

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 536 973**

51 Int. Cl.:

A01N 43/10

(2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **15.11.2002** **E 02790388 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **18.03.2015** **EP 1444196**

54 Título: **Derivados de fenetilamida del ácido carboxílico α -oxigenados**

30 Prioridad:

16.11.2001 GB 0127556

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

01.06.2015

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
SCHWARZWALDALLEE 215
4058 BASEL, CH**

72 Inventor/es:

**ZELLER, MARTIN;
LAMBERTH, CLEMENS y
KRIZ, MIROSLAV**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 536 973 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Derivados de fenetilamida del ácido carboxílico α -oxigenados

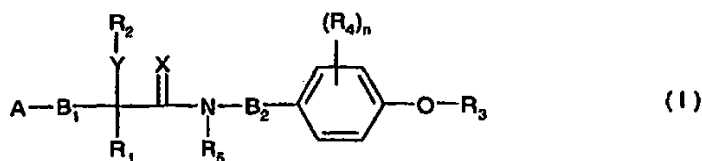
La presente invención se refiere a derivados de fenetilamida del ácido carboxílico oxigenados en α de fórmula I. Se refiere a la preparación de estos compuestos activos y a las composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de estos compuestos como ingrediente activo. La invención se refiere además a la preparación de las mencionadas composiciones y al uso de los compuestos o de las composiciones para controlar o prevenir la infestación de plantas por microorganismos fitopatógenos, especialmente hongos.

La presencia de al menos un átomo de carbono asimétrico en los compuestos de fórmula I significa que los compuestos pueden presentarse en formas ópticamente isómeras y enantiómeras. Como resultado de la presencia de un posible doble enlace C=C alifático, también puede presentarse isomería geométrica. La fórmula I está destinada a incluir todas las posibles formas isómeras y sus mezclas. Cuando no se especifica un isómero específico, se hace referencia a las mezclas de diastereoisómeros o racemato, como pueden obtenerse a partir de los métodos de síntesis.

Pettit GR et al (1996) (Journal of natural products, Vol 59, No 10 p. 927-934) describen el aislamiento y estructura de hemiblastadinoles 1-3 de la esponja marina de Papúa Nueva Guinea Lanthella basta. Patent Abstracts of Japan (1993) (Vol 17, No 391 (C-1087) y el documento JP-05070428 describen compuestos amídicos que tienen un efecto fungicida. Sin embargo, ninguno de estos documentos describe compuestos según la reivindicación 1 de esta solicitud.

Se han propuesto ciertos derivados de ácido mandélico para controlar hongos destructivos de plantas (por ejemplo en el documento WO 94/29267, en el documento WO 96/17840 y en el documento WO 01/87822. Sin embargo, la acción de esas preparaciones no es satisfactoria 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.

Según la presente invención, se proporciona un compuesto de la fórmula general



incluyendo sus isómeros ópticos y mezclas de tales isómeros, en la que

A es fenilo o tienilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alqueno de C₂-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₁₀-tio, alcanilo de C₁-C₄, halógeno y ciano; y X es oxígeno; e Y es oxígeno; y R₁ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alqueno de C₃-C₈ o alquinilo de C₃-C₈; y R₂ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alqueno de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₆-alquinilo de C₃-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquinilo de C₃-C₄, y R₃ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alqueno de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₆-alquinilo de C₃-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquinilo de C₃-C₄; y R₄ es 3-alcoxi de C₁-C₆; y R₅ es hidrógeno o metilo; y B₁ se selecciona de -CH₂-CH₂-, -O-CH₂- y -S-CH₂-; y n es el número entero 0 ó 1; y B₂ es -CH₂-CH₂-, CH₂-.

En una realización preferida del compuesto según la invención, A es fenilo, opcionalmente sustituido con uno o dos sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno y ciano; y X e Y son ambos oxígeno; y R₁ es hidrógeno; y R₂ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, alqueno de C₃-C₄ o alquinilo de C₃-C₄; y R₃ es alquilo de C₁-C₄, alqueno de C₃-C₄ o alquinilo de C₃-C₄; y R₄ es 3-metoxi o 3-etoxi; y R₅ es hidrógeno; y B₁ se selecciona de -CH₂-CH₂-, -O-CH₂- y -S-CH₂-; y n es el número entero 1; y B₂ es -CH₂-CH₂-.

Compuestos individuales preferidos según la presente invención son:

- 2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,
- 2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,
- 2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,
- N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-inilo-butiramida,
- 2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,
- 2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,
- 2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-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-fluoro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 4-(4-fluoro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 2-etoxi-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 5 4-(4-fluoro-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,
 10 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,
 15 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,
 20 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-fluoro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 3-(4-fluoro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 2-etoxi-3-(4-fluoro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 25 3-(4-fluoro-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,
 30 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,
 35 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,
 5 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,
 10 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 se obtienen principalmente como mezclas de las formas R y S. Sin embargo, es posible obtener los enantiómeros puros bien mediante métodos de separación clásicos o bien mediante métodos sintéticos estereoselectivos. En la preparación práctica, puede obtenerse una mezcla enantioenriquecida de ambas formas, mientras que a escala de laboratorio pueden obtenerse enantiómeros analíticamente puros, tales como:

- (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,
 20 (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,
 25 (R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-butiramida,
 (R)-4-(4-fluoro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (R)-4-(4-fluoro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (R)-2-etoxi-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (R)-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,
 30 (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,
 35 (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-2-iniloxi-propionamida,
 (R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,

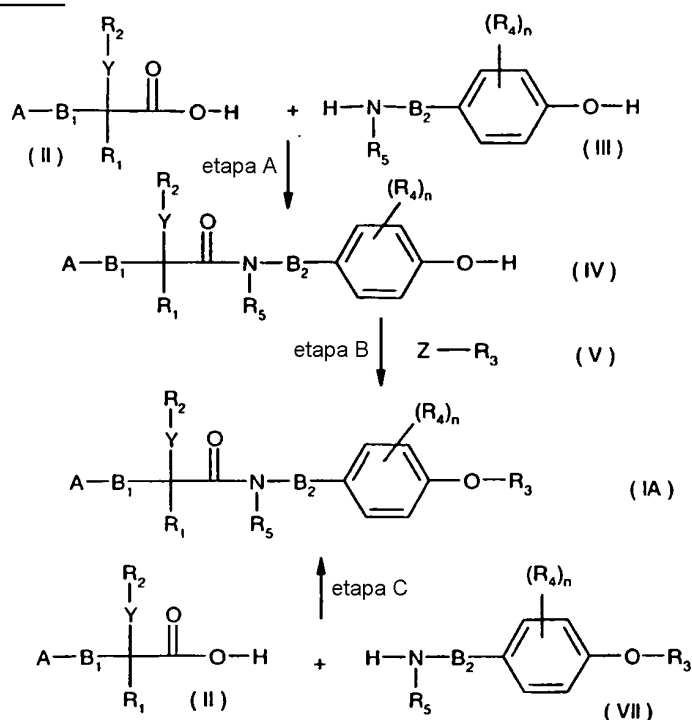
- (R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,
 (R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,
 (R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-3-p-toliloxi-propionamida,
 (R)-3-(4-etil-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 5 (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-fluoro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (R)-3-(4-fluoro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 10 (R)-2-etoxi-3-(4-fluoro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (R)-3-(4-fluoro-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,
 15 (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,
 20 (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,
 25 (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,
 30 (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
 35 (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,
 5 (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-fluoro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (S)-4-(4-fluoro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (S)-2-etoxi-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 10 (S)-4-(4-fluoro-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,
 15 (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,
 20 (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,
 25 (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-fluoro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (S)-3-(4-fluoro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (S)-2-etoxi-3-(4-fluoro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 30 (S)-3-(4-fluoro-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,
 35 (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,
 5 (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,
 10 (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,
 15 (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.

Los compuestos de fórmula I pueden obtenerse de acuerdo con uno de los procedimientos de los Esquemas 1 a 5:

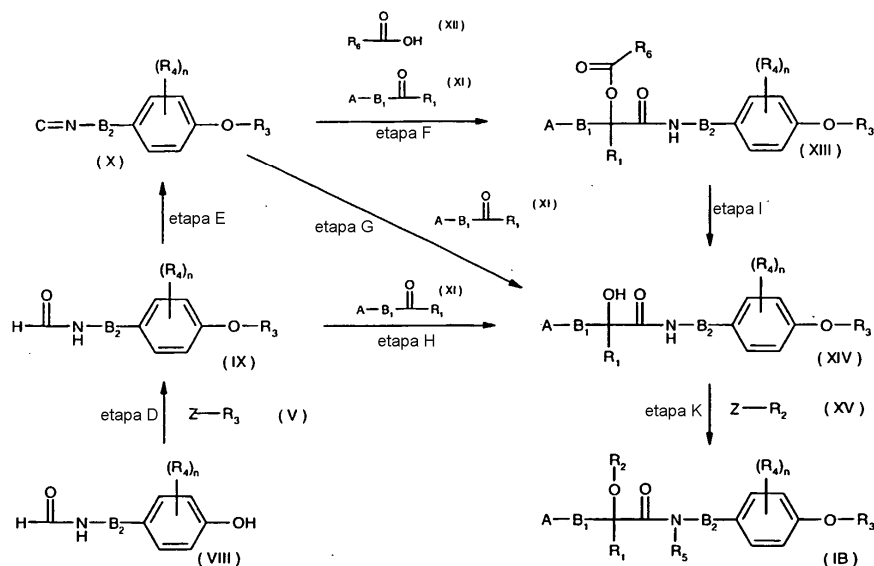
Esquema 1:



- 20 Etapa A: Un ácido de fórmula II o un derivado activado con carboxi de un ácido de fórmula II en la que A, B₁, R₁, R₂ e Y son como se definieron para la fórmula I se hace reaccionar con una amina de fórmula III en la que B₂, R₄ y R₅ son como se definieron para la fórmula I, opcionalmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un agente diluyente.

- Derivados activados con carboxi del ácido de fórmula II son todos los compuestos que tienen un grupo carboxilo activado, como un haluro de ácido, tal como un cloruro de ácido; como anhídridos simétricos o mixtos, tales como anhídridos mixtos con O-alquilcarbonatos; como ésteres activados, tales como ésteres p-nitrofenílicos o ésteres N-hidroxisuccinimidílicos, o incluso ésteres normales, tales como ésteres metílicos, ésteres etílicos, ésteres n-propílicos, ésteres iso-propílicos, ésteres n-butílicos, ésteres terc-butílicos, ésteres neo-pentílicos o ésteres iso-amílicos; así como formas activadas formadas in situ del ácido de fórmula II con agentes de condensación, tales como dicitlohexilcarbodiimida, 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 pueden prepararse mediante la reacción de un ácido de fórmula II con ésteres de ácido clorofórmico, como ésteres alquílicos de ácido clorofórmico, tales como cloroformiato de etilo o cloroformiato de isobutilo, opcionalmente en presencia de una base orgánica o inorgánica como una amina terciaria, tal como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, piridina, N-metil-piperidina o N-metil-morfolina.
- La presente reacción se realiza preferiblemente en un disolvente como hidrocarburos aromáticos, no aromáticos o halogenados, tales como 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 éter dietílico, terc-butil-metil-éter, dioxano o tetrahidrofurano o agua. También es posible usar mezclas de estos disolventes. La reacción se lleva a cabo opcionalmente en presencia de una base orgánica o inorgánica como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, piridina, N-metil-piperidina o N-metil-morfolina, como un hidróxido metálico o un carbonato metálico, preferentemente un hidróxido alcalino o un carbonato alcalino, tal como hidróxido de litio, hidróxido sódico o hidróxido potásico, a temperaturas que oscilan de -80°C a +150°C, preferentemente a temperaturas que oscilan de -40°C a +40°C.
- Etapla B: Los compuestos de fórmula IA pueden prepararse como producto final al hacer reaccionar un fenol de fórmula IV, en la que A, B₁, B₂, R₁, R₂, R₄, R₅ e Y son como se definieron para la fórmula I, con un compuesto de fórmula V, en la que R₃ es como se definió para la fórmula I y en la que Z es un grupo saliente tal como un haluro, tal como cloruro o bromuro, o un éster sulfónico, tal como un tosilato, mesilato o triflato.
- La reacción se lleva a cabo ventajosamente en un disolvente como hidrocarburos aromáticos, no aromáticos o halogenados, tales como clorohidrocarburos, por ejemplo diclorometano o tolueno; cetonas, por ejemplo acetona o 2-butanona; ésteres, por ejemplo acetato de etilo, éteres, por ejemplo éter dietílico, terc-butilmetil-éter, dioxano o tetrahidrofurano; amidas, por ejemplo N,N-dimetilformamida; nitrilos, por ejemplo acetonitrilo; alcoholes, por ejemplo metanol, etanol, isopropanol, n-butanol o terc-butanol; sulfóxidos, por ejemplo dimetilsulfóxido o agua. También es posible usar mezclas de estos disolventes. La reacción se lleva a cabo opcionalmente en presencia de una base orgánica o inorgánica como una amina terciaria, tal como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, piridina, N-metilpiperidina o N-metilmorfolina, como un hidróxido metálico, un carbonato metálico o un alcóxido metálico, preferentemente un hidróxido alcalino, un carbonato alcalino o un alcóxido alcalino, tal como hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, metóxido sódico, metóxido potásico, etóxido sódico, etóxido potásico, terc-butóxido sódico o terc-butóxido potásico, a temperaturas que oscilan de -80°C a +200°C, preferentemente a temperaturas que oscilan de 0°C a +120°C.
- Etapla C: Alternativamente a la etapa A y la etapa B, un ácido de fórmula II o un derivado activado con carboxi de un ácido de fórmula II, en la que A, B₁, R₁, R₂ e Y son como se definieron para la fórmula I, se hace reaccionar con una amina de fórmula VII, en la que B₂, R₃, R₄ y R₅ son como se definieron para la fórmula I, en las mismas condiciones como se definieron para la etapa A, opcionalmente en presencia de una base y opcionalmente en presencia de un agente diluyente.

