a 64.

Los compuestos E1.03, E1.14, E1.25, E1.26, E1.32, E1.35, E1.43, E1.46, E1.49, E1.51 y E1.53 a 200 ppm inhiben las infestaciones fungales en ambos ensayos D-3a) y D-3b) en 80-100%. Al mismo tiempo, las plantas no tratadas mostraron un ataque del patógeno de 80 – 100%.

**REIVINDICACIONES**

1. Un compuesto de la fórmula general



que incluye sus isómeros ópticos y mezclas de tales isómeros, en donde

A representa arilo optativamente sustituido o heteroarilo optativamente sustituido;

X es oxígeno o azufre;

Y es oxígeno o azufre;

R<sub>1</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo o halocicloalquilo;

R<sub>2</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-alquenilo, alcoxi-alquinilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o aril-alquilo optativamente sustituido, aril-alquenilo optativamente sustituido, aril-alquinilo optativamente sustituido o ariloxi-alquilo optativamente sustituido;

R<sub>3</sub> es hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquil-alquilo, alcoxi-alquilo, alcoxi-alquenilo, alcoxi-alquinilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo, alquinilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es aril-alquilo optativamente sustituido, aril-alquenilo optativamente sustituido, aril-alquinilo optativamente sustituido, ariloxi-alquilo optativamente sustituido, heteroaril-alquilo optativamente sustituido, heteroaril-alquenilo optativamente sustituido o heteroaril-alquinilo optativamente sustituido,

$R_4$  es alquilo, alquenilo, alquinilo, alcoxi-alquilo, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, alquiltio, alcanollo, alquilamino, dialquilamino, alcoxicarbonilo, en donde todos los grupos alquilo, alquenilo o alquinilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o es halógeno, ciano, nitro, amino, formilo o carboxilo;

$R_5$  es hidrógeno, alquilo, alquenilo o alquinilo;

$n$  es un número entero 0, 1, 2, 3 o 4;

$B_1$  representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde

$q$  es un número entero 2, 3 o 4;

$r$  es un número entero 0, 1, 2, 3;  $s$  es un número entero 1, 2 o 3, siempre que  $(r + s)$  sea 1, 2 o 3;

$Z$  es  $-O-$ ,  $-S-$ ,  $-SO-$ ,  $-SO_2-$ ,  $-NR_6-$ ,  $-CO-$ ,  $-OOC-$ ,  $-COO-$ ,  $-NR_6CO-$  o  $-CO-NR_6-$ ;

$R_6$  es hidrógeno o alquilo;

$R_{10}$ ,  $R_{11}$ ,  $R_{12}$  y  $R_{13}$  independientemente entre sí son hidrógeno o alquilo; y

$B_2$  es un puente alquileno.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en donde

$A$  es fenilo, naftilo, 1,3-bifenilo, 1,4-bifenilo, fluorenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxfenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, indazolilo, benzofuranilo, benzotienilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolinilo o isoquinolinilo, cada uno optativamente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende los radicales alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_2-C_{10}$ , alquinilo- $C_2-C_{10}$ , cicloalquilo- $C_1-C_8$ , cicloalquil- $C_1-C_8$ -alquilo- $C_1-C_{10}$ , fenilo, fenil-alquilo- $C_1-C_{10}$ , alcoxi- $C_1-C_{10}$ , alqueniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , alquilsulfonilo- $C_1-C_{10}$ , alcoxi- $C_1-C_{10}$ -alquilo- $C_1-C_{10}$ , alcanollo-

$C_1-C_{10}$ , alcóxicarbonilo- $C_1-C_{10}$ , alquéniloxicarbonilo- $C_3-C_{10}$ , alquíniloxicarbonilo- $C_3-C_{10}$ , alquilamino- $C_1-C_{10}$ , di-alquilamino- $C_1-C_{10}$ , hidróxi, halógeno, ciano, nitro, amino y formilo, en donde, a su vez, los grupos alquilo, alquénilo, alquínilo y cicloalquilo pueden estar sustituidos optativamente con uno o más átomos de halógeno; y X es oxígeno o azufre; e Y es oxígeno o azufre; y  $R_1$  representa hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquénilo- $C_3-C_{10}$ , alquínilo- $C_3-C_{10}$  o cicloalquilo- $C_3-C_8$ , en donde todos los grupos alquilo, alquénilo, alquínilo y cicloalquilo pueden estar sustituidos optativamente con halógeno; y  $R_2$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquénilo- $C_3-C_{10}$ , alquínilo- $C_3-C_{10}$ , cicloalquilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcóxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcóxi- $C_1-C_6$ -alquénilo- $C_3-C_{10}$  o alcóxi- $C_1-C_6$ -alquínilo- $C_3-C_{10}$ , en donde todos los grupos alquilo, alquénilo, alquínilo o cicloalquilo pueden estar sustituidos optativamente con halógeno; o representa aril-alquilo- $C_1-C_6$  optativamente sustituido, aril-alquénilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido, aril-alquínilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido o ariloxi-alquilo- $C_1-C_6$  optativamente sustituido; y  $R_3$  representa hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquénilo- $C_3-C_{10}$ , alquínilo- $C_3-C_{10}$ , cicloalquilo- $C_3-C_8$ , cicloalquil- $C_3-C_8$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcóxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcóxi- $C_1-C_6$ -alquénilo- $C_3-C_{10}$  o alcóxi- $C_1-C_6$ -alquínilo- $C_3-C_{10}$ , en donde todos los grupos alquilo, alquénilo, alquínilo o cicloalquilo pueden estar optativamente sustituidos con halógeno; o representa aril-alquilo- $C_1-C_6$  optativamente sustituido, aril-alquénilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido, aril-alquínilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido, ariloxi-alquilo- $C_1-C_6$  optativamente sustituido, heteroaril-alquilo- $C_1-C_6$  optativamente sustituido, heteroaril-alquénilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido o heteroaril-alquínilo- $C_3-C_{10}$  optativamente sustituido; y  $R_4$  es alquilo- $C_1-C_6$ , alquénilo- $C_3-C_6$ , alquínilo- $C_3-C_6$ , alcóxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcóxi- $C_1-C_6$ , alquéniloxi- $C_3-C_6$ , alquíniloxi- $C_3-C_6$ , alquiltio- $C_1-C_6$ , alcanollo- $C_1-C_6$ , alquilamino- $C_1-C_6$ , dialquilamino- $C_1-C_6$  o alcóxicarbonilo- $C_1-C_6$ , en donde todos los grupos alquilo, alquénilo o alquínilo pueden estar

optativamente sustituidos con halógeno; o es halógeno, ciano, nitro, amino, formilo o carboxilo; y  $R_5$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_6$ , alquenilo- $C_3-C_6$  o alquinilo- $C_3-C_6$ ; y  $B_2$  es un puente alquilenilo- $C_1-C_6$ ; y  $n$  es un número entero de 0 a 2.

3. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 en donde

A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxifenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_2-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_2-C_{10}$ , alquinilo- $C_2-C_{10}$ , bencilo, alcoxi- $C_1-C_{10}$ , haloalcoxi- $C_1-C_{10}$ , alqueniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , haloalquiltio- $C_1-C_{10}$ , alquilsulfonilo- $C_1-C_{10}$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcanóilo- $C_1-C_{10}$ , alcóxicarbonilo- $C_1-C_{10}$ , hidroxilo, halógeno, ciano, nitro y formilo.

4. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en donde

A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxifenilo, (1,2-etilen)dioxifenilo, furanilo, tienilo o piridilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_2-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_2-C_{10}$ , alquinilo- $C_2-C_{10}$ , bencilo, alcoxi- $C_1-C_{10}$ , haloalcoxi- $C_1-C_{10}$ , alqueniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiniloxi- $C_3-C_{10}$ , alquiltio- $C_1-C_{10}$ , haloalquiltio- $C_1-C_{10}$ , alquilsulfonilo- $C_1-C_{10}$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcanóilo- $C_1-C_{10}$ , alcóxicarbonilo- $C_1-C_{10}$ , hidroxilo, halógeno, ciano, nitro y formilo; y X es oxígeno o azufre; e Y es oxígeno o azufre; y  $R_1$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_3-C_{10}$  o haloalquinilo- $C_3-C_{10}$ ; y  $R_2$  es hidrógeno, alquilo- $C_1-C_{10}$ , alquenilo- $C_3-C_{10}$ , alquinilo- $C_3-C_{10}$ , cicloalquilo- $C_3-C_6$ , cicloalquil- $C_3-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , cicloalquil- $C_3-C_6$ -alquenilo- $C_3-C_6$ , cicloalquil- $C_3-C_6$ -alquinilo- $C_3-C_6$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquilo- $C_1-C_6$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquenilo- $C_3-C_6$ , alcoxi- $C_1-C_6$ -alquinilo- $C_3-C_6$ , haloalquilo- $C_1-C_{10}$ , haloalquenilo- $C_3-C_{10}$ , haloalquinilo- $C_3-C_{10}$ , fenil-alquilo- $C_1-C_6$ ,

fenil-alquenilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o fenil-alquinilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, en donde fenilo puede estar optativamente mono o disustituido con sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcanollo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halógeno, ciano, nitro y formilo; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, cicloalquilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, fenil-alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, fenil-alquenilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o fenil-alquinilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, en donde los grupos fenilo están optativamente mono- o disustituidos con radicales seleccionados del grupo que comprende alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcanollo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halógeno, ciano, nitro y formilo; y R<sub>4</sub> es alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alqueniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquiniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halógeno, ciano o nitro; y R<sub>5</sub> es hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y n es un número entero de 0 a 2; y B<sub>2</sub> es un puente alquileno de la fórmula -CH(R<sub>20</sub>)-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-, en donde R<sub>20</sub> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y p es un número entero 0, 1 o 2.

5. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en donde

A es fenilo, naftilo, 1,4-bifenilo, tetralinilo, indanilo, metilendioxfenilo, tienilo, cada uno optativamente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, alquinilo-C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>, bencilo, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcanóilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcoxicarbonilo-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, halógeno, ciano, nitro y formilo; y X es oxígeno o azufre; e Y es oxígeno o azufre; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>2</sub>

representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> o haloalquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>4</sub> es alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alqueniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquiniloxi-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o halógeno; y R<sub>5</sub> es hidrógeno o alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y B<sub>1</sub> representa un miembro puente  $-(CR_{10}R_{11})_q-$  o  $-(CHR_{10}R_{11})_r-Z-(CR_{12}R_{13})_s$ , en donde R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>12</sub> y R<sub>13</sub>, independientemente entre sí, son hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, q es un número entero 2, r es el número entero 0; s es el número entero 1, y Z es -O-, -S- o -CO-; y n es el número entero 0 o 1; y B<sub>2</sub> es un puente alquileo de la fórmula  $-CH(R_{20})-(CH_2)_p-$ , en donde R<sub>20</sub> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y p es un número entero 0, 1 o 2.

6. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en donde

A es fenilo o tienilo, optativamente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, alcanolfo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno y ciano; y X es oxígeno; e Y es oxígeno; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>3</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquil-C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>4</sub> es 3-alcoxi-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>; y R<sub>5</sub> es hidrógeno o metilo; y B<sub>1</sub> se selecciona entre -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -O-CH<sub>2</sub>- y -S-CH<sub>2</sub>-; y n es el número entero 0 o 1; y B<sub>2</sub> es -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>2</sub>- o -CH(CH<sub>3</sub>)-

7. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde

A es fenilo optativamente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

halógeno y ciano; y X e Y son ambos oxígeno; y R<sub>1</sub> representa hidrógeno; y R<sub>2</sub> representa hidrógeno, alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>3</sub> representa alquilo-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> o alquinilo-C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>; y R<sub>4</sub> es 3-metoxi o 3-etoxi; y R<sub>5</sub> es hidrógeno; y B<sub>1</sub> se selecciona entre -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -O-CH<sub>2</sub>- y -S-CH<sub>2</sub>-; y n es el número entero 1; y B<sub>2</sub> es -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-.

8. Un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 seleccionado del grupo que comprende

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-butiramida,

4-(4-fluor-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

4-(4-fluor-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

2-etoxi-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-

butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-

butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

4-(4-cloro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,

3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-etil-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

2-etoxi-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(4-fluor-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-fluor-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

2-etoxi-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(3,4-dicloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-feniltio)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-  
propionamida,

3-benciloxi-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-benciloxi-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-benciloxi-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]- propionamida,

3-benciloxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

3-(4-cloro-benciloxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-  
iniloxi-propionamida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-  
butiramida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-butiramida,

(R)-4-(4-fluor-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(R)-4-(4-fluor-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(R)-2-etoxi-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(R)-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

(R)-4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(R)-4-(4-cloro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(R)-4-(4-cloro-fenil)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(R)-4-(4-cloro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-2-prop-iniloxi-propionamida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,

(R)-3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-etil-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-2-etoxi-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-2-etoxi-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,

(R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(R)-3-(4-cloro-feniltio)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(R)-3-benciloxi-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

(R)-3-benciloxi-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

(R)-3-benciloxi-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

(R)-3-benciloxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-  
propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-  
propionamida,

(R)-3-(4-cloro-benciloxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-  
iniloxi-propionamida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-  
butiramida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-  
butiramida,

(S)-4-(4-fluor-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(S)-4-(4-fluor-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(S)-2-etoxi-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(S)-4-(4-fluor-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

(S)-4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(S)-4-(4-cloro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(S)-4-(4-cloro-fenil)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,

(S)-4-(4-cloro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-propionamida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-fenoxi-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,

(S)-3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-etil-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-2-etoxi-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-etil-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-fluor-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-2-etoxi-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-fluor-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

- (S)-3-(4-cloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,
- (S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
- (S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
- (S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
- (S)-3-(3,4-dicloro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,
- (S)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,
- (S)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,
- (S)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-propionamida,
- (S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida,
- (S)-3-(4-cloro-feniltio)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
- (S)-3-(4-cloro-feniltio)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
- (S)-3-(4-cloro-feniltio)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
- (S)-3-(4-cloro-feniltio)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,
- (S)-3-benciloxi-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-benciloxi-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-benciloxi-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-benciloxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

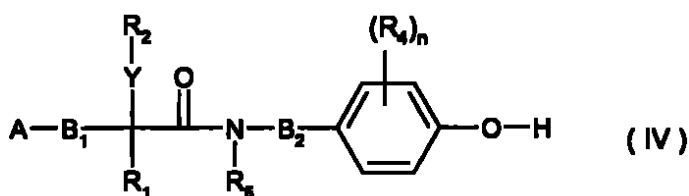
(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,

(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida, y

(S)-3-(4-cloro-benciloxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-propionamida.

9. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, el cual comprende

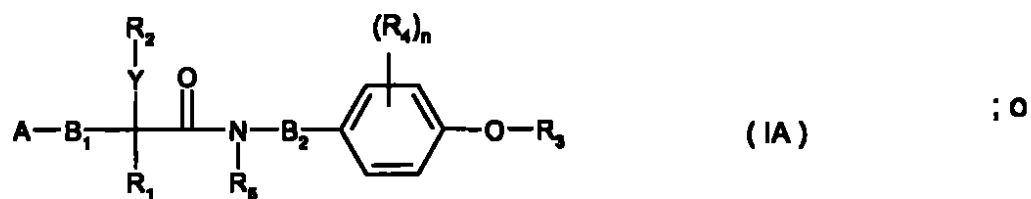
a) hacer reaccionar el fenol de fórmula VI



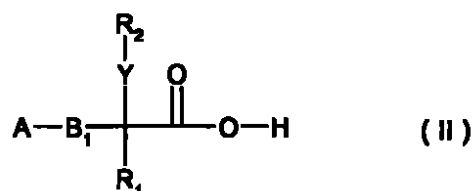
en donde A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub> y n son como se definieron para la fórmula I con un compuesto de fórmula V



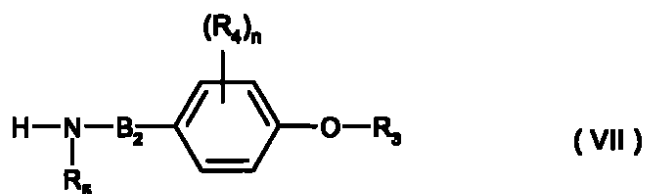
en donde R<sub>3</sub> es como se definió para la fórmula I y en donde Z es un grupo saliente proporcionando el subgrupo IA



b) hacer reaccionar el ácido de fórmula II

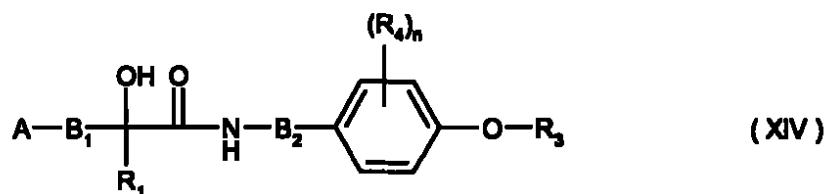


con una amina de fórmula VII

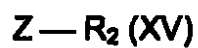


en donde A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub> y n son como se definieron para la fórmula I, o

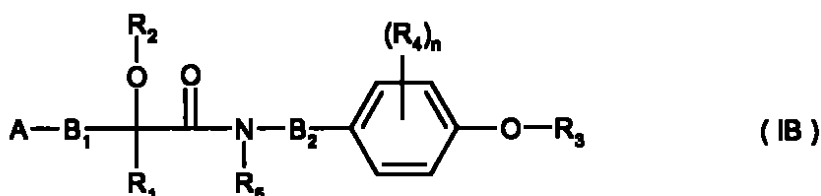
c) hacer reaccionar el α-hidroxi-car de fórmula XIV



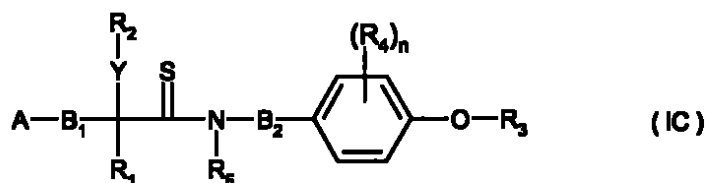
con un agente eterificante de fórmula XV



en donde A, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub>, R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub> y n son como se definieron para la fórmula I y en donde Z es un grupo saliente; proporcionando el subgrupo IB



y optativamente convertir la función amida del compuesto del subgrupo IA en una función tioamida como en el subgrupo IC



mediante tratamiento con un agente sulfurante.

10. Una composición para controlar y proteger contra microorganismos fitopatógenos, que comprende un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 como ingrediente activo junto con un portador adecuado.

11. El uso de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 en la protección de plantas contra la infestación por microorganismos fitopatógenos.

12. Un método para el control y prevención de una infestación de plantas de cultivo por microorganismos fitopatógenos, el cual comprende la aplicación de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 como ingrediente activo a la planta, a partes de plantas o al lugar de la misma.

13. Un método de acuerdo con la reivindicación 12, en donde los microorganismos fitopatógenos son organismos fungales.

PCT

## REQUEST

The undersigned requests that the present international application be processed according to the Patent Cooperation Treaty.

For receiving Office use only

PCT/EP 02 / 12845

International Application No.

15 NOV 2002

International Filing Date

(15.11.02)

EUROPEAN PATENT OFFICE

PCT INTERNATIONAL APPLICATION

Name of receiving Office and "PCT International Application"

Applicant's or agent's file reference

PF/5-60119A

(if desired) (12 characters maximum)

## Box No. I TITLE OF INVENTION

NOVEL  $\alpha$ -OXYGENATED OR  $\alpha$ -THIOLATED CARBOXYLIC ACID PHENETHYLAMIDE DERIVATIVES

## Box No. II APPLICANT

☐

This person is also inventor

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)

Syngenta Participations AG  
Schwarzwaldallee 215  
4058 Basel  
CH

Telephone No. +41 61 323 11 11

Facsimile No. +41 61 323 50 44

Teleprinter No.

Applicant's registration No. with the Office

State (that is, country) of nationality: CH

State (that is, country) of residence: CH

This person is applicant for the purposes of:

☐

all designated States

☒

all designated States except the United States of America

☐

the United States of America only

☐

the States indicated in the Supplemental Box

## Box No. III FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)

ZELLER, Martin  
Syngenta Crop Protection Muenchwillen AG  
Breitenloh 5  
4333 Muenchwillen  
CH

This person is:

☐

applicant only

☒

applicant and inventor

☐

inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)

Applicant's registration No. with the Office

State (that is, country) of nationality: CH

State (that is, country) of residence: CH

This person is applicant for the purposes of:

☐

all designated States

☐

all designated States except the United States of America

☒

the United States of America only

☐

the States indicated in the Supplemental Box

☒ Further applicants and/or (further) inventors are indicated on a continuation sheet.

## Box No. IV AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE; OR ADDRESS FOR CORRESPONDENCE

The person identified below is hereby/has been appointed to act on behalf of the applicant(s) before the competent International Authorities as:

☒

agent

☐

common representative

Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)

BASTIAN, Werner  
c/o Syngenta Participations AG  
Intellectual Property  
P.O. Box  
CH-4002 Basel  
Switzerland

Telephone No. +41 61 323 11 11

Facsimile No. +41 61 323 50 44

Teleprinter No.

Agent's registration No. with the Office

☐

Address for correspondence: Mark this check-box where no agent or common representative is/has been appointed and the space above is used instead to indicate a special address to which correspondence should be sent.

| Continuation of Box No. III                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |  | <b>FURTHER APPLICANT(S) AND/OR (FURTHER) INVENTOR(S)</b>                                                                                                                                                                                                                    |  |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|
| <i>If none of the following sub-boxes is used, this sheet should not be included in the request.</i>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |  |                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |
| <small>Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</small><br><b>LAMBERTH, Clemens</b><br><b>Syngenta Crop Protection AG</b><br><b>Schwarzwaldallee 215</b><br><b>4058 Basel</b><br><b>CH</b>    |  | This person is:<br><input type="checkbox"/> applicant only<br><input checked="" type="checkbox"/> applicant and inventor<br><input type="checkbox"/> inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)<br><br>Applicant's registration No. with the Office |  |
| State (that is, country) of nationality: <b>DE</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |  | State (that is, country) of residence: <b>CH</b>                                                                                                                                                                                                                            |  |
| This person is applicant for the purposes of: <input type="checkbox"/> all designated States <input type="checkbox"/> all designated States except the United States of America <input checked="" type="checkbox"/> the United States of America only <input type="checkbox"/> the States indicated in the Supplemental Box                                                                                                                                                  |  |                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |
| <small>Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</small><br><b>KRIZ, Miroslav</b><br><b>Synkola Consortium</b><br><b>Mlynska dolina - areal PvF UK</b><br><b>84215 Bratislava</b><br><b>SK</b> |  | This person is:<br><input type="checkbox"/> applicant only<br><input checked="" type="checkbox"/> applicant and inventor<br><input type="checkbox"/> inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)<br><br>Applicant's registration No. with the Office |  |
| State (that is, country) of nationality: <b>SK</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |  | State (that is, country) of residence: <b>SK</b>                                                                                                                                                                                                                            |  |
| This person is applicant for the purposes of: <input type="checkbox"/> all designated States <input type="checkbox"/> all designated States except the United States of America <input checked="" type="checkbox"/> the United States of America only <input type="checkbox"/> the States indicated in the Supplemental Box                                                                                                                                                  |  |                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |
| <small>Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</small>                                                                                                                                       |  | This person is:<br><input type="checkbox"/> applicant only<br><input type="checkbox"/> applicant and inventor<br><input type="checkbox"/> inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)<br><br>Applicant's registration No. with the Office            |  |
| State (that is, country) of nationality:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |  | State (that is, country) of residence:                                                                                                                                                                                                                                      |  |
| This person is applicant for the purposes of: <input type="checkbox"/> all designated States <input type="checkbox"/> all designated States except the United States of America <input type="checkbox"/> the United States of America only <input type="checkbox"/> the States indicated in the Supplemental Box                                                                                                                                                             |  |                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |
| <small>Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country. The country of the address indicated in this Box is the applicant's State (that is, country) of residence if no State of residence is indicated below.)</small>                                                                                                                                       |  | This person is:<br><input type="checkbox"/> applicant only<br><input type="checkbox"/> applicant and inventor<br><input type="checkbox"/> inventor only (If this check-box is marked, do not fill in below.)<br><br>Applicant's registration No. with the Office            |  |
| State (that is, country) of nationality:                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |  | State (that is, country) of residence:                                                                                                                                                                                                                                      |  |
| This person is applicant for the purposes of: <input type="checkbox"/> all designated States <input type="checkbox"/> all designated States except the United States of America <input type="checkbox"/> the United States of America only <input type="checkbox"/> the States indicated in the Supplemental Box                                                                                                                                                             |  |                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |
| <input type="checkbox"/> Further applicants and/or (further) inventors are indicated on another continuation sheet.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |  |                                                                                                                                                                                                                                                                             |  |

## Box No.V DESIGNATION OF STATES

Mark the applicable check-boxes below; at least one must be marked.

The following designations are hereby made under Rule 4.9(a)

## Regional Patent

- ☒ AP ARIPO Patent: GH Ghana, GM Gambia, KE Kenya, LS Lesotho, MW Malawi, MZ Mozambique, SD Sudan, SL Sierra Leone, SZ Swaziland, TZ United Republic of Tanzania, UG Uganda, ZM Zambia, ZW Zimbabwe, and any other State which is a Contracting State of the Harare Protocol and of the PCT (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line).....
- ☒ EA Eurasian Patent: AM Armenia, AZ Azerbaijan, BY Belarus, KG Kyrgyzstan, KZ Kazakhstan, MD Republic of Moldova, RU Russian Federation, TJ Tajikistan, TM Turkmenistan, and any other State which is a Contracting State of the Eurasian Patent Convention and of the PCT
- ☒ EP European Patent: AT Austria, BE Belgium, BG Bulgaria, CH and LI Switzerland and Liechtenstein, CY Cyprus, CZ Czech Republic, DE Germany, DK Denmark, EE Estonia, ES Spain, FI Finland, FR France, GB United Kingdom, GR Greece, IE Ireland, IT Italy, LU Luxembourg, MC Monaco, NL Netherlands, PT Portugal, SE Sweden, SK Slovakia, TR Turkey, and any other State which is a Contracting State of the European Patent Convention and of the PCT
- ☒ OA OAPI Patent: BF Burkina Faso, BJ Benin, CF Central African Republic, CG Congo, CI Côte d'Ivoire, CM Cameroon, GA Gabon, GN Guinea, GQ Equatorial Guinea, GW Guinea-Bissau, ML Mali, MR Mauritania, NE Niger, SN Senegal, TD Chad, TG Togo, and any other State which is a member State of OAPI and a Contracting State of the PCT (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line).....

## National Patent (if other kind of protection or treatment desired, specify on dotted line):

- |                                                                           |                                                                                       |                                                                         |
|---------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------|
| <input checked="" type="checkbox"/> AE United Arab Emirates .....         | <input checked="" type="checkbox"/> GM Gambia.....                                    | <input checked="" type="checkbox"/> NZ New Zealand.....                 |
| <input checked="" type="checkbox"/> AG Antigua and Barbuda.....           | <input checked="" type="checkbox"/> HR Croatia.....                                   | <input checked="" type="checkbox"/> OM Oman.....                        |
| <input checked="" type="checkbox"/> AL Albania.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> HU Hungary.....                                   | <input checked="" type="checkbox"/> PH Philippines.....                 |
| <input checked="" type="checkbox"/> AM Armenia.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> ID Indonesia.....                                 | <input checked="" type="checkbox"/> PL Poland.....                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> AT Austria.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> IL Israel.....                                    | <input checked="" type="checkbox"/> PT Portugal.....                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> AU Australia.....                     | <input checked="" type="checkbox"/> IN India.....                                     | <input checked="" type="checkbox"/> RO Romania.....                     |
| <input checked="" type="checkbox"/> AZ Azerbaijan.....                    | <input checked="" type="checkbox"/> IS Iceland.....                                   | <input checked="" type="checkbox"/> RU Russian Federation.....          |
| <input checked="" type="checkbox"/> BA Bosnia and Herzegovina.....        | <input checked="" type="checkbox"/> JP Japan.....                                     |                                                                         |
| <input checked="" type="checkbox"/> BB Barbados.....                      | <input checked="" type="checkbox"/> KE Kenya.....                                     | <input checked="" type="checkbox"/> SD Sudan.....                       |
| <input checked="" type="checkbox"/> BG Bulgaria.....                      | <input checked="" type="checkbox"/> KG Kyrgyzstan.....                                | <input checked="" type="checkbox"/> SE Sweden.....                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> BR Brazil.....                        | <input checked="" type="checkbox"/> KP Democratic People's Republic of Korea.....     | <input checked="" type="checkbox"/> SG Singapore.....                   |
| <input checked="" type="checkbox"/> BY Belarus.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> KR Republic of Korea.....                         | <input checked="" type="checkbox"/> SI Slovenia.....                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> BZ Belize.....                        | <input checked="" type="checkbox"/> KZ Kazakhstan.....                                | <input checked="" type="checkbox"/> SK Slovakia.....                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> CA Canada.....                        | <input checked="" type="checkbox"/> LC Saint Lucia.....                               | <input checked="" type="checkbox"/> SL Sierra Leone.....                |
| <input checked="" type="checkbox"/> CH & LI Switzerland and Liechtenstein | <input checked="" type="checkbox"/> LK Sri Lanka.....                                 | <input checked="" type="checkbox"/> TJ Tajikistan.....                  |
| <input checked="" type="checkbox"/> CN China.....                         | <input checked="" type="checkbox"/> LR Liberia.....                                   | <input checked="" type="checkbox"/> TM Turkmenistan.....                |
| <input checked="" type="checkbox"/> CO Colombia.....                      | <input checked="" type="checkbox"/> LS Lesotho.....                                   | <input checked="" type="checkbox"/> TN Tunisia.....                     |
| <input checked="" type="checkbox"/> CR Costa Rica.....                    | <input checked="" type="checkbox"/> LT Lithuania.....                                 | <input checked="" type="checkbox"/> TR Turkey.....                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> CU Cuba.....                          | <input checked="" type="checkbox"/> LU Luxembourg.....                                | <input checked="" type="checkbox"/> TT Trinidad and Tobago.....         |
| <input checked="" type="checkbox"/> CZ Czech Republic.....                | <input checked="" type="checkbox"/> LV Latvia.....                                    |                                                                         |
| <input checked="" type="checkbox"/> DE Germany.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> MA Morocco.....                                   | <input checked="" type="checkbox"/> TZ United Republic of Tanzania..... |
| <input checked="" type="checkbox"/> DK Denmark.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> MD Republic of Moldova.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> UA Ukraine.....                     |
| <input checked="" type="checkbox"/> DM Dominica.....                      | <input checked="" type="checkbox"/> MG Madagascar.....                                | <input checked="" type="checkbox"/> UG Uganda.....                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> DZ Algeria.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> MK The former Yugoslav Republic of Macedonia..... | <input checked="" type="checkbox"/> US United States of America.....    |
| <input checked="" type="checkbox"/> EC Ecuador.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> MN Mongolia.....                                  | <input checked="" type="checkbox"/> UZ Uzbekistan.....                  |
| <input checked="" type="checkbox"/> EE Estonia.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> MW Malawi.....                                    | <input checked="" type="checkbox"/> VN Viet Nam.....                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> ES Spain.....                         | <input checked="" type="checkbox"/> MX Mexico.....                                    | <input checked="" type="checkbox"/> YU Yugoslavia.....                  |
| <input checked="" type="checkbox"/> FI Finland.....                       | <input checked="" type="checkbox"/> MZ Mozambique.....                                | <input checked="" type="checkbox"/> ZA South Africa.....                |
| <input checked="" type="checkbox"/> GB United Kingdom.....                | <input checked="" type="checkbox"/> NO Norway.....                                    | <input checked="" type="checkbox"/> ZM Zambia.....                      |
| <input checked="" type="checkbox"/> GD Grenada.....                       |                                                                                       | <input checked="" type="checkbox"/> ZW Zimbabwe.....                    |
| <input checked="" type="checkbox"/> GE Georgia.....                       |                                                                                       |                                                                         |
| <input checked="" type="checkbox"/> GH Ghana.....                         |                                                                                       |                                                                         |