Esquema 2:



Etapa D: Un compuesto de fórmula VIII, en la que B_2 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, se alquila con un compuesto de fórmula V (véase el Esquema 1), en la que R_3 y Z son como se definieron para el Esquema 1, en las mismas condiciones como se definieron para la etapa B en el Esquema 1.

- 5 Etapa E: Un compuesto de fórmula IX, en la que B_2 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, se deshidrata hasta un isocianuro de fórmula X, en la que B_2 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, en condiciones conocidas de por sí (D. Seebach, G. Adam, T. Gees, M. Schiess, W. Weigang, Chem. Ber. 1988, 121,507).

- 10 Etapa F: Un isocianuro de fórmula X, en la que B_2 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, se hace reaccionar en una reacción de Passerini de tres componentes (J. March, Advanced Organic Chemistry, 5ª ed., Wiley, 2001, p. 1252) con un aldehído o cetona de fórmula XI, en la que A , B_1 y R_1 son como se definieron para la fórmula I, en presencia de un ácido carboxílico XII en el que R_6 es hidrógeno o alquilo inferior, típicamente ácido acético, para dar una O-acil- α -hidroxiamida de fórmula XIII, en la que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I y R_6 es hidrógeno o alquilo inferior.

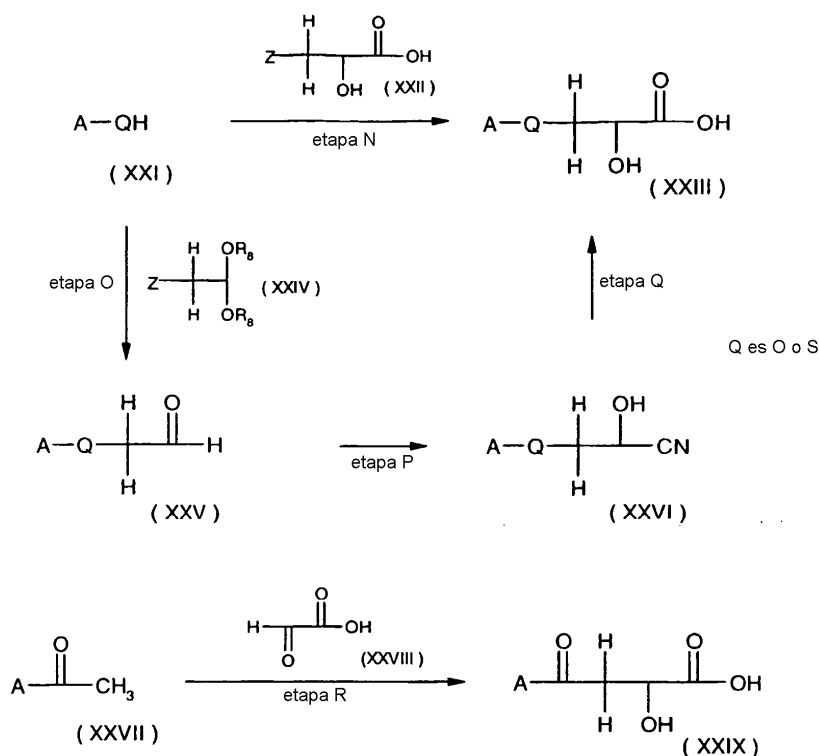
- 15 Etapa G: Alternativamente a la etapa F, un isocianuro de fórmula X, en la que B_2 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, se hace reaccionar con un aldehído o cetona de fórmula XI, en la que A , B_1 y R_1 son como se definieron para la fórmula I, en presencia de tetracloruro de titanio para dar una α -hidroxiamida de la fórmula XIV (en la que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_3 y R_4 tienen el mismo significado como se definió anteriormente) en condiciones conocidas de por sí (D. Seebach, G. Adam, T. Gees, M. Schiess, W. Weigang, Chem. Ber. 1988, 121, 507; O. Ort, U. Doller, W. Reissel, S. D. Lindell, T. L. Hough, D. J. Simpson, J. P. Chung, Pesticide Sci. 1997, 50, 331).

- 20 Etapa H: Alternativamente a la etapa E y la etapa F, un compuesto de fórmula IX, en la que B_2 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, se trata con un equivalente de fosgeno (por ejemplo trifosgeno) y una base (por ejemplo trietilamina) y, en una segunda etapa, sin aislamiento del intermedio de isocianuro, se trata adicionalmente con tetracloruro de titanio y un aldehído o cetona de fórmula XI, en la que A , B_1 y R_1 son como se definieron para la fórmula I, en condiciones conocidas de por sí (documento WO 96/17840), para dar una α -hidroxiamida de la fórmula XIV, en la que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I.

Etapa I: Una O-acil- α -hidroxiamida de fórmula XIII, en la que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_3 y R_4 son como se definieron anteriormente y R_6 es hidrógeno o alquilo inferior, se hidroliza hasta una α -hidroxiamida de fórmula XIV, en la que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, en condiciones clásicas (J. March, Advanced Organic Chemistry, 4a ed., Wiley, 1992).

- 30 Etapa K: Una α -hidroxiamida de fórmula XIV, en la que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I, se hace reaccionar con un compuesto XV en el que R_2 es alquilo, alqueno o alquínilo y Z es un grupo saliente como un haluro, tal como un cloruro o bromuro, o un éster sulfónico, tal como un tosilato, mesilato o triflato, hasta un compuesto de fórmula IB en el que A , B_1 , B_2 , R_1 , R_2 , R_3 y R_4 son como se definieron para la fórmula I y en las mismas condiciones como se definieron para la etapa B en el Esquema 1.

- 35 Esquema 3: Preparación de α -hidroxiácidos (ejemplos de fórmula II):



Etapa N: Un fenol o tiofenol de fórmula XXI, en la que A es como se define para la fórmula I y Q es oxígeno o azufre, se hace reaccionar con un derivado de ácido láctico de fórmula XXII, en la que Z es un grupo saliente como un haluro, tal como un cloruro o bromuro, o un éster sulfónico tal como un tosilato, mesilato o triflato, para dar un α -hidroxiácido de fórmula XXIII, en la que A es como se define para la fórmula I, en presencia de una base tal como hidróxido de litio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio o bicarbonato de potasio, en condiciones conocidas por sí (documento US 4.451.474).

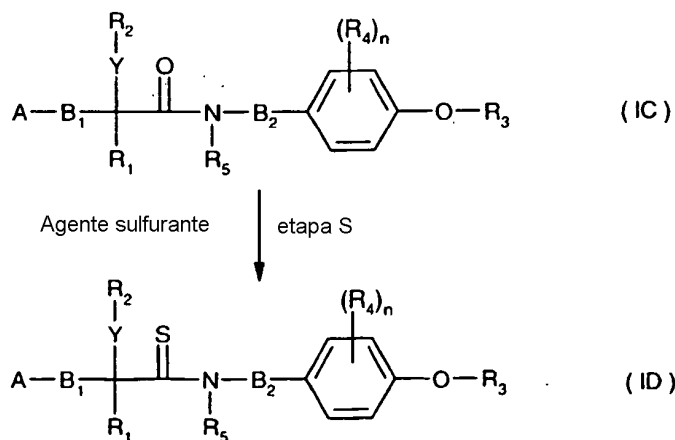
Etapa O: Como alternativa a la etapa N, un fenol o tiofenol de fórmula XXI, en la que A es como se define para la fórmula I y Q es oxígeno o azufre, se hace reaccionar con un derivado de acetaldehído de fórmula XXIV, en la que Z es un grupo saliente como un haluro, tal como un cloruro o bromuro, o un éster sulfónico tal como un tosilato, mesilato o triflato, y R_8 es hidrógeno o alquilo inferior, hasta un aldehído de fórmula XXV, en la que A es como se define para la fórmula I, en presencia de una base tal como hidruro de sodio, metóxido de sodio, etóxido de sodio, hidróxido de sodio o hidróxido de potasio, y escisión subsiguiente del acetal con la ayuda de un ácido como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico en condiciones conocidas por sí (J. Brussee, W.T. Loos, C.G. Kruse, A. Van der Gen, Tetrahedron, 1990, 46, 979).

Etapa P: Un aldehído de fórmula XXV, en la que A es como se define para la fórmula I, se transforma en una cianohidrina de fórmula XXVI, en la que A es como se define para la fórmula I, con un cianuro inorgánico como cianuro de sodio o cianuro de potasio, preferiblemente en presencia de una base tal como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de calcio o monofosfato de sodio.

Etapa Q: Una cianohidrina de fórmula XXVI, en la que A es como se define para la fórmula I, se hidroliza a un α -hidroxiácido de fórmula XXIII, en la que A es como se define para la fórmula I, en presencia de un ácido como ácido clorhídrico, ácido nítrico o ácido sulfúrico.

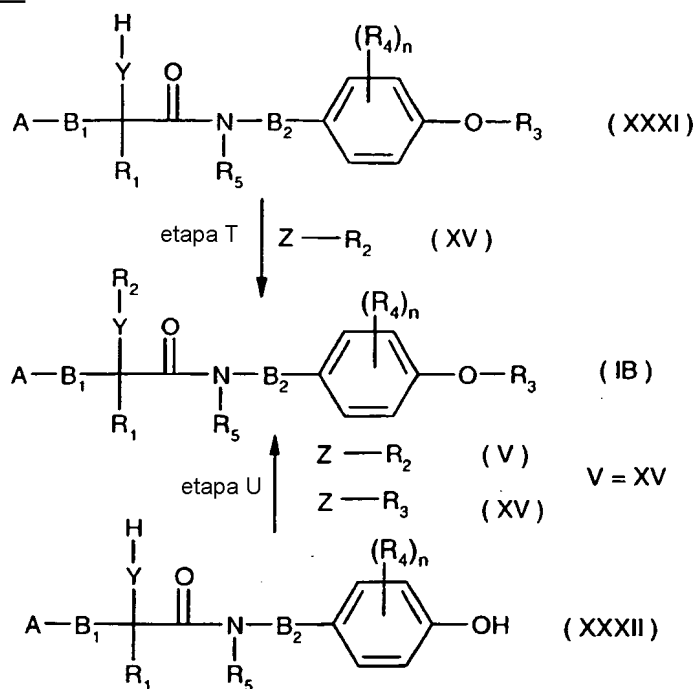
Etapa R: Una acetofenona de fórmula XXVII, en la que A es como se define para la fórmula I, se hace reaccionar con un derivado de ácido glioxílico de fórmula XXVIII, que puede ser ácido glioxílico propiamente o monohidrato de ácido glioxílico, hasta un α -hidroxi- α -cetoácido de fórmula XXIX, en condiciones conocidas por sí (M. Bianchi, A. Butti, Y. Christidis, J. Perronnet, F. Barzaghi, R. Cesana, A. Nencioni, Eur. J. Med. Chem., 1988, 23, 45.).

Esquema 4:



Etapa S: Una amida de fórmula VI, en la que A, B₁, B₂, R₁, R₂, R₃, R₄, y R₅ son como se definieron anteriormente, se transforma en una tioamida de fórmula XXX, en la que A, B₁, B₂, R₁, R₂, R₃, R₄, y R₅ son como se definieron para la fórmula I, con un agente sulfurante, como un compuesto de azufre fosforado, por ejemplo pentasulfuro de fósforo o 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson), en un agente diluyente inerte, como un disolvente orgánico inerte tal como hidrocarburos aromáticos, no aromáticos o halogenados, por ejemplo benceno, tolueno, xileno, clorobenceno o cloroformo, a temperaturas que oscilan de -80°C a +200°C, preferiblemente a temperaturas que oscilan de 0 a +100°C. Los compuestos resultantes son tioderivados de los compuestos reivindicados.

Esquema 5:



Etapa T: Una amida de fórmula IB, en la que A, B₁, B₂, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅ e Y son como se definieron para la fórmula I, puede obtenerse mediante la reacción de una amida de fórmula XXXI, en la que A, B₁, B₂, R₁, R₃, R₄, R₅ e Y son como se definieron para la fórmula I, con un compuesto de fórmula XV, en la que R₂ es como se definió para la fórmula I y en la que Z es un grupo saliente como un haluro, tal como cloruro o bromuro, o un éster sulfónico tal como un tosilato, mesilato o triflato, en las mismas condiciones como se definieron para la etapa B en el Esquema 1.

Etapa U: Una amida de fórmula XXXII, en la que A, B₁, B₂, R₁, R₄ e Y son como se definieron para la fórmula I, se hace reaccionar con un compuesto XV, en el que R₂ es como se definió para la fórmula I y Z es un grupo saliente como un haluro, tal como un cloruro o bromuro, o un éster sulfónico tal como un tosilato, mesilato o triflato, y que es igual a un compuesto V en el que R₃ es como se definió para la fórmula I y Z también es un grupo saliente como un

haluro, tal como un cloruro o bromuro, o un éster sulfónico tal como un tosilato, mesilato o triflato, hasta un compuesto de fórmula IB en el que A, B₁, B₂, R₁, R₂, R₃, R₄ e Y son como se definieron para la fórmula I y en las mismas condiciones como se definieron para la etapa B en el Esquema 1.

5 Los compuestos de fórmula I son aceites o sólidos a temperatura ambiente y se distinguen por las valiosas propiedades microbiocidas. Pueden usarse en el sector agrícola o en campos relacionados, preventiva y curativamente en el control de microorganismos destructores de plantas. Los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención se distinguen a tasas bajas de concentración no solo por la excelente actividad microbiocida, especialmente fungicida, sino también por ser especialmente bien tolerados por las plantas.

10 Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que los compuestos de fórmula I tienen para fines prácticos un espectro microbiocida muy ventajoso en el control de microorganismos fitopatógenos, especialmente hongos. Poseen propiedades curativas y preventivas muy ventajosas y se usan en la protección de numerosas plantas de cultivo. Con los compuestos de fórmula I, es posible inhibir o destruir microorganismos fitopatógenos que están presentes en diversos cultivos de plantas útiles o en partes de tales plantas (fruto, capullo, hojas, tallos, tubérculos, raíces), mientras que las partes de las plantas que crecen más tarde también quedan protegidas, por ejemplo, contra
15 hongos fitopatógenos.

Los compuestos de fórmula I resultan ser eficaces contra géneros específicos de la clase de hongos 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 las plantas una adición valiosa a las composiciones para controlar hongos
20 fitopatógenos. Los compuestos de fórmula I también pueden usarse como recubrimientos para proteger semillas (fruto, tubérculos, granos) y esquejes de planta frente a las infecciones fúngicas y frente a hongos fitopatógenos que están presentes en el suelo.

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

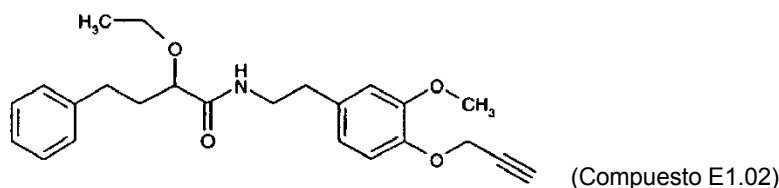
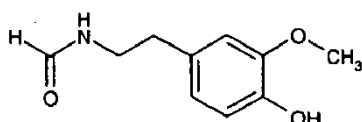
25 Además, la presente invención incluye la preparación de esas composiciones, en las que el ingrediente activo se mezcla homogéneamente con una o más de las sustancias o grupos de sustancias descritos aquí. También se incluye un método para tratar plantas que se distingue por la aplicación de los compuestos de fórmula I o de sus composiciones.

30 Cultivos diana a proteger dentro del alcance de la presente invención comprenden, por ejemplo, las siguientes especies de plantas: cereales (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolacha (remolacha azucarera y remolacha forrajera); pomos, frutas con hueso y bayas (manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas, fresas, frambuesas y moras); plantas leguminosas (judías, lentejas, guisantes, soja); plantas oleaginosas (colza, mostaza, amapola, aceitunas, girasoles, coco, plantas de aceite de ricino, semillas de cacao, cacahuetes); cucurbitáceas (calabacines, pepinos, melones); plantas fibrosas (algodón,
35 lino, cáñamo, yute); frutas cítricas (naranjas, limones, pomelos, mandarinas); verduras (espinaca, lechuga, espárrago, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas, pimentón); lauráceas (aguacate, canela, alcanfor) y plantas tales como tabaco, nueces, café, caña de azúcar, té, pimienta, viñas, lúpulos, bananas y plantas de caucho natural, y también ornamentales.

40 Los compuestos de fórmula I se usan normalmente en forma de composiciones, y se pueden aplicar al área o a la planta a ser tratada, simultáneamente o en sucesión con otros ingredientes activos. Esos otros ingredientes activos pueden ser fertilizantes, donantes de micronutrientes u otras preparaciones que influyen en el crecimiento de las plantas. También es posible usar herbicidas o insecticidas selectivos, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varias de esas preparaciones, si se desea junto con vehículos adicionales, tensioactivos u otros adyuvantes promotores de la aplicación empleados habitualmente en la tecnología de las formulaciones.

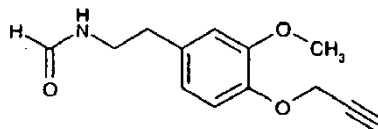
45 Los compuestos de fórmula I se pueden mezclar con otros fungicidas, dando como resultado en algunos casos actividades sinérgicas inesperadas. Tales mezclas no se limitan a dos ingredientes activos (uno de fórmula I y uno de la lista de otros fungicidas), sino que por el contrario pueden comprender más de un ingrediente activo del componente de fórmula I y más de un fungicida diferente. Componentes de mezclado que son particularmente adecuados para este fin incluyen, por ejemplo, azoles, tales como azaconazol, BAY 14120, bitertanol,
50 bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, pefurazoato, penconazol, pirifenox, procloraz, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triflumizol, triticonazol; pirimidinilcarbinoles, tales como ancimidol, fenarimol, nuarimol; 2-amino-pirimidinas, tales como bupirimato, dimetirimol, etirimol; morfolinas, tales como dodemorf, fenpropidina, fenpropimorf, espiroxamina, tridemorf; anilino-pirimidinas, tales como ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo; pirroles, tal como fencpiclonilo, fludioxonilo; fenilamidas, tal como benalaxilo, furalaxilo, metalaxilo, R-metalaxilo, ofurace, oxadixilo; bencimidazoles, tales como benomilo, carbendazim, debacarb, fuberidazol, tiabendazol; dicarboximidas, tales como clozolinato, diclozolina, iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina; carboxamidas, tales como carboxina, fenfuram, flutolanilo, mepronilo, oxicarboxina, tfluzamida; guanidinas, tales como guazatina, dodina e iminoctadina;

- estrobilurinas, tales como azoxistrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, SSF-129, trifloxistrobina, picoxistrobina, BAS 500F (nombre propuesto piraclostrobina), BAS 520; ditiocarbamatos, tales como ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram; N-halometiltiotetrahidroftalimidatos, tales como captafol, captano, diclofluanida, fluoromidas, folpet, tolfenfluanida; compuestos de cobre, tales como mezcla de Burdeos, hidróxido de cobre, oxiclórico de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, mancozeb, oxina-cobre; derivados de nitrofenol, tales como dinocap, nitrofenol-isopropilo; derivados de organo-P, tales como edifenfós, iprobenfós, isoprotiolano, fosdifenol, pirazofós, tolclofós-metilo; otros diferentes, tales como acibenzolar-S-metilo, anilazina, bentavalicarb, blasticidina-S, quinometionato, cloroneb, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclona, diclomezina, dicloran, dietofencarb, dimetomorf, SYP-LI90 (nombre propuesto: flumorf), ditianona, etaboxam, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenoxanilo, fentina, ferimzona, fluazinam, flusulfamida, fenhexamida, fosetil-aluminio, himexazol, iprovalicarb, IKF-916 (ciazofamid), kasugamicina, metasulfocarb, metrafenona, nicobifeno (nueva proposición: boscalid), penciclorón, fatlida, polioxinas, probenazol, propamocarb, piroquilon, quinoxifen, quintozeno, azufre, triazóxido, triciclorol, triforina, validamicina, zoxamida (RH7281).
- En las mezclas mencionadas anteriormente, la relación de mezcla de los ingredientes activos se selecciona de modo que alcance el control opcional del microorganismo fitopatógeno sobre las plantas huésped. Esta relación está en general entre 100:1 y 1:100, más preferiblemente entre 10:1 y 1:10 de un compuesto de fórmula I con respecto al segundo fungicida. Las mezclas pueden comprender no sólo uno de los ingredientes activos combinatorios listados, sino que pueden comprender más de uno de los ingredientes activos adicionales seleccionados de ese grupo especificado, formando así, por ejemplo, mezclas triples o incluso cuádruples.
- Los vehículos y tensioactivos adecuados pueden ser sólidos o líquidos, y corresponden a las sustancias empleadas habitualmente en la tecnología de las formulaciones, tales como, por ejemplo, sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, agentes de pegajosidad, espesantes, aglutinantes o fertilizantes. Tales vehículos y aditivos se describen, por ejemplo, en el documento WO 95/30651.
- Un método preferido para aplicar un compuesto de fórmula I, o una composición agroquímica que comprende al menos uno de esos compuestos, es la aplicación al follaje (aplicación foliar), dependiendo la frecuencia y la tasa de aplicación del riesgo de infestación por el patógeno en cuestión. Los compuestos de fórmula I también pueden aplicarse a granos de semilla (revestimiento) bien impregnando los granos con una formulación líquida del ingrediente activo o bien al revestirlos con una formulación sólida.
- Los compuestos de fórmula I se usan en forma no modificada o, preferiblemente, junto con los adyuvantes convencionalmente empleados en la tecnología de las formulaciones, y para ese fin se formulan ventajosamente de modo conocido, por ejemplo como concentrados emulsionables, pastas revestibles, disoluciones directamente pulverizables o diluibles, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos de espolvoreo, gránulos, y mediante encapsulamiento en, por ejemplo, sustancias polímeras. Al igual que con la naturaleza de las composiciones, los métodos de aplicación, tales como pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión, revestimiento o vertido, se eligen de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias que prevalecen.
- Las tasas ventajosas de aplicación son normalmente de 1 g a 2 kg de ingrediente activo (i. a.) por hectárea (ha), preferiblemente de 10 g a 1 kg de i. a./ha, especialmente de 25 g a 750 g de i. a./ha. Cuando se usan como recubrimientos de semillas, se usan ventajosamente tasas de 0,001 g a 1,0 g de ingrediente activo por kg de semillas.
- Las formulaciones, es decir, las composiciones, preparaciones o mezclas que comprenden el o los compuestos (ingrediente o ingredientes activos) de fórmula I y, cuando sea apropiado, un adyuvante sólido o líquido, se preparan de manera conocida, por ejemplo mezclando homogéneamente y/o triturando el ingrediente activo con extendedores, por ejemplo disolventes, vehículos sólidos y, cuando sea apropiado, compuestos de superficie (tensioactivos).
- La persona experta en la técnica conocerá tensioactivos adicionales usados habitualmente en la tecnología de las formulaciones, o se pueden encontrar en la bibliografía técnica relevante.
- Las composiciones agroquímicas comprenden habitualmente de 0,01 a 99% en peso, preferiblemente de 0,1 a 95% en peso, de un compuesto de fórmula I, 99,99 a 1% en peso, preferiblemente 99,9 a 5% en peso, de un adyuvante sólido o líquido, y 0 a 25% en peso, preferiblemente 0,1 a 25% en peso, de un tensioactivo.
- Mientras que los productos comerciales serán preferiblemente formulados como concentrados, el usuario final empleará normalmente formulaciones diluidas.
- Las composiciones también pueden comprender ingredientes adicionales, tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y agentes de pegajosidad, así como fertilizantes u otros ingredientes activos para obtener efectos especiales.
- Los siguientes Ejemplos ilustran la invención descrita anteriormente, sin limitar el alcance de la misma de ningún modo. Las temperaturas se dan en grados Celsius. Ph indica fenilo.

Ejemplos de preparación:**Ejemplo 1: 2-Etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida****a) N-[2-(4-Hidroxi-3-metoxi-fenil)-etil]-formamida**

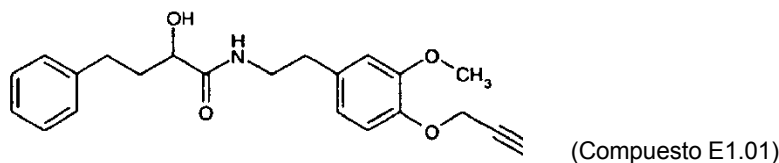
Se añadió ácido fórmico (230 g, 5,0 moles) gota a gota a anhídrido acético (383 g, 3,75 moles) a 0°C. Esta mezcla se agitó durante 2 horas a +55°C y subsiguientemente se enfrió de nuevo hasta 0°C. Se añadió tetrahidrofurano (500 ml) a esta temperatura, seguido de hidrocloreto de 4-(2-amino-etil)-2-metoxifenol (50 g, 0,25 moles). La suspensión blanca resultante se agitó durante 18 horas a +75°C, cambiando a una disolución amarilla. La mezcla de reacción se evaporó, y el residuo se sometió a cromatografía ultrarrápida para producir N-[2-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-etil]-formamida.

RMN ¹H (300 MHz, CDCl₃): 2,85 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,57 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,82 (s, 3H, OCH₃), 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 añadió metóxido de sodio (32 ml de una disolución 5,4 M en metanol, 0,17 moles) a una disolución de N-[2-(4-hidroxi-3-metoxi-fenil)-etil]-formamida (32 g, 0,16 moles) en metanol (400 ml). Se añadió bromuro de propargilo (20 g, 0,17 moles), y la mezcla se puso a reflujo durante 4 horas. Tras evaporar, el residuo se recogió en acetato de etilo (400 ml) y se lavó con agua (2 x 200 ml). La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó. El residuo se sometió a cromatografía ultrarrápida para dar la N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-formamida.

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 2,44 (t, 1H, C≡CH), 2,73 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,51 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,82 (s, 3H, OCH₃), 4,69 (m, 2H, OCH₂), 5,53 (s a, 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

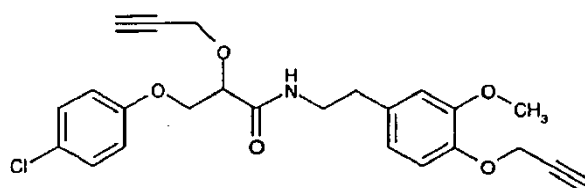
Se disolvieron N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-formamida (8,0 g, 34 mmoles) y trietilamina (8,3 g, 82 mmoles) en diclorometano (80 ml). Se añadió carbonato de bis(triclorometilo) (trifosgeno, 4,0 g, 14 mmoles) en diclorometano (40 ml) a +5°C. La mezcla se agitó durante 4 horas a +5°C y después se enfrió hasta -78°C. Se añadió una disolución de tetracloruro de titanio (7,0 g, 38 mmoles) en diclorometano (70 ml), y la mezcla se agitó durante 2 horas a -40°C. Se añadió gota a gota 3-fenilpropionaldehído (4,8 g, 36 mmoles) en diclorometano (50 ml), y la mezcla se agitó durante 17 horas a temperatura ambiente. La mezcla se hidrolizó con HCl 5N (25 ml), se agitó 30 minutos a temperatura ambiente y se lavó con agua. Tras evaporar la capa orgánica, el residuo se sometió a cromatografía ultrarrápida (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).

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 1,93 (c, 1 H, CH₂CH₂), 2,13 (m, 1H, CH₂CH₂), 2,51 (t, 1 H, C≡CH), 2,70 - 2,83 (m, 4H, CH₂CH₂), 3,55 (c, 2H, CH₂CH₂), 3,82 (s, 3H, OCH₃), 4,15 (c, 1H, CHOH), 4,73 (d, 2H, OCH₂), 6,53 (s a, 1 H, NH), 6,73 - 7,31 (m, 8H, CH arom.).

d) Se añadió yoduro de etilo (1,5 g, 10 mmoles) lentamente a temperatura ambiente a una mezcla de 2-hidroxi-*N*-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida (3,0 g, 8,2 mmoles), disolución de hidróxido de sodio al 30% (7,0 ml, 41 mmoles) y cantidades catalíticas de bromuro de tetrabutilamonio (50 mg) en 30 ml de diclorometano. La reacción se agitó durante 16 horas a +40°C. Subsiguientemente, la mezcla se evaporó, y el residuo se diluyó con agua y diclorometano. Las fases se separaron, y la fase acuosa se extrajo tres veces con diclorometano. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó. El aceite restante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:1) para producir 2-etoxi-*N*-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida (Compuesto E1.02).