Check-box reserved for designating States which have become party to the PCT after issuance of this sheet:

- |                                                              |                          |                          |
|--------------------------------------------------------------|--------------------------|--------------------------|
| <input type="checkbox"/> SC Seychelles (from 7.11.2002)..... | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |
| <input type="checkbox"/>                                     | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |

**Precautionary Designation Statement:** In addition to the designations made above, the applicant also makes under Rule 4.9(b) all other designations which would be permitted under the PCT except any designation(s) indicated in the Supplemental Box as being excluded from the scope of this statement. The applicant declares that those additional designations are subject to confirmation and that any designation which is not confirmed before the expiration of 15 months from the priority date is to be regarded as withdrawn by the applicant at the expiration of that time limit. (Confirmation (including fees) must reach the receiving Office within the 15-month time limit.)

**Box No. VI PRIORITY CLAIM**

The priority of the following earlier application(s) is hereby claimed:

| Filing Date<br>of earlier application<br>(day/month/year) | Number<br>of earlier application | Where earlier application is:                        |                                           |                                                |
|-----------------------------------------------------------|----------------------------------|------------------------------------------------------|-------------------------------------------|------------------------------------------------|
|                                                           |                                  | national application:<br>country or Member<br>of WTO | regional application:*<br>regional Office | international application:<br>receiving Office |
| item (1) 16 November 2001<br>(16.11.01) ✓                 | 0127558.9 ✓                      | GB ✓                                                 |                                           |                                                |
| item (2)                                                  |                                  |                                                      |                                           |                                                |
| item (3)                                                  |                                  |                                                      |                                           |                                                |
| item (4)                                                  |                                  |                                                      |                                           |                                                |
| item (5)                                                  |                                  |                                                      |                                           |                                                |

☐ Further priority claims are indicated in the Supplemental Box.

The receiving Office is requested to prepare and transmit to the International Bureau a certified copy of the earlier application(s) (only if the earlier application was filed with the Office which for the purposes of the present international application is the receiving Office) identified above as:

☐ all items   ☐ item (1)   ☐ item (2)   ☐ item (3)   ☐ item (4)   ☐ item (5)   ☐ other, see Suppl. Box

\* Where the earlier application is an ARIPO application, indicate at least one country party to the Paris Convention for the Protection of Industrial Property or one Member of the World Trade Organization for which that earlier application was filed (Rule 4.10(b)(ii)).

**Box No. VII INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

Choice of International Searching Authority (ISA) (If two or more International Searching Authorities are competent to carry out the international search, indicate the Authority chosen; the two-letter code may be used):

ISA /

Request to use results of earlier search; reference to that search (If an earlier search has been carried out by or requested from the International Searching Authority):

Date (day/month/year)

Number

Country (or regional Office)

**Box No. VIII DECLARATIONS**

The following declarations are contained in Boxes Nos. VIII(i) to (v) (mark the applicable check-boxes below and indicate in the right column the number of each type of declaration):

Number of  
declarations

- |                          |                    |                                                                                                                                      |   |
|--------------------------|--------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII (i)   | Declaration as to the identity of the inventor                                                                                       | : |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII (ii)  | Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to apply for and being granted a patent          | : |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII (iii) | Declaration as to the applicant's entitlement, as at the international filing date, to claim the priority of the earlier application | : |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII (iv)  | Declaration of inventorship (only for the purposes of designation of the United States of America)                                   | : |
| <input type="checkbox"/> | Box No. VIII (v)   | Declaration as to non-prejudicial disclosures or exceptions to lack of novelty                                                       | : |

| Box No. IX CHECK LIST; LANGUAGE OF FILING                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                                              |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|-----------------------------------------------|---|----|--------|---|----|----------|---|---|----------|---|---|----------------------------|---|----|---|---|---|----|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----|-------------------------------------|-----------------------|---|---|----|-------------------------------------|-------------------------------------|---|---|----|--------------------------|------------------------------------|---|--|----|-------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|---|---|----|--------------------------|----------------------------------------|---|--|----|-------------------------------------|--------------------------------------------------------------|---|---|----|--------------------------|-----------------------------------------------------------|---|--|----|--------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|---|--|----|--------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|--|--|-----|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|--|--|------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|--|--|-------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|--|-----|--------------------------|--------------------------|---|--|
| <p>This international application contains:</p> <p>(a) the following number of sheets in paper form:</p> <table><tr><td>request</td><td>:</td><td>5</td></tr><tr><td>description (excluding sequence listing part)</td><td>:</td><td>78</td></tr><tr><td>claims</td><td>:</td><td>15</td></tr><tr><td>abstract</td><td>:</td><td>1</td></tr><tr><td>drawings</td><td>:</td><td>0</td></tr><tr><td>Sub-total number of sheets</td><td>:</td><td>99</td></tr></table> <p>sequence listing part of description (<i>actual number of sheets if filed in paper form, whether or not also filed in computer readable form: see (b) below</i>)</p> <table><tr><td>:</td><td>0</td></tr></table> <p>Total number of sheets</p> <table><tr><td>:</td><td>99</td></tr></table> <p>(b) sequence listing part of description filed in computer readable form</p> <p>(i) <input type="checkbox"/> only (under Section 801(a)(i))</p> <p>(ii) <input type="checkbox"/> in addition to being filed in paper form (under Section 801(a)(ii))</p> <p>Type and number of carrier (diskette, CD-ROM, CD-R or other) on which the sequence listing part is contained (<i>additional copies to be indicated under item 9(ii), in § right column</i>):</p> | request                                                      | :                                                                                                                                                                                                                     | 5 | description (excluding sequence listing part) | : | 78 | claims | : | 15 | abstract | : | 1 | drawings | : | 0 | Sub-total number of sheets | : | 99 | : | 0 | : | 99 | <p>This international application is accompanied by the following item(s) (<i>mark the applicable check-boxes below and indicate in right column the number of each item</i>):</p> <table><tr><td>1.</td><td><input checked="" type="checkbox"/></td><td>fee calculation sheet</td><td>:</td><td>1</td></tr><tr><td>2.</td><td><input checked="" type="checkbox"/></td><td>original separate power of attorney</td><td>:</td><td>1</td></tr><tr><td>3.</td><td><input type="checkbox"/></td><td>original general power of attorney</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td>4.</td><td><input checked="" type="checkbox"/></td><td>copy of general power of attorney; reference number, if any: AV 42789</td><td>:</td><td>1</td></tr><tr><td>5.</td><td><input type="checkbox"/></td><td>statement explaining lack of signature</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td>6.</td><td><input checked="" type="checkbox"/></td><td>priority document(s) identified in Box No VI as item(s): (1)</td><td>:</td><td>1</td></tr><tr><td>7.</td><td><input type="checkbox"/></td><td>translation of international application into (language):</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td>8.</td><td><input type="checkbox"/></td><td>separate indications concerning deposited microorganism or other biological material</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td>9.</td><td><input type="checkbox"/></td><td>sequence listing in computer readable form (indicate also type and number of carriers (diskette, CD-ROM, CD-R or other))</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td></td><td>(i)</td><td><input type="checkbox"/> copy submitted for the purposes of international search under rule 13ter only (and not as part of the international application)</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td></td><td>(ii)</td><td><input type="checkbox"/> (<i>only where check-box (b)(i) or (b)(ii) is marked in left column</i>) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under rule 13ter</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td></td><td>(iii)</td><td><input type="checkbox"/> together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listing part mentioned in left column</td><td>:</td><td></td></tr><tr><td>10.</td><td><input type="checkbox"/></td><td>other (<i>specify</i>)</td><td>:</td><td></td></tr></table> | 1. | <input checked="" type="checkbox"/> | fee calculation sheet | : | 1 | 2. | <input checked="" type="checkbox"/> | original separate power of attorney | : | 1 | 3. | <input type="checkbox"/> | original general power of attorney | : |  | 4. | <input checked="" type="checkbox"/> | copy of general power of attorney; reference number, if any: AV 42789 | : | 1 | 5. | <input type="checkbox"/> | statement explaining lack of signature | : |  | 6. | <input checked="" type="checkbox"/> | priority document(s) identified in Box No VI as item(s): (1) | : | 1 | 7. | <input type="checkbox"/> | translation of international application into (language): | : |  | 8. | <input type="checkbox"/> | separate indications concerning deposited microorganism or other biological material | : |  | 9. | <input type="checkbox"/> | sequence listing in computer readable form (indicate also type and number of carriers (diskette, CD-ROM, CD-R or other)) | : |  |  | (i) | <input type="checkbox"/> copy submitted for the purposes of international search under rule 13ter only (and not as part of the international application) | : |  |  | (ii) | <input type="checkbox"/> ( <i>only where check-box (b)(i) or (b)(ii) is marked in left column</i> ) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under rule 13ter | : |  |  | (iii) | <input type="checkbox"/> together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listing part mentioned in left column | : |  | 10. | <input type="checkbox"/> | other ( <i>specify</i> ) | : |  |
| request                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              | :                                                            | 5                                                                                                                                                                                                                     |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| description (excluding sequence listing part)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | :                                                            | 78                                                                                                                                                                                                                    |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| claims                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | :                                                            | 15                                                                                                                                                                                                                    |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| abstract                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | :                                                            | 1                                                                                                                                                                                                                     |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| drawings                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | :                                                            | 0                                                                                                                                                                                                                     |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| Sub-total number of sheets                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | :                                                            | 99                                                                                                                                                                                                                    |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| :                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | 0                                                            |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| :                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | 99                                                           |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 1.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input checked="" type="checkbox"/>                          | fee calculation sheet                                                                                                                                                                                                 | : | 1                                             |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 2.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input checked="" type="checkbox"/>                          | original separate power of attorney                                                                                                                                                                                   | : | 1                                             |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 3.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input type="checkbox"/>                                     | original general power of attorney                                                                                                                                                                                    | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 4.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input checked="" type="checkbox"/>                          | copy of general power of attorney; reference number, if any: AV 42789                                                                                                                                                 | : | 1                                             |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 5.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input type="checkbox"/>                                     | statement explaining lack of signature                                                                                                                                                                                | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 6.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input checked="" type="checkbox"/>                          | priority document(s) identified in Box No VI as item(s): (1)                                                                                                                                                          | : | 1                                             |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 7.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input type="checkbox"/>                                     | translation of international application into (language):                                                                                                                                                             | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 8.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input type="checkbox"/>                                     | separate indications concerning deposited microorganism or other biological material                                                                                                                                  | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 9.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | <input type="checkbox"/>                                     | sequence listing in computer readable form (indicate also type and number of carriers (diskette, CD-ROM, CD-R or other))                                                                                              | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | (i)                                                          | <input type="checkbox"/> copy submitted for the purposes of international search under rule 13ter only (and not as part of the international application)                                                             | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | (ii)                                                         | <input type="checkbox"/> ( <i>only where check-box (b)(i) or (b)(ii) is marked in left column</i> ) additional copies including, where applicable, the copy for the purposes of international search under rule 13ter | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      | (iii)                                                        | <input type="checkbox"/> together with relevant statement as to the identity of the copy or copies with the sequence listing part mentioned in left column                                                            | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 10.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | <input type="checkbox"/>                                     | other ( <i>specify</i> )                                                                                                                                                                                              | : |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| Figure of the drawings which should accompany the abstract: —                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        | Language of filing of the international application: English |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| Box No. X SIGNATURE OF APPLICANT, AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                                                              |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| Next to each signature, indicate the name of the person signing and the capacity in which the person signs (if such capacity is not obvious from reading the request)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                                              |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| In the name of the applicants<br>The representative                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                              |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |                                                              |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |
| 04.11.2002 WEICHSEL, Christian, AV 42789                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                              |                                                                                                                                                                                                                       |   |                                               |   |    |        |   |    |          |   |   |          |   |   |                            |   |    |   |   |   |    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |    |                                     |                       |   |   |    |                                     |                                     |   |   |    |                          |                                    |   |  |    |                                     |                                                                       |   |   |    |                          |                                        |   |  |    |                                     |                                                              |   |   |    |                          |                                                           |   |  |    |                          |                                                                                      |   |  |    |                          |                                                                                                                          |   |  |  |     |                                                                                                                                                           |   |  |  |      |                                                                                                                                                                                                                       |   |  |  |       |                                                                                                                                                            |   |  |     |                          |                          |   |  |