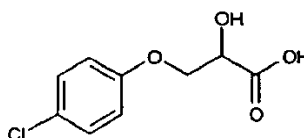
¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 1,19 (t, 3H, CH₃), 1,88 - 2,12 (m, 2H, CH₂CH₂), 2,51 (t, 1H, C≡CH), 2,70 (c, 2H, CH₂CH₂), 2,82 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,43 (dq, 2H, CH₂CH₂), 3,55 (c, 2H, CH₂CH₃), 3,71 (c, 1H, CHO), 3,88 (s, 3H, OCH₃), 4,73 (d, 2H, OCH₂), 6,67 (s a, 1H, NH), 6,72 - 7,31 (m, 8H, CH arom.).

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



(Compuesto E1.26)

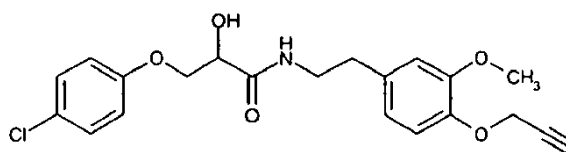
a) Ácido 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-propiónico



Una mezcla de ácido 3-cloroláctico (5,0 g, 40 mmoles) y 4-clorofenol (9,3 g, 72 mmoles) en 40 ml de hidróxido de sodio 3,3 N se agitó a reflujo durante 2 horas. Subsiguientemente, la mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se acidificó hasta pH 3 con ácido clorhídrico concentrado. Los cristales blancos resultantes se filtraron y se disolvieron en agua caliente. Esta disolución caliente se ajustó hasta pH 1 con ácido sulfúrico concentrado. Después de enfriar, se recogió ácido 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-propiónico como cristales transparentes.

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 3,93 (d, 2H, OCH₂), 4,14 (t, 1H, 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-inilo-fenil)-etil]-propionamida



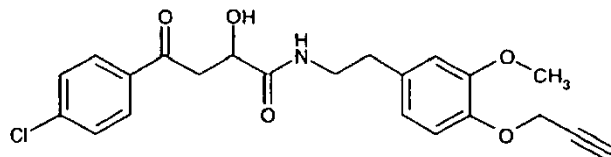
(Compuesto E1.24)

Se disolvieron hidrocloreto de 2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etilamina (5,0 g, 20 mmoles) y *N,N*-diisopropiletilamina (10 g, 78 mmoles) en 70 ml de *N,N*-dimetilformamida. A esta disolución se añadieron ácido 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-propiónico (4,3 g, 20 mmoles) y hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-ilo)-tris-(dimetilamino)-fosfonio (9,5 g, 22 mmoles) sucesivamente. La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente, subsiguientemente se vertió sobre hielo-agua y se extrajo varias veces con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó a vacío. El aceite restante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 6:4) para dar 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-*N*-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-propionamida (Compuesto E1.24). ¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 2,52 (t, 1H, C≡CH), 2,82 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,60 (c, 2H, CH₂CH₂), 3,87 (s, 3H, OCH₃), 4,12 (m, 2H, OCH₂), 4,23 (c, 1H, CHOH), 4,76 (d, 2H, OCH₂), 6,73 - 7,29 (m, 8H, NH, CH arom.).

c) Se añadió lentamente una disolución al 80% de bromuro de propargilo en tolueno (1,6 g, 11 mmoles) a temperatura ambiente a una mezcla de 3-(4-cloro-fenoxi)-2-hidroxi-*N*-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-propionamida (3,5 g, 8,7 mmoles), disolución de hidróxido de sodio al 30% (4,5 ml, 44 mmoles) y cantidades catalíticas de bromuro de tetrabutilamonio (50 mg) en 30 ml de diclorometano. La reacción se agitó durante 16 horas a +40°C. Subsiguientemente, la mezcla se evaporó, y el residuo se diluyó con agua y diclorometano. Las fases se separaron, y la fase acuosa se extrajo tres veces con diclorometano. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó. El aceite restante se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 1:1) para producir 3-(4-cloro-fenoxi)-*N*-[2-(3-metoxi-4-prop-2-inilo-fenil)-etil]-2-prop-2-inilo-propionamida (Compuesto E1.24).

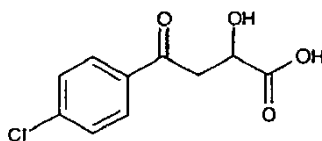
¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 2,38 (t, 1H, C≡CH), 2,43 (t, 1H, C≡CH), 2,73 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,50 (c, 2H, CH₂CH₂), 3,81 (s, 3H, OCH₃), 4,11 (c, 1H, CHO), 4,22 - 4,32 (m, 4H, OCH₂), 4,68 (d, 2H, OCH₂), 6,52 (s a, 1H, NH), 6,67 - 7,20 (m, 8H, NH, CH arom.).

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) Ácido 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-4-oxo-butírico



Una mezcla de ácido glioxílico monohidratado (4,6 g, 50 mmoles) y 4-cloroacetofenona (15,4 g, 0,1 moles) se calentó a +95°C a presión reducida (50 mbares) durante 3 horas. Durante este tiempo, el agua se eliminó de forma continua. Después de enfriar, la mezcla de reacción se recogió en disolución acuosa de carbonato de sodio y se extrajo con éter dietílico. La capa acuosa se acidificó con ácido clorhídrico al 15% y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó, el residuo se cristalizó en acetato de etilo/hexano para obtener ácido 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-4-oxo-butírico. ¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 3,41 (dd, 1H, CH₂), 3,53 (dd, 1H, CH₂), 4,65 (c, 1H, CHOH), 7,38 - 7,92 (m, 4H, CH arom.).

b) Se disolvieron hidrocloreto de 2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etilamina (5,4 g, 22 mmoles) y N,N-diisopropiletilamina (11 g, 83 mmoles) en 70 ml de N,N-dimetilformamida. A esta disolución se añadieron sucesivamente ácido 4-(4-cloro-fenil)-2-hidroxi-4-oxo-butírico (4,8 g, 21 mmoles) y hexafluorofosfato de (benzotriazol-1-iloxi)-tris-(dimetilamino)-fosfonio (10 g, 23 mmoles). La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente, subsiguientemente se vertió sobre hielo-agua y se extrajo varias veces con acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó sobre sulfato de sodio y se evaporó a vacío. El aceite restante se purificó mediante 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).

¹H-RMN (300 MHz, CDCl₃): 2,51 (t, 1H, C≡CH), 2,82 (t, 2H, CH₂CH₂), 3,27 (dd, 1H, CH₂), 3,53 - 3,66 (m, 3H, CH₂,CH₂CH₂), 3,90 (s, 3H, OCH₃), 4,62 (c, 1H, CHOH), 4,74 (d, 2H, OCH₂), 6,72 - 7,92 (m, 8H, NH, CH arom.).

Los compuestos listados en la tabla E1 se obtienen según los procedimientos de los Ejemplos E1, E2 y E3.

Tabla E1: (Ph designa fenilo)

No.	A	B ₁	R ₂	¹ H-RMN
E1.01	Ph	-CH ₂ CH ₂ -	H	1,93 (c, 1H), 2,13 (m, 1H), 2,51 (t, 1H), 2,70 - 2,83 (m, 4H), 3,55 (c, 2H), 3,82 (s, 3H), 4,09 (c, 1H), 4,73 (d, 2H), 6,73 - 7,31 (m, 8H).
E1.02	Ph	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,19 (t, 3H), 1,88 - 2,12 (m, 2H), 2,51 (t, 1H), 2,70 (c, 2H), 2,82 (t, 2H), 3,43 (dq, 2H), 3,55 (c, 2H), 3,71 (c, 1H), 3,88 (s, 3H), 4,73 (d, 2H), 6,72 - 7,31 (m, 8H).
E1.03	Ph	-CH ₂ CH ₂ -	CH ₂ C≡CH-	2,06 (c, 1H), 2,20 (m, 1H), 2,54 (t, 1H), 2,59 (t, 1H), 2,78 (c, 2H), 2,89 (t, 2H), 3,62 (c, 2H), 3,92 (s, 3H), 4,05 (c, 1H), 4,19 (d, 2H), 4,81 (d, 2H), 6,82 - 7,39 (m, 8H).
E1.04	4-CH ₃ -Ph	-CH ₂ CH ₂ -	H	1,82 (c, 1H), 2,05 (m, 1H), 2,24 (s, 3H), 2,42 (t, 1H), 2,59 - 2,73 (m, 4H), 3,46 (c, 2H), 3,75 (s, 3H), 4,00 (c, 1H), 4,66 (d, 2H), 6,62 - 7,20 (m, 7H).

ES 2 536 973 T3

E1.05	4-CH ₃ -Ph	-CH ₂ CH ₂ -	CH ₂ CH ₃ -	1,06 (t, 3H), 1,77-1,98 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,41 (t, 1H), 2,56 (c, 2H), 2,73 (t, 2H), 3,35 (c, 2H), 3,48 (c, 2H), 3,61 (c, 1H), 3,78 (s, 3H), 4,62 (d, 2H), 6,63 - 7,20 (m, 7H).
E1.06	4-CH ₃ -Ph	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,83 - 2,03 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,38 (t, 1H), 2,42 (t, 1H), 2,56 (c, 2H), 2,72 (t, 2H), 3,47 (c, 2H), 3,79 (s, 3H), 3,86 (c, 1H), 4,02 (d, 2H), 4,63 (d, 2H), 6,64 - 7,20 (m, 7H).
E1.07 *	Ph	-CH(CH ₃)CH ₂ -	H	1,32 (d, 3H), 1,84 (m, 1H), 2,17 (m, 1H), 2,51 (t, 1H), 2,76 (c, 2H), 3,00 (c, 1H), 3,49 (c, 2H), 3,84 (s, 3H), 4,09 (m, 1H), 4,74 (d, 2H), 6,72 - 7,34 (m, 8H).
E1.08 *	Ph	-CH(CH ₃)CH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,09 (t, 3H), 1,29 (d, 3H), 1,83 (m, 1H), 2,07 (m, 1H), 2,51 (t, 1H), 2,82 (c, 2H), 2,98 (c, 1H), 3,28 - 3,59 (m, 4H), 3,86 (s, 3H), 4,13 (c, 1H), 4,74 (d, 2H), 6,60 - 7,32 (m, 8H).
E1.09 *	Ph	-CH(CH ₃)CH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,33 (d, 2H), 1,93 (m, 1H), 2,19 (m, 1H), 2,44 (t, 1H), 2,53 (t, 1H), 2,83 (c, 2H), 3,07 (c, 1H), 3,56 (c, 2H), 3,92 (s, 3H), 4,00 (dd, 1H), 4,09 (dd, 1H), 4,20 (c, 1H), 4,81 (d, 2H), 6,74 - 7,40 (m, 8H).
E1.10 *	4-Cl-Ph	-C(=O)CH ₂ -	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 (c, 1H), 4,74 (d, 2H), 6,72 - 7,92 (m, 7H).
E1.11 *	4-CH ₃ -Ph	-C(=O)CH ₂ -	H	2,52 (s, 3H), 2,61 (t, 1H), 2,92 (t, 2H), 3,38 (dd, 1H), 3,62 - 3,73 (m, 3H), 4,00 (s, 3H), 4,70 (c, 1H), 4,84 (d, 2H), 6,84 - 7,97 (m, 7H).
E1.12	Ph	-OCH ₂ -	H	2,72 (t, 1H), 3,03 (t, 2H), 3,79 (c, 2H), 4,06 (s, 3H), 4,32 (c, 2H), 4,45 (c, 1H), 4,94 (d, 2H), 6,92 - 7,56 (m, 8H).
E1.13	Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,43 (t, 1H), 2,50 (t, 1H), 2,79 (t, 2H), 3,53 (c, 2H), 3,84 (s, 3H), 4,19 (c, 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 ₂ -	H	2,39 (t, 1H), 2,69 (t, 2H), 3,45 (c, 2H), 3,73 (s, 3H), 3,98 (c, 2H), 4,06 (c, 1H), 4,61 (d, 2H), 6,58 - 6,89 (m, 7H).
E1.16	4-F-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,48 (t, 1H), 2,53 (t, 1H), 2,82 (t, 2H), 3,58 (c, 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 ₂ -	H	2,42 (t, 1H), 2,73 (t, 2H), 3,52 (c, 2H), 3,76 (s, 3H), 4,05 (dq, 2H), 4,18 (c, 1H), 4,64 (d, 2H), 6,61 - 7,30 (m, 7H).
E1.19	2-Cl-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,12 (t, 3H), 2,42 (t, 1H), 2,74 (t, 2H), 3,43 - 3,54 (m, 4H), 3,75 (c, 1H), 3,81 (s, 3H), 4,07 (c, 2H), 4,68 (d, 2H), 6,67 - 7,28 (m, 7H).
E1.20	2-Cl-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,37 (t, 1H), 2,42 (t, 1H), 2,73 (t, 2H), 3,47 (c, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,06 (c, 1H), 4,33 - 4,47 (m, 4H), 4,66 (d, 2H), 6,64 - 7,28 (m, 7H).
E1.21	3-Cl-Ph	-OCH ₂ -	H	2,42 (t, 1H), 2,73 (t, 2H), 3,50 (c, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,05 (c, 2H), 4,17 (c, 1H), 4,68 (d, 2H), 6,63 - 7,18 (m, 7H).
E1.22	3-Cl-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,40 (t, 1H), 2,44 (t, 1H), 2,73 (t, 2H), 3,48 (c, 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 ₂ -	H	2,52 (t, 1H), 2,82 (t, 2H), 3,60 (c, 2H), 3,87 (s, 3H), 4,12 (m, 2H), 4,23 (c, 1H), 4,76 (d, 2H), 6,73 - 7,29 (m, 7H).
E1.25	4-Cl-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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).

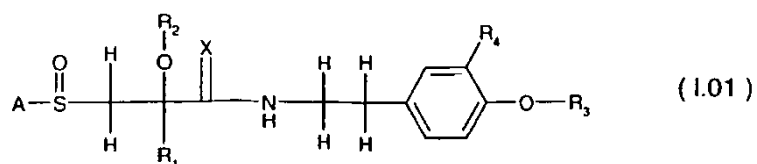
ES 2 536 973 T3

E1.26	4-Cl-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,38 (t, 1H), 2,43 (t, 1H), 2,73 (t, 2H), 3,50 (c, 2H), 3,81 (s, 3H), 4,11 (c, 1H), 4,22 - 4,32 (m, 4H), 4,68 (d, 2H), 6,67 - 7,20 (m, 7H).
E1.27	4-Br-Ph	-OCH ₂ -	H	2,52 (t, 1H), 2,81 (t, 2H), 3,59 (c, 2H), 3,87 (s, 3H), 4,08 - 4,23 (m, 3H), 4,76 (d, 2H), 6,72 - 7,42 (m, 7H).
E1.28	4-Br-Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,72 (t, 1H), 2,77 (t, 1H), 3,05 (t, 2H), 3,81 (c, 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 ₃ -Ph	-OCH ₂ -	H	2,48 (s, 3H), 2,67 (t, 1H), 2,97 (t, 2H), 3,74 (c, 2H), 4,05 (s, 3H), 4,30 (m, 2H), 4,58 (c, 1H), 4,91 (d, 2H), 6,88 - 7,45 (m, 7H).
E1.31	4-CH ₃ -Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 (c, 1H), 4,76 (d, 2H), 6,73 - 7,30 (m, 7H).
E1.32	4-CH ₃ -Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,32 (s, 3H), 2,48 (t, 1H), 2,52 (t, 1H), 2,83 (t, 2H), 3,58 (c, 2H), 3,91 (s, 3H), 4,19 (c, 1H), 4,35 - 4,44 (m, 4H), 4,76 (d, 2H), 6,80 - 7,29 (m, 7H).
E1.33	4-Cl-Ph	-SCH ₂ -	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 (c, 1H), 4,76 (d, 2H), 6,72 - 7,37 (m, 7H).
E1.34	4-Cl-Ph	-SCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 (c, 1H), 4,66 (d, 2H), 6,62 - 7,23 (m, 7H).
E1.35	4-Cl-Ph	-SCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	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 ₂ OCH ₂ -	H	2,53 (t, 1H), 2,82 (t, 2H), 3,57 (c, 2H), 3,78 (d, 2H), 3,90 (s, 3H), 4,22 (c, 1H), 4,59 (s, 2H), 4,79 (d, 2H), 6,73 - 7,41 (m, 8H).
E1.37 *	Ph	-CH ₂ OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 ₂ OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,36 (t, 1H), 2,42 (t, 1H), 2,71 (t, 2H), 3,45 (c, 2H), 3,68 (d, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,12 (c, 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 ₂ CH ₂ -	H	1,91 (m, 1H), 2,09 (m, 1H), 2,53 (t, 1H), 2,79 (t, 2H), 3,02 (m, 2H), 3,56 (c, 2H), 3,88 (s, 3H), 4,26 (c, 1H), 4,75 (d, 2H), 6,71 - 7,37 (m, 7H).
E1.40 *	4-F-Ph	-SCH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,90 - 2,09 (m, 2H), 2,47 (t, 1H), 2,52 (t, 1H), 2,81 (t, 2H), 2,93 (m, 2H), 3,56 (c, 2H), 3,89 (s, 3H), 4,05 - 4,16 (m, 3H), 4,73 (d, 2H), 6,72 - 7,38 (m, 7H).
E1.41	4-F-Ph	-CH ₂ CH ₂ -	H	1,76 (c, 1H), 1,94 (m, 1H), 2,37 (t, 1H), 2,53 - 2,68 (m, 4H), 3,49 (c, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,95 (c, 1H), 4,59 (d, 2H), 6,57 - 7,02 (m, 7H).
E1.42	4-F-Ph	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,01 (t, 3H), 1,74 (c, 1H), 1,85 (m, 1H), 2,34 (t, 1H), 2,49 (t, 2H), 2,66 (t, 2H), 3,28 (dq, 2H), 3,39 (c, 2H), 3,52 (c, 1H), 3,72 (s, 3H), 4,58 (d, 2H), 6,58 - 7,00 (m, 7H).
E1.43	4-F-Ph	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,80 - 2,01 (m, 2H), 2,38 (t, 1H), 2,43 (t, 1H), 2,58 (t, 2H), 2,72 (t, 2H), 3,48 (c, 2H), 3,79 (s, 3H), 3,87 (c, 1H), 4,01 (d, 2H), 4,65 (d, 2H), 6,64 - 7,08 (m, 7H).
E1.44	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	-CH ₂ CH ₂ -	H	1,09 (t, 3H), 1,78 (c, 1H), 1,98 (m, 1H), 2,35 (t, 1H), 2,47 (c, 2H), 2,58 (t, 2H), 2,64 (t, 2H), 3,41 (c, 2H), 3,70 (s, 3H), 3,98 (c, 1H), 4,59 (d, 2H), 6,57 - 7,00 (m, 7H).
E1.45	4-CH ₃ CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,16 (t, 3H), 1,25 (t, 3H), 1,92 (c, 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 (c,

	Ph			2H), 3,71 (c, 1H), 3,88 (s, 3H), 4,74 (d, 2H), 6,72 - 7,13 (m, 7H).
E1.46	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,23 (t, 3H), 1,97 (c, 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 (c, 2H), 3,87 (s, 3H), 3,96 (c, 1H), 4,12 (d, 2H), 4,73 (d, 2H), 6,73 - 7,15 (m, 7H).
E1.47	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	-OCH ₂ -	H	1,15 (t, 3H), 2,42 (t, 1H), 2,52 (t, 2H), 2,72 (t, 2H), 3,51 (c, 2H), 3,79 (s, 3H), 4,02 - 4,13 (m, 2H), 4,33 (c, 1H), 4,66 (d, 2H), 6,64 - 7,07 (m, 7H).
E1.48	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,32 - 1,41 (m, 6H), 2,67 (t, 1H), 2,74 (c, 2H), 2,97 (t, 2H), 3,68 - 3,77 (m, 4H), 4,03 (s, 3H), 4,27 (c, 2H), 4,49 (c, 1H), 4,92 (d, 2H), 6,91 - 7,29 (m, 7H).
E1.49	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,22 (t, 3H), 2,48 (t, 1H), 2,53 (t, 1H), 2,60 (c, 2H), 2,83 (t, 2H), 3,55 (c, 2H), 3,88 (s, 3H), 4,17 (c, 1H), 4,31 - 4,43 (m, 4H), 4,76 (d, 2H), 6,75 - 7,11 (m, 7H).
E1.50	3,4-Cl ₂ -Ph	-OCH ₂ -	H	2,52 (t, 1H), 2,83 (t, 2H), 3,60 (c, 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 ₂ -Ph	-OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,50 (t, 1H), 2,53 (t, 1H), 2,82 (t, 2H), 3,58 (c, 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 ₃ -Ph	-SCH ₂ -	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 (c, 1H), 4,68 (d, 2H), 6,62 - 7,24 (m, 7H).
E1.53	4-CH ₃ -Ph	-SCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	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 (c, 1H), 4,76 (d, 2H), 6,72 - 7,32 (m, 7H).
E1.54	4-CH ₃ -Ph	-SCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	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	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	H	1,22 (c, 2H), 1,33 - 1,47 (m, 4H), 2,26 (t, 1H), 2,38 (t, 2H), 2,52 (t, 2H), 3,29 (c, 2H), 3,62 (s, 3H), 3,83 (c, 1H), 4,50 (d, 2H), 6,47 - 7,06 (m, 8H).
E1.56 *	Ph	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	0,99 (t, 3H), 1,28 (c, 2H), 1,41 - 1,52 (m, 4H), 2,34 (t, 1H), 2,48 (t, 2H), 2,63 (t, 2H), 3,28 (c, 2H), 3,40 (c, 2H), 3,53 (c, 1H), 3,72 (s, 3H), 4,62 (d, 2H), 6,58 - 7,16 (m, 8H).
E1.57 *	Ph	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	1,36 (c, 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 (c, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,87 (c, 1H), 4,02 (d, 2H), 4,69 (d, 2H), 6,65 - 7,23 (m, 8H).
E1.58 *	4-Cl-Ph	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	H	2,50 (t, 1H), 2,72 (t, 2H), 2,80 (t, 2H), 3,43 (c, 2H), 3,58 - 3,69 (m, 4H), 3,88 (s, 3H), 4,09 (c, 1H), 4,73 (d, 2H), 6,69 - 7,27 (m, 7H).
E1.59 *	4-Cl-Ph	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	-CH ₂ CH ₃	1,05 (t, 3H), 2,42 (t, 1H), 2,65 - 2,78 (m, 4H), 3,31 - 3,60 (m, 8H), 3,77 (c, 1H), 3,80 (s, 3H), 4,66 (d, 2H), 6,62 - 7,19 (m, 7H).
E1.60 *	4-Cl-Ph	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ -	-CH ₂ C≡CH	2,39 (t, 1H), 2,44 (t, 1H), 2,72 (t, 2H), 2,78 (t, 2H), 3,43 (c, 2H), 3,59 (c, 2H), 3,82 (s, 3H), 4,07 (c, 1H), 4,13 (d, 2H), 4,69 (d, 2H), 6,66 - 7,20 (m, 7H).
* indica no según la invención				

Análogamente a los ejemplos anteriores, se obtienen los compuestos de las tablas 1 a 64.

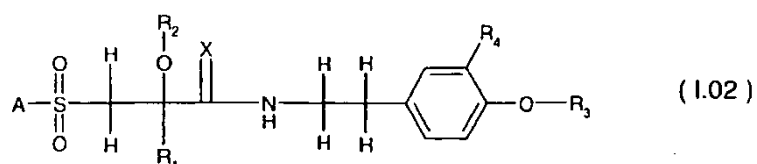
* Tabla 1: Compuestos representados por la Fórmula I.01



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

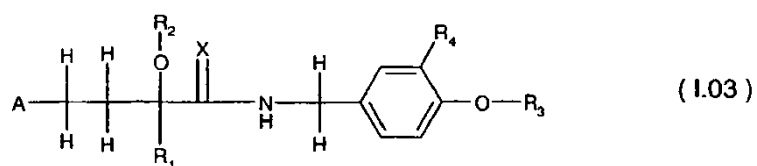
* Tabla 2: Compuestos representados por la Fórmula I.02



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

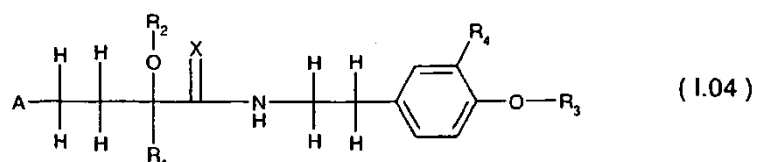
* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

Tabla 3: Compuestos representados por la Fórmula I.03



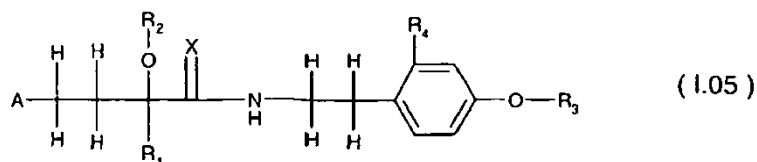
en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

Tabla 4: Compuestos representados por la Fórmula 1.04



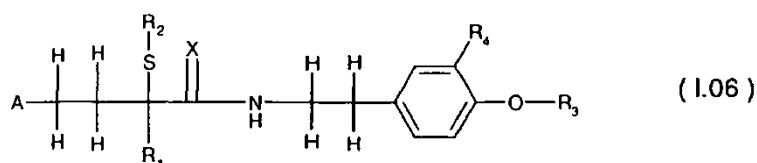
en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

Tabla 5: Compuestos representados por la Fórmula 1.05



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

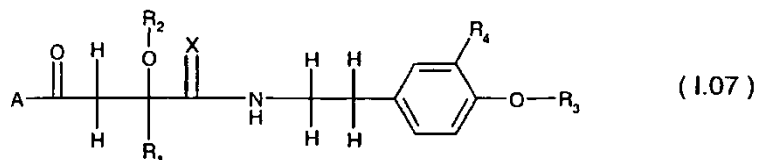
5 * Tabla 6: Compuestos representados por la Fórmula I.06



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

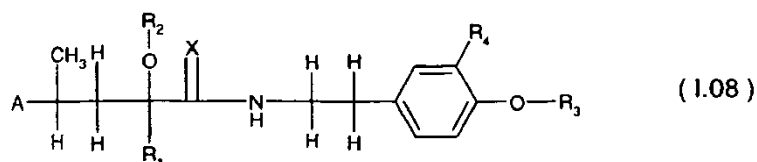
* Tabla 7: Compuestos representados por la Fórmula 1.07



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

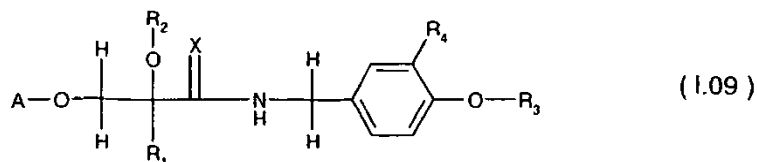
* Tabla 8: Compuestos representados por la Fórmula 1.08



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

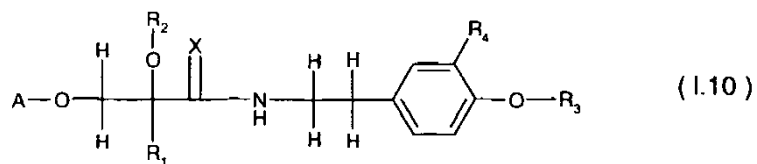
* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