| For receiving Office use only                                                                                                               |                                                                                                                                         |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 1. Date of actual receipt of the purported international application: 15 NOV 2002 (15. 11. 02)                                              | 2. Drawings:<br><input type="checkbox"/> received<br><input checked="" type="checkbox"/> NONE<br><input type="checkbox"/> not received: |
| 3. Corrected date of actual receipt due to later but timely received papers or drawings completing the purported international application: |                                                                                                                                         |
| 4. Date of timely receipt of the required corrections under PCT Article 11(2):                                                              |                                                                                                                                         |
| 5. International Searching Authority ISA/ (if two or more are competent):                                                                   | 6. <input type="checkbox"/> Transmittal of search copy delayed until search fee is paid                                                 |

| For International Bureau use only                               |  |
|-----------------------------------------------------------------|--|
| Date of receipt of the record copy by the International Bureau: |  |

(19) World Intellectual Property Organization  
International Bureau(43) International Publication Date  
22 May 2003 (22.05.2003)

PCT

(10) International Publication Number  
WO 03/042167 A1(51) International Patent Classification<sup>7</sup>: C07C 235/34,  
327/44, 323/22, A01N 37/18Miroslav [SK/SK]; Synkola Consortium, Mlynska dolina-  
areal PvF Uk, 84215 Bratislava (SK).

(21) International Application Number: PCT/EP02/12845

(74) Agent: BASTIAN, Werner; c/o Syngenta Participations  
AG, Intellectual Property, P.O. Box, CH-4002 Basel (CH).

(22) International Filing Date:

15 November 2002 (15.11.2002)

(81) Designated States (*national*): AE, AG, AI, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,  
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,  
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,  
MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG,  
SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ,  
VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Filing Language:

English

(26) Publication Language:

English

(30) Priority Data:

0127556.9 16 November 2001 (16.11.2001) GB

(71) Applicant (*for all designated States except US*): SYN-  
GENTA PARTICIPATIONS AG [CH/CH]; Schwarzwald-  
allee 215, CH-4058 Basel (CH).(84) Designated States (*regional*): ARIPO patent (GH, GM,  
KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
Eurasian patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
European patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE,  
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK,  
TR), OAPI patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

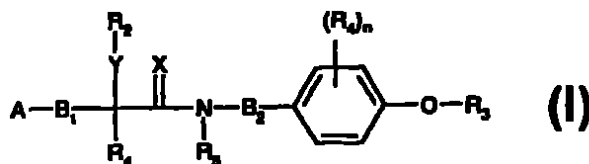
(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (*for US only*): ZELLER, Mar-  
tin [CH/CH]; Syngenta Crop Protection Muenchwilten  
AG, Breitenloh 5, CH-4333 Muenchwilten (CH). LAM-  
BERTH, Clemens [DE/CH]; Syngenta Crop Protection  
AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). KRIZ,

Published:

— with international search report

[Continued on next page]

(54) Title: NOVEL  $\alpha$ -OXYGENATED OR  $\alpha$ -THIOLATED CARBOXYLIC ACID PHENETHYLAMIDE DERIVATIVES

(57) Abstract: The invention relates to  $\alpha$ -oxygenated or  $\alpha$ -thiolated carboxylic acid phenethylamide derivatives of the general formula I including the optical isomers thereof and mixtures of such isomers, wherein A stands for optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl; X is oxygen or sulfur; Y is oxygen or sulfur; R<sub>1</sub> is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, haloalkyl, haloalkenyl, haloalkynyl or halocycloalkyl; R<sub>2</sub> is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, alkoxy-alkyl, alkoxy-alkenyl, alkoxy-alkynyl, whereof all alkyl-, alkenyl-, alkynyl-, or cycloalkyl-groups may be optionally substituted by halogen; or optionally substituted arylalkyl, optionally substituted aryl-alkenyl, optionally substituted aryl-alkynyl or optionally substituted aryloxy-alkyl; R<sub>3</sub> is hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkyl-alkyl, alkoxy-alkyl, alkoxy-alkenyl, alkoxy-alkynyl, whereof all alkyl-, alkenyl-, alkynyl-, or cycloalkyl-groups may be optionally substituted by halogen; or is optionally substituted aryl-alkyl, optionally substituted aryl-alkenyl, optionally substituted aryl-alkynyl, optionally substituted aryloxy-alkyl, optionally substituted heteroaryl-alkyl, optionally substituted heteroaryl-alkenyl or optionally substituted heteroaryl-alkynyl; R<sub>4</sub> is alkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxy-alkyl, alkoxy, alkenyloxy, alkynyloxy, alkylthio, alkanoyl, alkylamino, dialkylamino, alkoxycarbonyl, whereof all alkyl-, alkenyl or alkynyl-groups may be optionally substituted by halogen; or is halogen, cyano, nitro, amino, formyl or carboxyl; R<sub>5</sub> is hydrogen, alkyl, alkenyl or alkynyl; n is an integer 0, 1, 2, 3, or 4; B<sub>1</sub> represents a bridge member -(CR<sub>10</sub>R<sub>11</sub>)<sub>q</sub>- or -(C(R<sub>10</sub>R<sub>11</sub>)<sub>q</sub>)-Z-(CR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>)<sub>r</sub>-, wherein q is an integer 2, 3 or 4; r is an integer 0, 1, 2, 3; s is an integer 1, 2 or 3, provided that (r + s) is either 1, 2 or 3; Z is -O-, -S-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, NR<sub>6</sub>-, -CO-, -OOC-, -COO-, -NR<sub>6</sub>-CO- or -CO-NR<sub>6</sub>-; R<sub>6</sub> is hydrogen or alkyl; R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, R<sub>12</sub> and R<sub>13</sub> independently of each other are hydrogen or alkyl; and B<sub>2</sub> is an alkylene bridge. These compounds possess useful plant protecting properties and may advantageously be employed in agricultural practice for controlling or preventing the infestation of plants by phytopathogenic microorganisms, especially fungi.

From the INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

**PCT**NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF  
THE INTERNATIONAL SEARCH REPORT  
OR THE DECLARATION

(PCT Rule 44.1)

To:

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG  
Intellectual Property  
Attn. Bastian, Werner  
P.O. Box  
CH-4002 Basel  
SWITZERLANDRECEIVED AT INTELLECTUAL  
PROPERTY R&T 8.0 BASEL

13. März 2003

ASSIGN APPL DATA REN  
INVOICE PS TS ARCHIVEDate of mailing  
(day/month/year)

13/03/2003

Applicant's or agent's file reference

PF/5-60119A

FOR FURTHER ACTION

See paragraphs 1 and 4 below

International application No.

PCT/EP 02/12845

International filing date

(day/month/year)

15/11/2002

Applicant

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

- 1.
- ☒
- The applicant is hereby notified that the International Search Report has been established and is transmitted herewith.