Tabla 9: Compuestos representados por la Fórmula 1.09



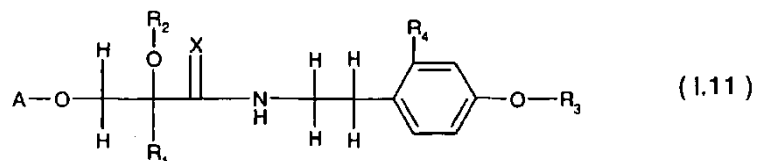
en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

Tabla 10: Compuestos representados por la Fórmula 1.10



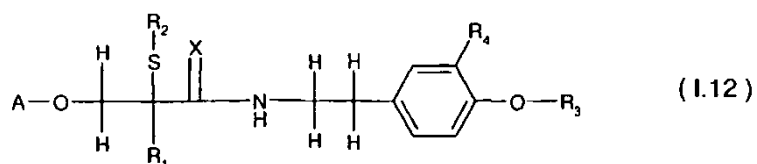
en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

5 Tabla 11: Compuestos representados por la Fórmula 1.11



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

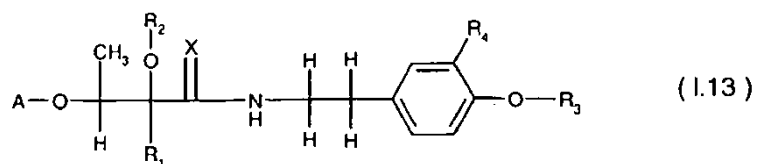
* Tabla 12: Compuestos representados por la Fórmula 1.12



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

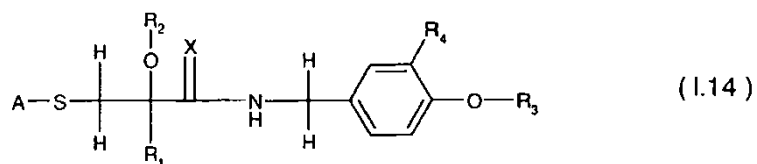
* Tabla 13: Compuestos representados por la Fórmula I.13



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

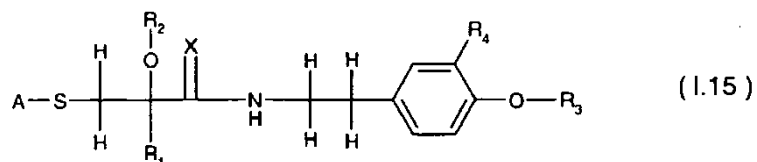
* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

Tabla 14: Compuestos representados por la Fórmula I.14



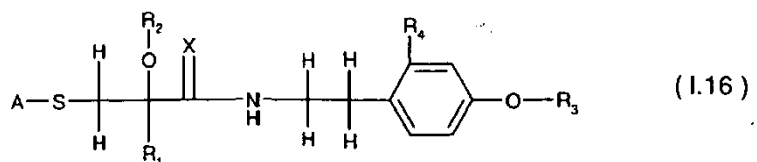
en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

Tabla 15: Compuestos representados por la Fórmula I.15



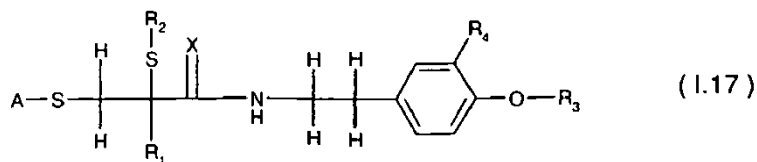
en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

Tabla 16: Compuestos representados por la Fórmula 1.16



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

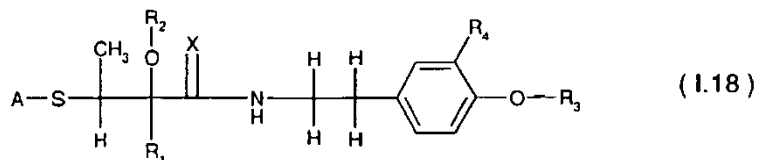
5 * Tabla 17: Compuestos representados por la Fórmula I.17



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

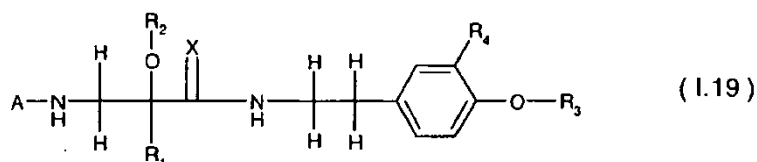
* Tabla 18: Compuestos representados por la Fórmula 1.18



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

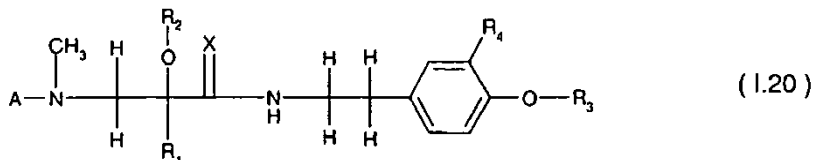
* Tabla 19: Compuestos representados por la Fórmula 1.19



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

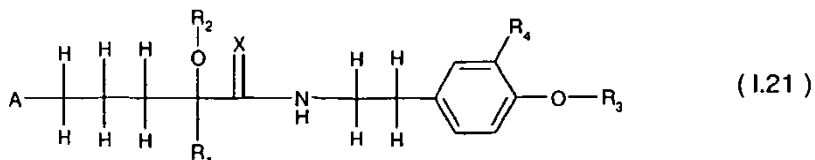
* Tabla 20: Compuestos representados por la Fórmula 1.20



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

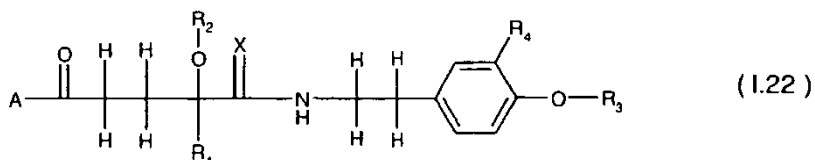
* Tabla 21: Compuestos representados por la Fórmula 1.21



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

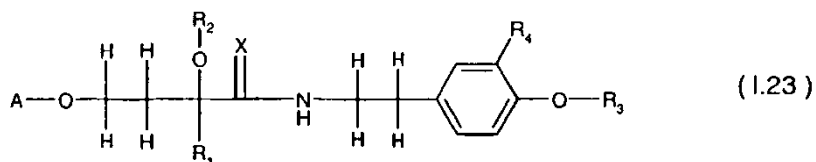
5 * Tabla 22: Compuestos representados por la Fórmula 1.22



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

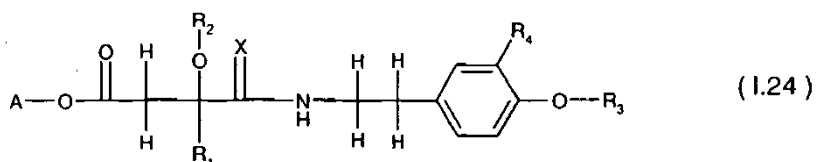
* Tabla 23: Compuestos representados por la Fórmula 1.23



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

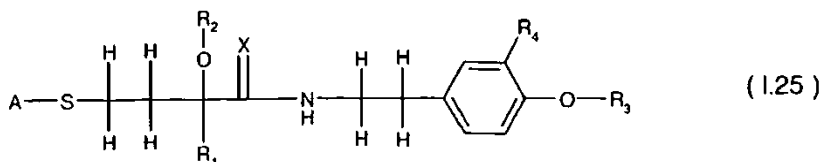
* Tabla 24: Compuestos representados por la Fórmula 1.24



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

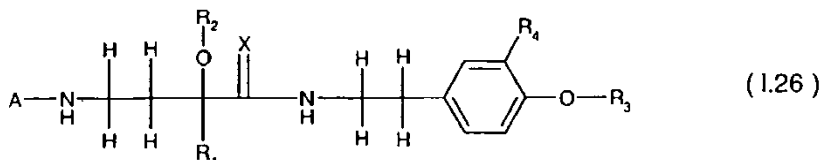
* Tabla 25: Compuestos representados por la Fórmula 1.25



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

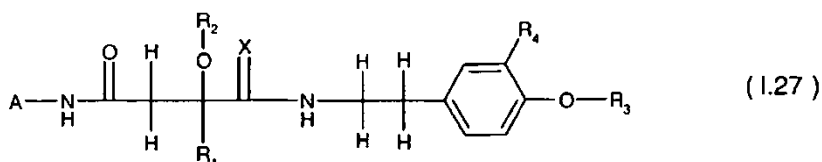
* Tabla 26: Compuestos representados por la Fórmula 1.26



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

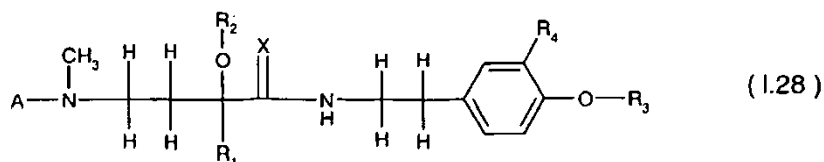
5 * Tabla 27: Compuestos representados por la Fórmula 1.27



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

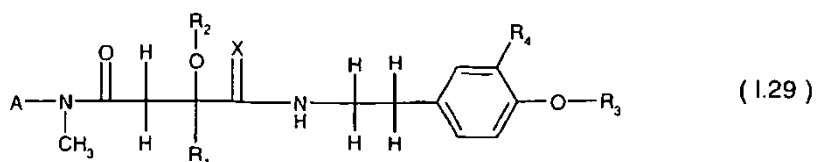
* Tabla 28: Compuestos representados por la Fórmula 1.28



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

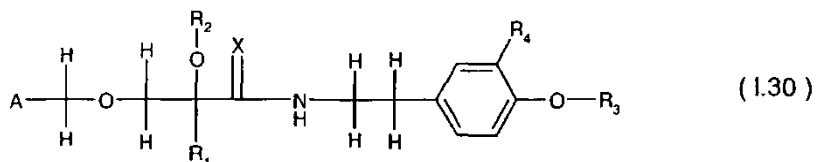
* Tabla 29: Compuestos representados por la Fórmula 1.29



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

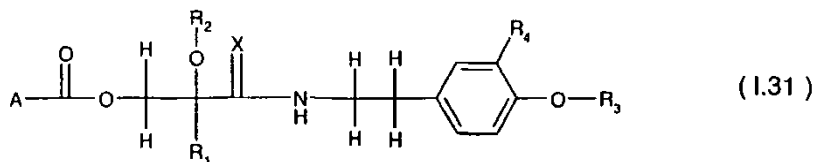
* Tabla 30: Compuestos representados por la Fórmula 1.30



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

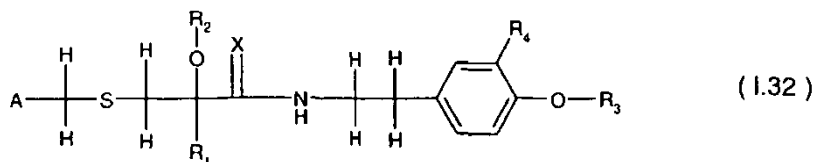
* Tabla 31: Compuestos representados por la Fórmula 1.31



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

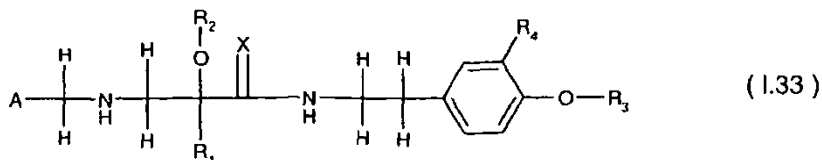
5 * Tabla 32: Compuestos representados por la Fórmula 1.32



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

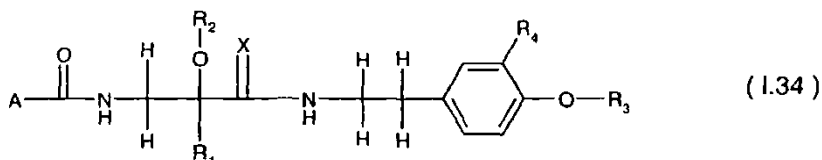
* Tabla 33: Compuestos representados por la Fórmula 1.33



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

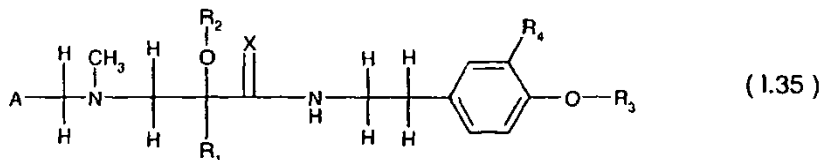
* Tabla 34: Compuestos representados por la Fórmula 1.34



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

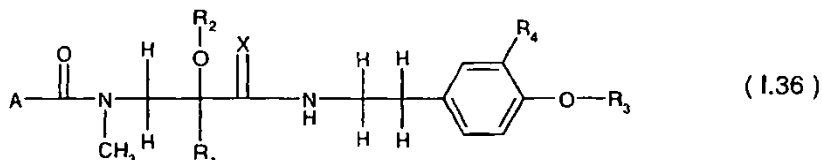
* Tabla 35: Compuestos representados por la Fórmula 1.35



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

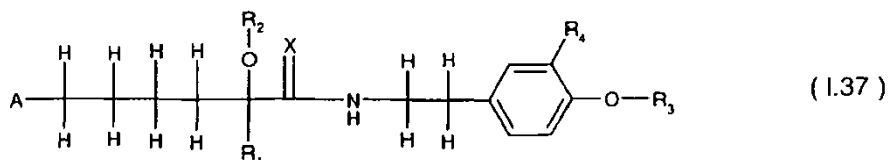
* Tabla 36: Compuestos representados por la Fórmula 1.36