Filing of amendments and statement under Article 18:

The applicant is entitled, if he so wishes, to amend the claims of the International Application (see Rule 48):

When? The time limit for filing such amendments is normally 2 months from the date of transmittal of the International Search Report; however, for more details, see the notes on the accompanying sheet.

Where? Directly to the International Bureau of WIPO  
34, chemin des Colombettes  
1211 Geneva 20, Switzerland  
Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

For more detailed instructions, see the notes on the accompanying sheet.

- 2.
- ☐
- The applicant is hereby notified that no International Search Report will be established and that the declaration under Article 17(2)(a) to that effect is transmitted herewith.

- 3.
- ☐
- With regard to the protest against payment of (an) additional fee(s) under Rule 40.2, the applicant is notified that:

☐ the protest together with the decision thereon has been transmitted to the International Bureau together with the applicant's request to forward the texts of both the protest and the decision thereon to the designated Offices.☐ no decision has been made yet on the protest; the applicant will be notified as soon as a decision is made.

4. Further action(s): The applicant is reminded of the following:

Shortly after 18 months from the priority date, the International application will be published by the International Bureau. If the applicant wishes to avoid or postpone publication, a notice of withdrawal of the International application, or of the priority claim, must reach the International Bureau as provided in Rules 90bis.1 and 90bis.3, respectively, before the completion of the technical preparations for international publication.

Within 18 months from the priority date, a demand for international preliminary examination must be filed if the applicant wishes to postpone the entry into the national phase until 30 months from the priority date (in some Offices even later).

Within 20 months from the priority date, the applicant must perform the prescribed acts for entry into the national phase before all designated Offices which have not been elected in the demand or in a later election within 19 months from the priority date or could not be elected because they are not bound by Chapter II.

Name and mailing address of the International Searching Authority

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL-2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Laura Fernández Gómez

These Notes are intended to give the basic instructions concerning the filing of amendments under article 19. The Notes are based on the requirements of the Patent Cooperation Treaty, the Regulations and the Administrative Instructions under that Treaty. In case of discrepancy between these Notes and those requirements, the latter are applicable. For more detailed information, see also the PCT Applicant's Guide, a publication of WIPO.

In these Notes, "Article", "Rule", and "Section" refer to the provisions of the PCT, the PCT Regulations and the PCT Administrative Instructions respectively.

## INSTRUCTIONS CONCERNING AMENDMENTS UNDER ARTICLE 19

The applicant has, after having received the international search report, one opportunity to amend the claims of the international application. It should however be emphasized that, since all parts of the international application (claims, description and drawings) may be amended during the international preliminary examination procedure, there is usually no need to file amendments of the claims under Article 19 except where, e.g. the applicant wants the latter to be published for the purpose of provisional protection or has another reason for amending the claims before international publication. Furthermore, it should be emphasized that provisional protection is available in some States only.

### What parts of the international application may be amended?

Under Article 19, only the claims may be amended.

During the international phase, the claims may also be amended (or further amended) under Article 34 before the International Preliminary Examining Authority. The description and drawings may only be amended under Article 34 before the International Examining Authority.

Upon entry into the national phase, all parts of the international application may be amended under Article 28 or, where applicable, Article 41.

### When?

Within 2 months from the date of transmittal of the international search report or 18 months from the priority date, whichever time limit expires later. It should be noted, however, that the amendments will be considered as having been received on time if they are received by the International Bureau after the expiration of the applicable time limit but before the completion of the technical preparations for international publication (Rule 46.1).

### Where not to file the amendments?

The amendments may only be filed with the International Bureau and not with the receiving Office or the International Searching Authority (Rule 46.2).

Where a demand for international preliminary examination has been/is filed, see below.

### How?

Either by cancelling one or more entire claims, by adding one or more new claims or by amending the text of one or more of the claims as filed.

A replacement sheet must be submitted for each sheet of the claims which, on account of an amendment or amendments, differs from the sheet originally filed.

All the claims appearing on a replacement sheet must be numbered in Arabic numerals. Where a claim is cancelled, no renumbering of the other claims is required. In all cases where claims are renumbered, they must be renumbered consecutively (Administrative Instructions, Section 205(b)).

The amendments must be made in the language in which the international application is to be published.

### What documents must/may accompany the amendments?

**Letter (Section 205(b)):**

The amendments must be submitted with a letter.

The letter will not be published with the international application and the amended claims. It should not be confused with the "Statement under Article 19(1)" (see below, under "Statement under Article 19(1)").

The letter must be in English or French, at the choice of the applicant. However, if the language of the international application is English, the letter must be in English; if the language of the international application is French, the letter must be in French.

# NOTES TO FORM PCT/ISA/220 (continued)

The letter must indicate the differences between the claims as filed and the claims as amended. It must, in particular, indicate, in connection with each claim appearing in the international application (it being understood that identical indications concerning several claims may be grouped), whether

- (i) the claim is unchanged;
- (ii) the claim is cancelled;
- (iii) the claim is new;
- (iv) the claim replaces one or more claims as filed;
- (v) the claim is the result of the division of a claim as filed.

The following examples illustrate the manner in which amendments must be explained in the accompanying letter:

1. [Where originally there were 48 claims and after amendment of some claims there are 51]:  
"Claims 1 to 29, 31, 32, 34, 35, 37 to 48 replaced by amended claims bearing the same numbers; claims 30, 33 and 36 unchanged; new claims 49 to 51 added."
2. [Where originally there were 15 claims and after amendment of all claims there are 11]:  
"Claims 1 to 15 replaced by amended claims 1 to 11."
3. [Where originally there were 14 claims and the amendments consist in cancelling some claims and in adding new claims]:  
"Claims 1 to 6 and 14 unchanged; claims 7 to 13 cancelled; new claims 15, 16 and 17 added." or  
"Claims 7 to 13 cancelled; new claims 15, 16 and 17 added; all other claims unchanged."
4. [Where various kinds of amendments are made]:  
"Claims 1-10 unchanged; claims 11 to 13, 18 and 19 cancelled; claims 14, 15 and 16 replaced by amended claim 14; claim 17 subdivided into amended claims 15, 16 and 17; new claims 20 and 21 added."

## "Statement under article 19(1)" (Rule 48.4)

The amendments may be accompanied by a statement explaining the amendments and indicating any impact that such amendments might have on the description and the drawings (which cannot be amended under Article 19(1)).

The statement will be published with the international application and the amended claims.

It must be in the language in which the international application is to be published.

It must be brief, not exceeding 500 words if in English or if translated into English.

It should not be confused with and does not replace the letter indicating the differences between the claims as filed and as amended. It must be filed on a separate sheet and must be identified as such by a heading, preferably by using the words "Statement under Article 19(1)."

It may not contain any disparaging comments on the international search report or the relevance of citations contained in that report. Reference to citations, relevant to a given claim, contained in the international search report may be made only in connection with an amendment of that claim.

## Consequence if a demand for international preliminary examination has already been filed

If, at the time of filing any amendments under Article 19, a demand for international preliminary examination has already been submitted, the applicant must preferably, at the same time of filing the amendments with the International Bureau, also file a copy of such amendments with the International Preliminary Examining Authority (see Rule 62.2(a), first sentence).

## Consequence with regard to translation of the international application for entry into the national phase

The applicant's attention is drawn to the fact that, where upon entry into the national phase, a translation of the claims as amended under Article 19 may have to be furnished to the designated/elected Office, instead of, or in addition to, the translation of the claims as filed.

For further details on the requirements of each designated/elected Office, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

## PCT

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

(PCT Article 18 and Rules 43 and 44)

|                                                             |                                                                                                                                                         |                                                                |
|-------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------|
| Applicant's or agent's file reference<br><b>PF/5-60119A</b> | <b>FOR FURTHER ACTION</b> see Notification of Transmittal of International Search Report (Form PCT/ISA/220) as well as, where applicable, item 5 below. |                                                                |
| International application No.<br><b>PCT/EP 02/12845</b>     | International filing date (day/month/year)<br><b>15/11/2002</b>                                                                                         | (Earliest) Priority Date (day/month/year)<br><b>16/11/2001</b> |
| Applicant<br><b>SYNGENTA PARTICIPATIONS AG</b>              |                                                                                                                                                         |                                                                |

This International Search Report has been prepared by this International Searching Authority and is transmitted to the applicant according to Article 18. A copy is being transmitted to the International Bureau.

This International Search Report consists of a total of 6 sheets.

☒ It is also accompanied by a copy of each prior art document cited in this report.

## 1. Basis of the report

- a. With regard to the language, the international search was carried out on the basis of the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ the international search was carried out on the basis of a translation of the international application furnished to this Authority (Rule 23.1(b)).

- b. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international search was carried out on the basis of the sequence listing:

☐ contained in the international application in written form.

☐ filed together with the international application in computer readable form.

☐ furnished subsequently to this Authority in written form.

☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.

☐ the statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.

☐ the statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

2. ☒ Certain claims were found unsearchable (See Box I).

3. ☐ Unity of invention is lacking (see Box II).

## 4. With regard to the title,

☒ the text is approved as submitted by the applicant.

☐ the text has been established by this Authority to read as follows:

## 5. With regard to the abstract,

☒ the text is approved as submitted by the applicant.

☐ the text has been established, according to Rule 35.2(b), by this Authority as it appears in Box III. The applicant may, within one month from the date of mailing of this international search report, submit comments to this Authority.

## 6. The figure of the drawings to be published with the abstract is Figure No.

☐ as suggested by the applicant.

☐ because the applicant failed to suggest a figure.

☐ because this figure better characterizes the invention.

☒ None of the figures.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 02/12845

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07C235/34 C07C327/44 C07C323/22 A01N37/18

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)

IPC 7 C07C A01N

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 practical, search terms used)

EPO-Internal, PAJ, WPI Data, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                                    | Relevant to claim No. |
|------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| A          | WO 94 29267 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 22 December 1994 (1994-12-22)<br>cited in the application<br>tables 1,2,6<br>---                                         | 1-13                  |
| A          | WO 96 17840 A (AGREVO UK LTD ;DOELLER UWE (DE); BRAUN PETER (DE); SACHSE BURKHARD) 13 June 1996 (1996-06-13)<br>cited in the application<br>table 1<br>---            | 1-13                  |
| P,A        | WO 01 87822 A (CEDERBAUM FREDRIK ;KUNZ WALTER (CH); ZELLER MARTIN (CH); SYNGENTA) 22 November 2001 (2001-11-22)<br>cited in the application<br>abstract<br>---<br>-/- | 1-13                  |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in 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

\*T\* 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.