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

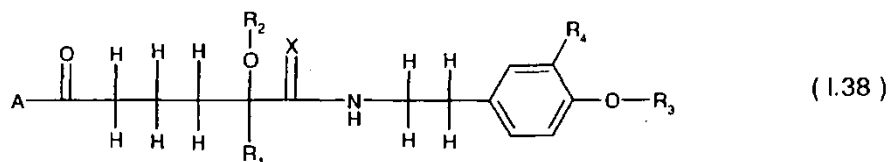
5 * Tabla 37: Compuestos representados por la Fórmula 1.37



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

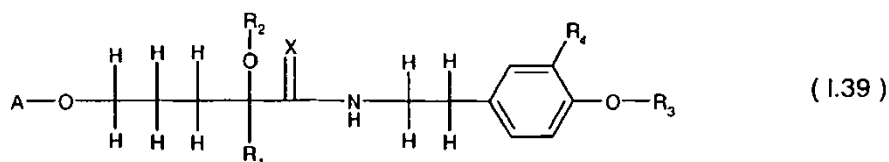
* Tabla 38: Compuestos representados por la Fórmula 1.38



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

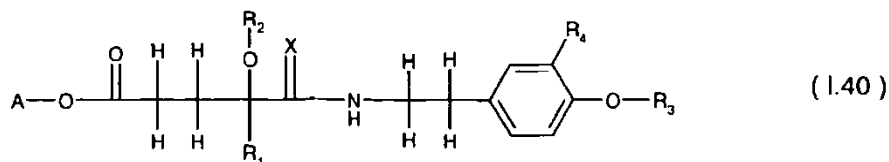
* Tabla 39: Compuestos representados por la Fórmula 1.39



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

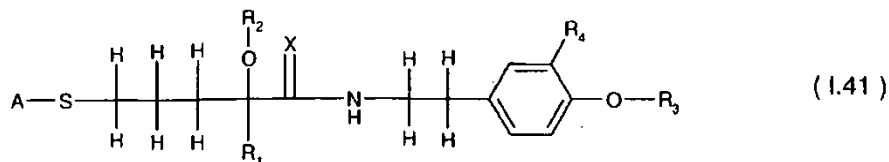
* Tabla 40: Compuestos representados por la Fórmula 1.40



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

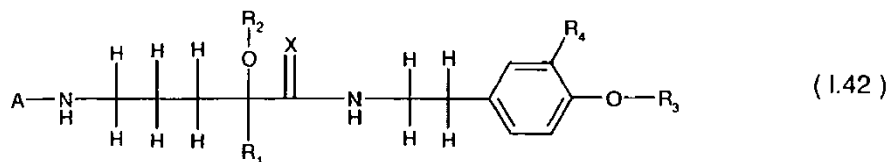
* Tabla 41: Compuestos representados por la Fórmula 1.41



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

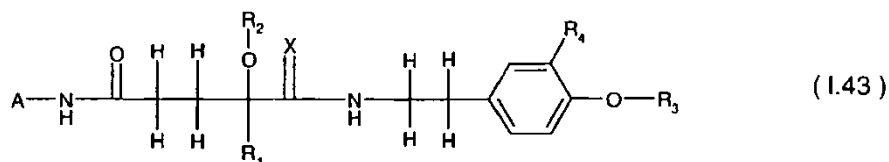
5 * Tabla 42: Compuestos representados por la Fórmula 1.42



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

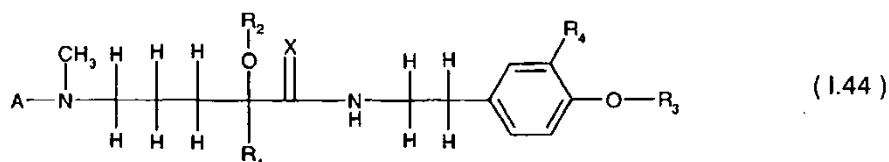
* Tabla 43: Compuestos representados por la Fórmula 1.43



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

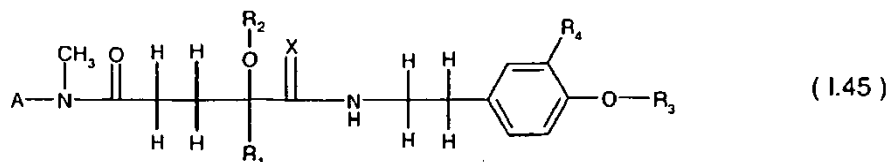
* Tabla 44: Compuestos representados por la Fórmula 1.44



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

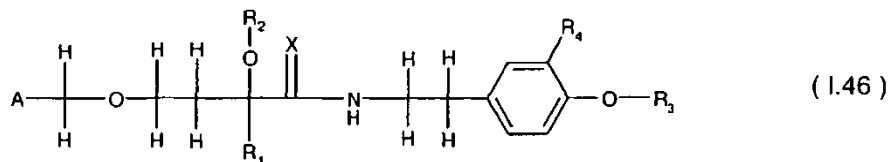
* Tabla 45: Compuestos representados por la Fórmula 1.45



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

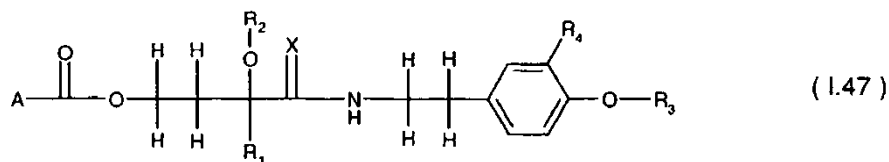
* Tabla 46: Compuestos representados por la Fórmula 1.46



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

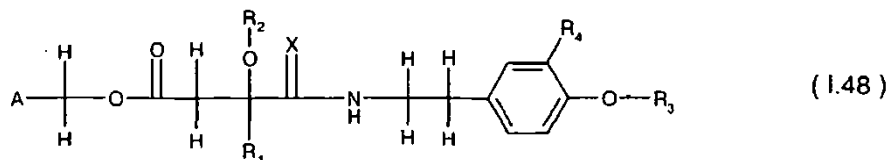
5 * Tabla 47: Compuestos representados por la Fórmula 1.47



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

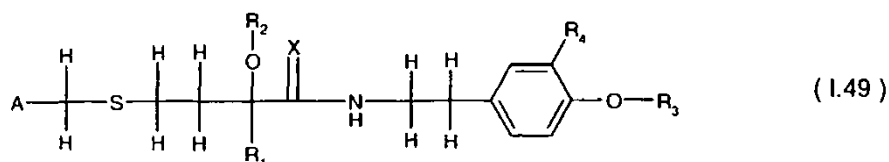
* Tabla 48: Compuestos representados por la Fórmula 1.48



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

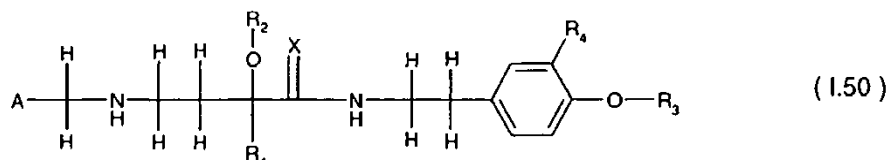
* Tabla 49: Compuestos representados por la Fórmula 1.49



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

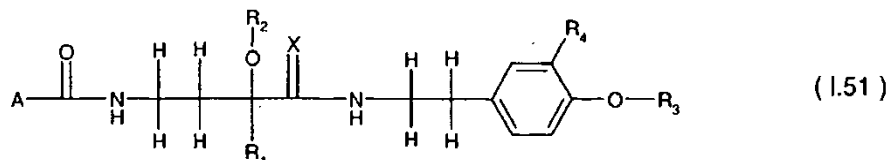
* Tabla 50: Compuestos representados por la Fórmula 1.50



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

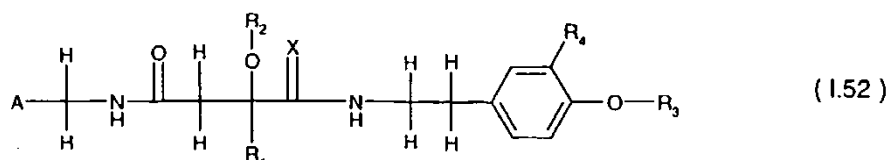
* Tabla 51: Compuestos representados por la Fórmula 1.51



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

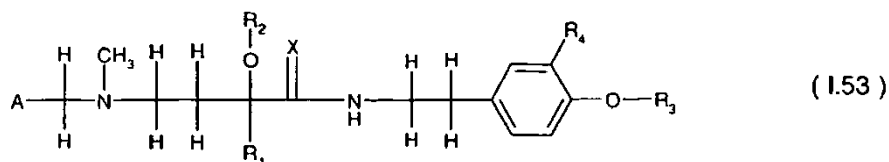
5 * Tabla 52: Compuestos representados por la Fórmula 1.52



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

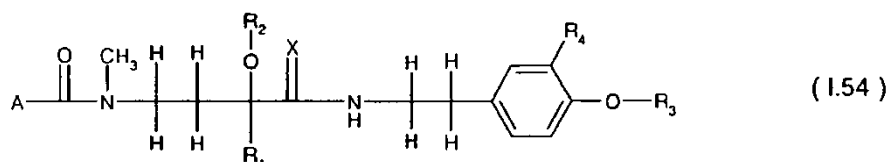
* Tabla 53: Compuestos representados por la Fórmula 1.53



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

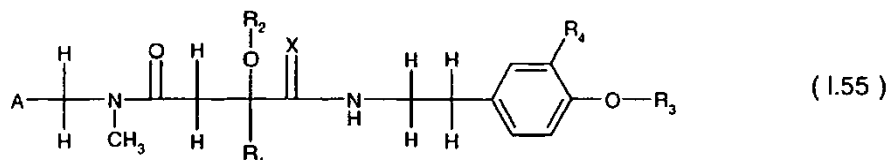
* Tabla 54: Compuestos representados por la Fórmula 1.54



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

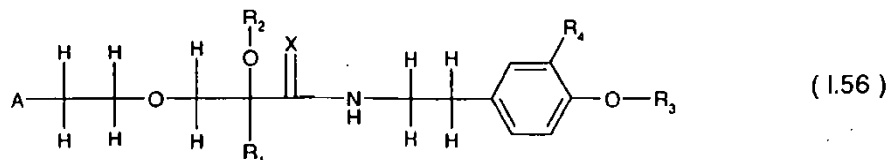
* Tabla 55: Compuestos representados por la Fórmula 1.55



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

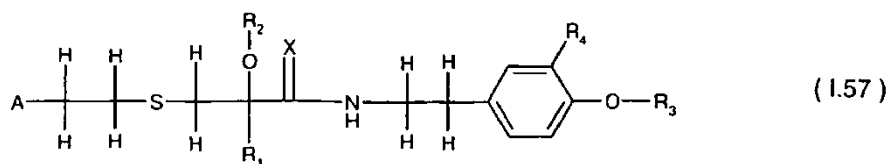
* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

* Tabla 56: Compuestos representados por la Fórmula 1.56



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

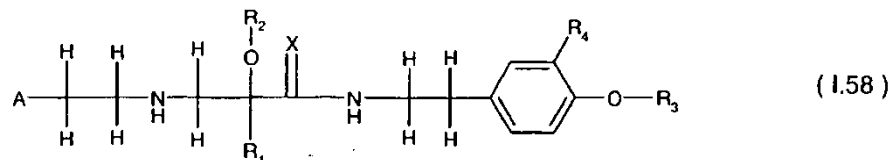
5 * Tabla 57: Compuestos representados por la Fórmula 1.57



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

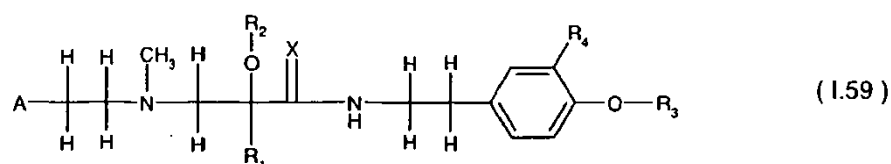
* Tabla 58: Compuestos representados por la Fórmula 1.58



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

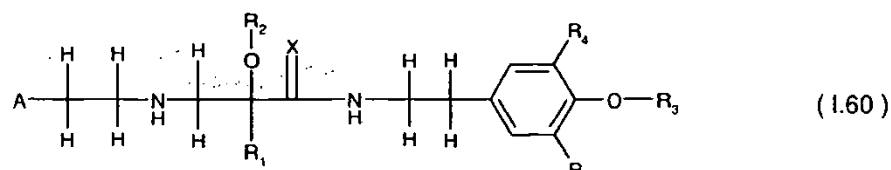
* Tabla 59: Compuestos representados por la Fórmula 1.59



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

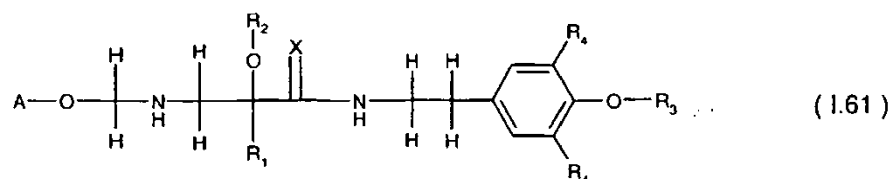
* Tabla 60: Compuestos representados por la Fórmula 1.60



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

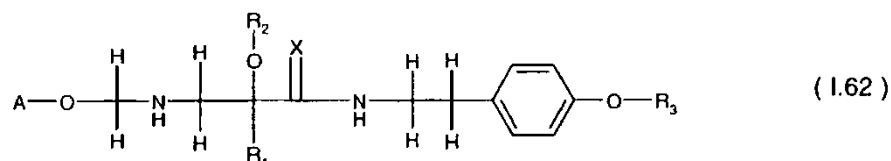
* Tabla 61: Compuestos representados por la Fórmula 1.61



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃, R₄ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

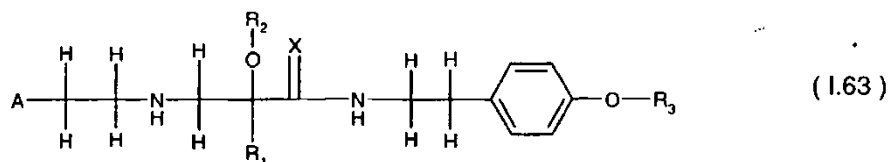
5 * Tabla 62: Compuestos representados por la Fórmula 1.62



en la que la combinación de los grupos A, R₁, R₂, R₃ y X corresponde cada una a una fila en la tabla A.