\*A\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 March 2003

Date of mailing of the international search report

13/03/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentkan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Janus, S

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                                                                                                                                                      | Relevant to claim No. |
|------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| A          | WO 99 33810 A (IHARA CHEMICAL IND CO<br>;KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO (JP);<br>MATSUMOTO) 8 July 1999 (1999-07-08)<br>abstract<br>---                                                                                                                                                    | 1-13                  |
| A          | PATENT ABSTRACTS OF JAPAN<br>vol. 017, no. 391 (C-1087),<br>22 July 1993 (1993-07-22)<br>& JP 05 070428 A (MITSUBISHI PETROCHEM CO<br>LTD), 23 March 1993 (1993-03-23)<br>abstract<br>---                                                                                               | 1-13                  |
| A          | PETTIT G R ET AL: "Isolation and<br>Structure of Hemibastadinols 1-3 from the<br>Papua New Guinea Marine Sponge Ianthella<br>basta"<br>JOURNAL OF NATURAL PRODUCTS,<br>vol. 59, no. 10, 1996, pages 927-934,<br>XP001146001<br>cited in the application<br>examples 9,10,13-16<br>----- | 1-13                  |

## FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

Continuation of Box I.2

Claims Nos.: 1-5, 9-13 (all in part)

The initial phase of the search revealed a very large number of documents relevant to the issue of novelty. So many documents were retrieved that it is impossible to determine which parts of the claim(s) may be said to define subject-matter for which protection might legitimately be sought (Article 6 PCT). For these reasons, a meaningful search over the whole breadth of the claim(s) is impossible.

In addition, the claims relate to an extremely large number of possible compounds, whereas support within the meaning of Article 6 PCT is to be found, however, for only a very small proportion of the compounds claimed. In the present case, the claims so lack support that a meaningful search over the whole of the claimed scope is impossible.

Consequently, the search has been carried out for those parts of the claims which appear to be supported and disclosed, namely those parts relating to the compounds of formula (I) wherein B2 is a methylene or an ethylene group.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims, relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). The applicant is advised that the EPO policy when acting as an International Preliminary Examining Authority is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report or during any Chapter II procedure.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

**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.: 1-5, 9-13 (all in part)  
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:  
see FURTHER INFORMATION sheet PCT/ISA/210
  
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 claim No.:

Remark on Protest

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

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 02/12845

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|-------------------------------------------|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| WO 9429267                                | A | 22-12-1994          | DE 4319887 A1              | 22-12-1994          |
|                                           |   |                     | AU 7123994 A               | 03-01-1995          |
|                                           |   |                     | CN 1128019 A               | 31-07-1996          |
|                                           |   |                     | WO 9429267 A1              | 22-12-1994          |
|                                           |   |                     | EP 0703899 A1              | 03-04-1996          |
|                                           |   |                     | HU 73352 A2                | 29-07-1996          |
|                                           |   |                     | JP 8511772 T               | 10-12-1996          |
| WO 9617840                                | A | 13-06-1996          | AU 4265596 A               | 26-06-1996          |
|                                           |   |                     | WO 9617840 A1              | 13-06-1996          |
| WO 0187822                                | A | 22-11-2001          | AU 6030101 A               | 26-11-2001          |
|                                           |   |                     | BR 0110810 A               | 11-02-2003          |
|                                           |   |                     | WO 0187822 A1              | 22-11-2001          |
|                                           |   |                     | EP 1282595 A1              | 12-02-2003          |
| WO 9933810                                | A | 08-07-1999          | AU 1685999 A               | 19-07-1999          |
|                                           |   |                     | WO 9933810 A1              | 08-07-1999          |
|                                           |   |                     | JP 11263776 A              | 28-09-1999          |
| JP 05070428                               | A | 23-03-1993          | NONE                       |                     |

The demand must be filed directly with the competent International Preliminary Examining Authority or, if two or more Authorities are competent, with the one chosen by the applicant. The full name or two-letter code of that Authority may be indicated by the applicant on the line below:

IPEA/ \_\_\_\_\_

PCT

CHAPTER II

DEMAND

under Article 31 of the Patent Cooperation Treaty:  
The undersigned requests that the international application specified below be the subject of international preliminary examination according to the Patent Cooperation Treaty and hereby elects all eligible States (except where otherwise indicated).

|                                                            |                           |
|------------------------------------------------------------|---------------------------|
| For International Preliminary Examining Authority use only |                           |
| Identification of IPEA                                     | Date of receipt of DEMAND |

|                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                          |                                                         |  |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------|--|
| Box No. I IDENTIFICATION OF THE INTERNATIONAL APPLICATION                                                                                                                                                                                                                     |                                                          | Applicant's or agent's file reference<br>PF/5-60119A    |  |
| International application No.<br>PCT/EP02/12845                                                                                                                                                                                                                               | International filing date (day/month/year)<br>15.11.2002 | (Earliest) Priority date (day/month/year)<br>16.11.2001 |  |
| Title of invention<br>NOVEL $\alpha$ -OXYGENATED OR $\alpha$ -THIOLATED CARBOXYLIC ACID PHENETHYLAMIDE DERIVATIVES                                                                                                                                                            |                                                          |                                                         |  |
| Box No. II APPLICANT(S)                                                                                                                                                                                                                                                       |                                                          |                                                         |  |
| Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)<br><br>Syngenta Participations AG<br>Schwarzwaldallee 215<br>4058 Basel<br>CH                                |                                                          | Telephone No.:<br>+4161 323 11 11                       |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                          | Facsimile No.:<br>+4161 323 50 44                       |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                          | Teleprinter No.:                                        |  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                               |                                                          | Applicant's registration No. with the Office            |  |
| State (that is, country) of nationality:<br>CH                                                                                                                                                                                                                                |                                                          | State (that is, country) of residence:<br>CH            |  |
| Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)<br><br>ZELLER, Martin<br>Syngenta Crop Protection Muenchwillen AG<br>Breitenloh 5<br>4333 Muenchwillen<br>CH |                                                          |                                                         |  |
| State (that is, country) of nationality:<br>CH                                                                                                                                                                                                                                |                                                          | State (that is, country) of residence:<br>CH            |  |
| Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)<br><br>LAMBERTH, Clemens<br>Syngenta Crop Protection AG<br>Schwarzwaldallee 215<br>4058 Basel<br>CH          |                                                          |                                                         |  |
| State (that is, country) of nationality:<br>DE                                                                                                                                                                                                                                |                                                          | State (that is, country) of residence:<br>CH            |  |
| <input checked="" type="checkbox"/> Further applicants are indicated on a continuation sheet.                                                                                                                                                                                 |                                                          |                                                         |  |

## Continuation of Box No. II APPLICANT(S)

*If none of the following sub-boxes is used, this sheet should not be included in the demand.*

**Name and address:** *(Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)*

KRIZ, Miroslav  
Synkola Consortium  
Mlynska dolina - areal PvF UK  
84215 Bratislava  
SK

**State (that is, country) of nationality:**

SK

**State (that is, country) of residence:**

SK

**Name and address:** *(Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)*

**State (that is, country) of nationality:**

**State (that is, country) of residence:**

**Name and address:** *(Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)*

**State (that is, country) of nationality:**

**State (that is, country) of residence:**

**Name and address:** *(Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation. The address must include postal code and name of country.)*

**State (that is, country) of nationality:**

**State (that is, country) of residence:**

☐ Further applicants are indicated on another continuation sheet.

**Box No. III AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE; OR ADDRESS FOR CORRESPONDENCE**The following person is ☒ agent ☐ common representativeand ☒ has been appointed earlier and represents the applicant(s) also for international preliminary examination.☐ is hereby appointed and any earlier appointment of (an) agent(s)/common representative is hereby revoked.☐ is hereby appointed, specifically for the procedure before the International Preliminary Examining Authority, in addition to the agent(s)/common representative appointed earlier.Name and address: (Family name followed by given name; for a legal entity, full official designation.  
The address must include postal code and name of country.)BASTIAN, Werner  
c/o Syngenta Participations AG  
Intellectual Property  
P.O. Box  
CH-4002 Basel  
Switzerland

Telephone No.:

+4161 323 11 11

Facsimile No.:

+4161 323 50 44

Teleprinter No.:

Agent's registration No. with the Office

☐ Address for correspondence: Mark this check-box where no agent or common representative is/has been appointed and the space above is used instead to indicate a special address to which correspondence should be sent.**Box No. IV BASIS FOR INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION****Statement concerning amendments:\***

1. The applicant wishes the international preliminary examination to start on the basis of:

☒ the international application as originally filedthe description ☐ as originally filed☐ as amended under Article 34the claims ☐ as originally filed☐ as amended under Article 19 (together with any accompanying statement)☐ as amended under Article 34the drawings ☐ as originally filed☐ as amended under Article 342. ☐ The applicant wishes any amendment to the claims under Article 19 to be considered as reversed.3. ☐ The applicant wishes the start of the international preliminary examination to be postponed until the expiration of 20 months from the priority date unless the International Preliminary Examining Authority receives a copy of any amendments made under Article 19 or a notice from the applicant that he does not wish to make such amendments (Rule 69.1(d)). (This checkbox may be marked only where the time limit under Article 19 has not yet expired.)

\* Where no check-box is marked, international preliminary examination will start on the basis of the international application as originally filed or, where a copy of amendments to the claims under Article 19 and/or amendments of the international application under Article 34 are received by the International Preliminary Examining Authority before it has begun to draw up a written opinion or the international preliminary examination report, as so amended.

Language for the purposes of international preliminary examination: English☒ which is the language in which the international application was filed.☐ which is the language of a translation furnished for the purposes of international search.☒ which is the language of publication of the international application.☐ which is the language of the translation (to be) furnished for the purposes of international preliminary examination.**Box No. V ELECTION OF STATES**

The applicant hereby elects all eligible States (that is, all States which have been designated and which are bound by Chapter II of the PCT)

excluding the following States which the applicant wishes not to elect:

## Box No. VI CHECK LIST

The demand is accompanied by the following elements, in the language referred to in Box No. IV, for the purposes of international preliminary examination:

For International Preliminary  
Examining Authority use only

received not received

- |                                                                             |   |        |                          |                          |
|-----------------------------------------------------------------------------|---|--------|--------------------------|--------------------------|
| 1. translation of international application                                 | : | sheets | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |
| 2. amendments under Article 34                                              | : | sheets | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |
| 3. copy (or, where required, translation) of<br>amendments under Article 19 | : | sheets | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |
| 4. copy (or, where required, translation) of<br>statement under Article 19  | : | sheets | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |
| 5. letter                                                                   | : | sheets | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |
| 6. other (specify)                                                          | : | sheets | <input type="checkbox"/> | <input type="checkbox"/> |

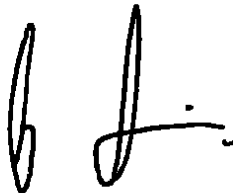
The demand is also accompanied by the item(s) marked below:

- |                                                                                             |                                                                        |
|---------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------|
| 1. <input checked="" type="checkbox"/> fee calculation sheet                                | 5. <input type="checkbox"/> statement explaining lack of signature     |
| 2. <input type="checkbox"/> original separate power of attorney                             | 6. <input type="checkbox"/> sequence listing in computer readable form |
| 3. <input type="checkbox"/> original general power of attorney                              | 7. <input type="checkbox"/> other (specify):                           |
| 4. <input type="checkbox"/> copy of general power of attorney;<br>reference number, if any: |                                                                        |

## Box No. VII SIGNATURE OF APPLICANT, AGENT OR COMMON REPRESENTATIVE

Next to each signature, indicate the name of the person signing and the capacity in which the person signs (if such capacity is not obvious from reading the demand).

In the name of the applicants  
The representative



09.05.2003

BASTIAN, Werner, AV 42789

For International Preliminary Examining Authority use only

1. Date of actual receipt of DEMAND:

2. Adjusted date of receipt of demand due  
to CORRECTIONS under Rule 60.1(b):

|                                                                                                                                                                      |                                                                          |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------|
| 3. <input type="checkbox"/> The date of receipt of the demand is AFTER the expiration of 19 months<br>from the priority date and item 4 or 5, below, does not apply. | <input type="checkbox"/> The applicant has been<br>informed accordingly. |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------|

4. ☐ The date of receipt of the demand is WITHIN the period of 19 months from the priority date as extended by virtue of  
Rule 80.5.5. ☐ Although the date of receipt of the demand is after the expiration of 19 months from the priority date, the delay in  
arrival is EXCUSED pursuant to Rule 82.

For International Bureau use only

Demand received from IPEA on:

Along Form PCT/IPEA/401

See Notes to the demand form

# PATENT COOPERATION TREATY

146  
CW

From the  
INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINING AUTHORITY

## PCT

|                                                                                                                             |  |                                                                                            |                               |                                                                                                                   |  |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|--------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|
| <b>To:</b><br>Bastian, Werner<br>SYNGENTA PARTICIPATIONS AG<br>Intellectual Property<br>P.O. Box<br>CH-4002 Basel<br>SUISSE |  | <b>RECEIVED AT INTELLECTUAL<br/>PROPERTY R&amp;T 8.0 BASEL</b><br><br><b>10. Juni 2003</b> |                               | <b>NOTIFICATION OF TRANSMITTAL OF<br/>INTERNATIONAL PRELIMINARY<br/>EXAMINATION REPORT</b><br><br>(PCT Rule 71.1) |  |
| ASSIGN<br>INVOICE                                                                                                           |  | FS 13 ARCHIVE                                                                              |                               | <b>Date of mailing</b><br>06/06/2003                                                                              |  |
| <b>Applicant's or agent's file reference</b><br>PF/5-60119A                                                                 |  |                                                                                            | <b>IMPORTANT NOTIFICATION</b> |                                                                                                                   |  |
| <b>International application No.</b><br>PCT/EP 02/ 12845                                                                    |  | <b>International filing date (day/month/year)</b><br>15/11/2002                            |                               | <b>Priority date (day/month/year)</b><br>16/11/2001                                                               |  |
| <b>Applicant</b><br><br>SYNGENTA PARTICIPATIONS AG                                                                          |  |                                                                                            |                               |                                                                                                                   |  |

1. The applicant is hereby notified that this International Preliminary Examining Authority transmits herewith the international preliminary examination report and its annexes, if any, established on the international application.
2. A copy of the report and its annexes, if any, is being transmitted to the International Bureau for communication to all the elected Offices.
3. Where required by any of the elected Offices, the International Bureau will prepare an English translation of the report (but not of any annexes) and will transmit such translation to those Offices.
4. **REMINDER**

The applicant must enter the national phase before each elected Office by performing certain acts (filing translations and paying national fees) within 30 months from the priority date (or later in some Offices)(Article 39(1))(see also the reminder sent by the International Bureau with Form PCT/IB/301).

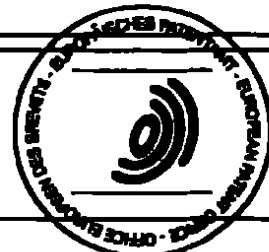
Where a translation of the international application must be furnished to an elected Office, that translation must contain a translation of any annexes to the international preliminary examination report. It is the applicant's responsibility to prepare and furnish such translation directly to each elected Office concerned.

For further details on the applicable time limits and requirements of the elected Offices, see Volume II of the PCT Applicant's Guide.

The applicant's attention is drawn to Article 33(5), which provides that the criteria of novelty, inventive step and industrial applicability described in Article 33(2) to (4) merely serve the purposes of international preliminary examination and that "any Contracting State may apply additional or different criteria for the purposes of deciding whether, in that State, the claimed inventions is patentable or not" (see also Article 27(5)). Such additional criteria may relate, for example, to exemptions from patentability, requirements for enabling disclosure, clarity and support for the claims.

|                                                                                                                                                                                                                                                        |  |                                                                        |  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|------------------------------------------------------------------------|--|
| <b>Name and mailing address of the IPEA/</b><br><br> European Patent Office<br>D-80298 Munich<br>Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d<br>Fax: (+49-89) 2399-4465 |  | <b>Authorized officer</b><br><br>CHURCHER G<br>Tel. (+49-89) 2399 2828 |  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|------------------------------------------------------------------------|--|

Form PCT/IPEA/416 (August 2002) P20473



PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

(Rationalised Report according to the Notice of the President of the EPO published in the OJ11/2001)

|                                                                                            |                                                                                                                        |                                              |
|--------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------|
| Applicant's or agent's file reference<br>PF/5-60119A                                       | FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416) |                                              |
| International application No.<br>PCT/EP 02/ 12845                                          | International filing date (day/month/year)<br>15/11/2002                                                               | Priority date (day/month/year)<br>16/11/2001 |
| International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC<br>C07C235/34 |                                                                                                                        |                                              |
| Applicant<br>SYNGENTA PARTICIPATIONS AG                                                    |                                                                                                                        |                                              |

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 2 sheets, including this cover sheet.
- ☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consists of a total of \_\_\_\_\_ sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:
- I ☒ Basis of the report
  - II ☐ Priority
  - III ☒ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
  - IV ☐ Lack of unity of invention
  - V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
  - VI ☐ Certain documents cited
  - VII ☐ Certain defects in the international application
  - VIII ☐ Certain observations on the international application

|                                                                                                                                                                                                                                             |                                                            |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------|
| Date of submission of the demand<br>12/05/2003                                                                                                                                                                                              | Date of completion of this report<br>02/06/2003            |
| Name and mailing address of the IPEA/<br> European Patent Office<br>D-80298 Munich<br>Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d<br>Fax: (+49-89) 2399-4465 | Authorized officer<br>JONES M H<br>Tel. (+49-89) 2399 2828 |



**INTERNATIONAL PRELIMINARY  
EXAMINATION REPORT**

International application No PCT/EP 02/ 12845

**I. Basis of the report**

The basis of this international preliminary examination is the application as originally filed.

**III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability**

If all the additional search fees, which the applicant has been invited to pay, have not been paid, then all the inventions or groups of inventions corresponding to the unpaid fees will not have been searched. This means that the question of whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step, or to be industrially applicable has not been the subject of the international preliminary examination in respect of the claims corresponding to these inventions or groups of inventions (Article 17(3)(a) and Rule 66.1(e) PCT; see also international search report).

**IV. Lack of unity of invention**

The objection as to lack of unity raised in the international search report is maintained. The reasons for the objection are the same as those indicated in the international search report.

**V. Reasoned statement under Rule 66.2(a)(II) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability**

To the extent that the international preliminary examination has been carried out (see item III above), the following is pointed out:

In light of the documents cited in the international search report, it is considered that the invention as defined in at least some of the claims, which have been the subject of an international search report, does not appear to meet the criteria mentioned in Article 33(1) PCT, i.e. does not appear to be novel and/or to involve an inventive step (see international search report, in particular the documents cited X and/or Y and corresponding claim references).

# REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

## 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 ( )

## DISEÑO INDUSTRIAL ( )

- 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 o fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño
- Comprobante de pago de las tasas establecidas

COMPLETA ( )

INCOMPLETA ( )

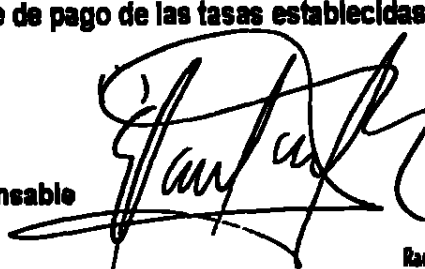
## ESQUEMA DE TRAZADO ( )

- 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

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO  
 Radicación 04034536 00000000 Folios 148  
 Fecha (MM): 2004-04-15 14:07:42  
 Trámite 011 PCT-PATENT 379 FASE NACI 411 PRESENTAR  
 Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES



486  
150

2020  
Bogotá, D.C.,

**Doctora:**  
Jimena Escobar Uribe  
Apoderada  
Syngenta Participations AG.

**Oficio N° 04769**

|                |                                   |                         |
|----------------|-----------------------------------|-------------------------|
| <b>ASUNTO:</b> | <b>Radicación N°</b>              | <b>04-34538</b>         |
|                | <b>Solicitud Internacional</b>    | <b>PCT/EP2002/12845</b> |
|                | <b>Fecha inicio fase nacional</b> | <b>16/08/2004</b>       |
|                | <b>Trámite</b>                    | <b>011</b>              |
|                | <b>Evento</b>                     | <b>379</b>              |
|                | <b>Actuación</b>                  | <b>430</b>              |
|                | <b>Folios</b>                     | <b>001</b>              |

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. 28-k) Decisión 486).

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.

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 07 FEB 2004.