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

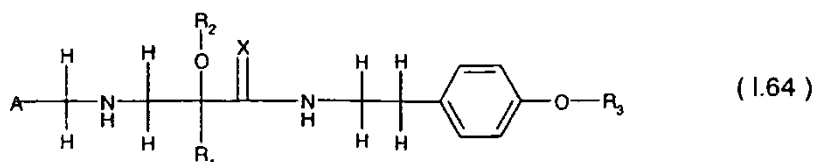
* Tabla 63: Compuestos representados por la Fórmula I.63



en la que la combinación de los grupos A , R_1 , R_2 , R_3 , y X corresponde cada una a una fila en la tabla A .

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

* Tabla 64: Compuestos representados por la Fórmula 1.64



en la que la combinación de los grupos A , R_1 , R_2 , R_3 , y X corresponde cada una a una fila en la tabla A .

* indica que los compuestos no están de acuerdo con la invención

Tabla A: (Ph designa fenilo; * indica no según la invención)

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
001	Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
002	Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
003	Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C°CH	OCH ₃	O
004	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
005	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
006	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
007	Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
* 008	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
* 009	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
010	4-F-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
011	4-F-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
012	4-F-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
013	4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
014	4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
015	4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
016	4-F-Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
* 017	4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
* 018	4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
019	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
020	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
021	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
022	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
023	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
024	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
025	4-Cl-Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
* 026	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
027	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
028	4-Br-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
029	4-Br-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
030	4-Br-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
031	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
032	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
033	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
034	4-Br-Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
* 035	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
* 036	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
037	4-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
038	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
039	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
040	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
041	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
042	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
043	4-CH ₃ -Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
044*	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
045*	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
046	4-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
047	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
048	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
049	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
050	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
051	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
052	4-CF ₃ -Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
053*	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
054*	4-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
055	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
056	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
057	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
058	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O

ES 2 536 973 T3

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
059	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
060	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
061	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
062*	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
063*	4-CH ₃ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
064	4-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
065	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
066	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
067	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
068	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
069	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
070	4-CH ₃ O-Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
071	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
072*	4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
073	3,4-Cl ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
074	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
075	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
076	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
077	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
078	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
079	3,4-Cl ₂ -Ph	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
080	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
081*	3,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
082	2-F-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
083	2-F-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
084	2-F-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
085	2-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
086	2-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
087	2-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
088	2-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
089	2-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
090	2-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
091	2-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
092	2-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
093	2-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
094	2-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
095	2-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
096	2-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
097	2-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
098	2-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
099	2-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
100	2-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
101	2-CF ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
102	2-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
103	2-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
104	2-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
105	2-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
106	2-CN-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
107	2-CN-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
108	2-CN-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
109	2-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
110	2-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
111	2-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
112	2-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
113	2-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
114	2-CH ₃ O-P	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
115	2-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
116	2-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
117	2-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
118	3-F-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
119	3-F-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
120	3-F-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
121	3-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
122	3-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
123	3-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
124	3-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
125	3-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
126	3-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
127	3-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
128	3-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
129	3-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
130	3-Br-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
131	3-Br-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
132	3-Br-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
133	3-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
134	3-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
135	3-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
136	3-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
137	3-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
138	3-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

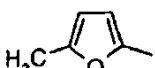
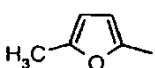
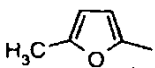
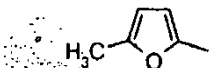
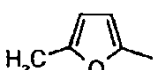
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
139	3-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
140	3-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
141	3-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
142	3-CF ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
143	3-CF ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
144	3-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
145	3-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
146	3-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
147	3-CF ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
148	3-CN-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
149	3-CN-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
150	3-CN-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
151	3-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
152	3-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
153	3-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
154	3-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
155	3-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
156	3-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
157	3-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
158	3-CH ₃ O-P	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
159	3-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
160	3-CF ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
161	3-CF ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
162	3-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
163	3-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
164	3-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
165	3-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
166	4-CH ₂ =CH-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
167	4-CH ₂ =CH-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
168	4-CH ₂ =CH-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
169	4-CH ₂ =CH-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
170	4-CH ₂ =CH-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
171	4-CH ₂ =CH-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
172	4-CH≡C-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
173	4-CH≡C-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
174	4-CH≡C-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
175	4-CH≡C-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
176	4-CH≡C-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
177	4-CH≡C-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
178	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

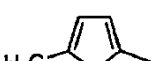
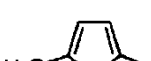
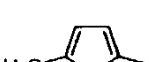
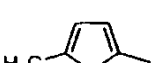
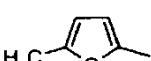
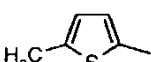
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
179	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
180	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
181	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
182	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
183	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
184	4-(CH ₃) ₂ CH-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
185	4-(CH ₃) ₂ CH-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
186	4-(CH ₃) ₂ CH-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
187	4-(CH ₃) ₂ CH-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
188	4-(CH ₃) ₂ CH-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
189	4-(CH ₃) ₂ CH-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
190	4-(CH ₃) ₃ C-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
191	4-(CH ₃) ₃ C-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
192	4-(CH ₃) ₃ C-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
193	4-(CH ₃) ₃ C-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
194	4-(CH ₃) ₃ C-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
195	4-(CH ₃) ₃ C-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
196	4-CN-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
197	4-CN-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
198	4-CN-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
199	4-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
200	4-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
201	4-CN-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
202	4-CF ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
203	4-CF ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
204	4-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
205	4-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
206	4-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
207	4-CF ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
208	4-CH ₃ S-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
209	4-CH ₃ S-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
210	4-CH ₃ S-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
211	4-CH ₃ S-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
212	4-CH ₃ S-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
213	4-CH ₃ S-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
214	4-CF ₃ S-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
215	4-CF ₃ S-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
216	4-CF ₃ S-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
217	4-CF ₃ S-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
218	4-CF ₃ S-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O

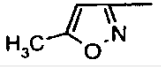
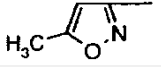
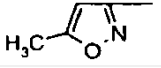
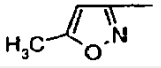
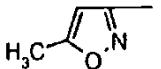
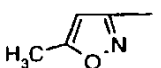
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
219	4-CF ₃ S-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
220	4-CH ₃ CH ₂ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
221	4-CH ₃ CH ₂ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
222	4-CH ₃ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
223	4-CH ₃ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
224	4-CH ₃ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
225	4-CH ₃ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
226	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
227	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
228	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
229	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
230	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
231	4-CH ₃ CH ₂ CH ₂ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
232	3,4-Br ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
233	3,4-Br ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
234	3,4-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
235	3,4-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
236	3,4-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
237	3,4-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CM	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
238	3,5-Br ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
239	3,5-Br ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
240	3,5-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
241	3,5-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
242	3,5-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
243	3,5-Br ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
244	2,3-Cl ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
245	2,3-Cl ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
246	2,3-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
247	2,3-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
248	2,3-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
249	2,3-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
250	2,4-Cl ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
251	2,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
252	2,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
253	2,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
254	2,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
255	2,4-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
256	3,5-Cl ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
257	3,5-Cl ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
258	3,5-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

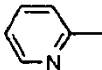
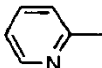
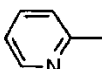
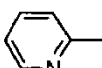
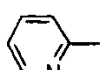
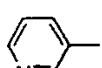
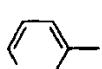
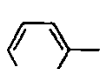
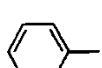
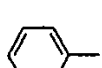
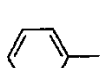
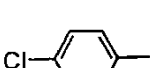
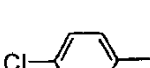
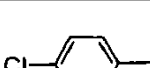
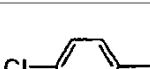
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
259	3,5-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
260	3,5-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
261	3,5-Cl ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
262	2,4-F ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
263	2,4-F ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
264	2,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
265	2,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
266	2,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
267	2,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
268	3,4-F ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
269	3,4-F ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
270	3,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
271	3,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
273	3,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
274	3,4-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
275	3,5-F ₂ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
276	3,5-F ₂ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
277	3,5-F ₂ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
278	3,5-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
279	3,5-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
280	3,5-F ₂ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
281	3-Br-4-F-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
282	3-Br-4-F-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
283	3-Br-4-F-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
284	3-Br-4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
285	3-Br-4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
286	3-Br-4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
287	3-Cl-4-F-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
288	3-Cl-4-F-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
289	3-Cl-4-F-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
290	3-Cl-4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
291	3-Cl-4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
292	3-Cl-4-F-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
293	3-F-4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
294	3-F-4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
295	3-F-4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
296	3-F-4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
297	3-F-4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
298	3-F-4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
299	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

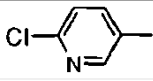
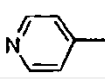
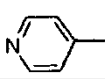
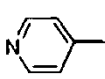
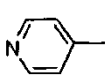
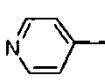
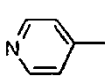
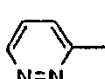
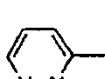
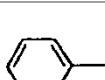
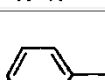
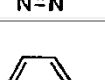
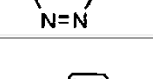
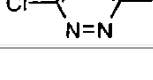
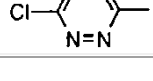
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
300	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
301	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
302	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
303	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
304	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
305	3,4-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
306	3,4-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
307	3,4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
308	3,4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
309	3,4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
310	3,4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
311	3,5-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
312	3,5-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
313	3,5-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
314	3,5-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
315	3,5-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
316	3,5-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
317	3,4-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
318	3,4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
319	3,4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
320	3,4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
321	3,4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
322	3,4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
323	3,5-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
324	3,5-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
325	3,5-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
326	3,5-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
327	3,5-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
328	3,5-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
329	3-CH ₃ -4-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
330	3-CH ₃ -4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
331	3-CH ₃ -4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
332	3-CH ₃ -4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
333	3-CH ₃ -4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
334	3-CH ₃ -4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
335	3-F-4-CH ₃ O-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
336	3-F-4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
337	3-F-4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
338	3-F-4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
339	3-F-4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O

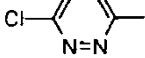
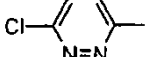
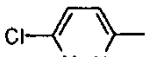
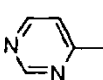
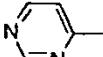
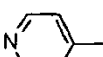
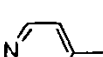
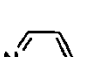
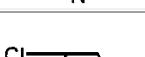
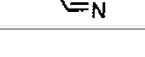
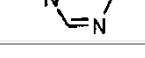
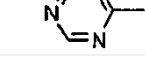
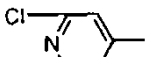
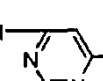
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
340	3-F-4-CH ₃ O-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
341 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
342 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
343 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
344 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
345 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
346 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
347 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
348 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
349 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
350 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
351 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
352 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
353 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
354 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
355 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
356 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
357 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O

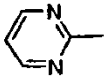
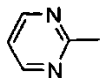
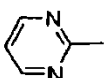
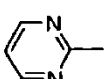
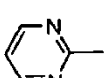
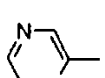
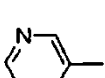
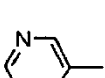
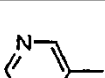
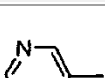
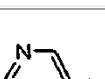
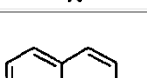
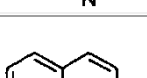
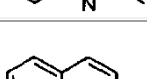
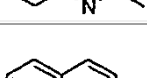
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
						
358 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
359		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
360		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
361		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
362		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
363		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
364		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
365		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
366		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
367		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
368		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
369		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
370		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
371		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
372		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
373		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

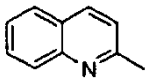
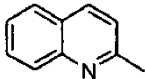
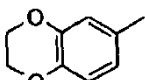
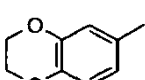
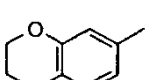
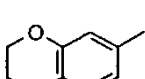
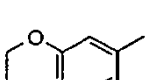
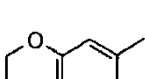
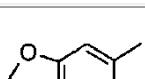
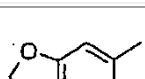
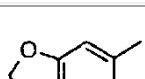
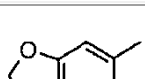
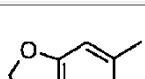
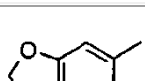
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
374		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
375		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
376		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
377 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
378 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
379 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
380 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
381 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
382 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
383 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
384 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
385 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
386 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
387 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
388 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
389 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
390 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

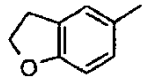
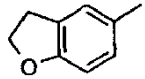
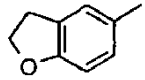
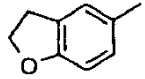
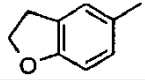
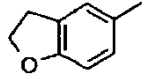
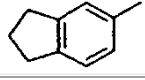
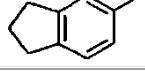
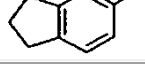
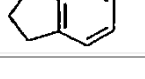
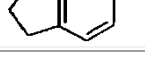
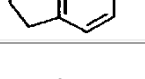
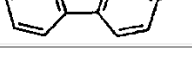
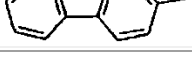
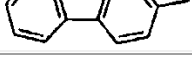
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
						
391 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
392 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
393 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
394 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
395 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
396 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
397 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
398 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
399 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
400 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
401 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
402 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
403 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
404 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
405 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
406 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

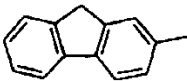
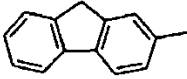
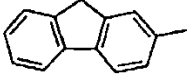
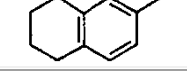
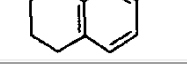
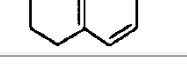
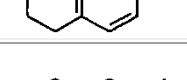
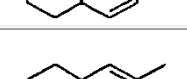
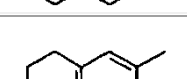
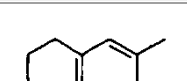
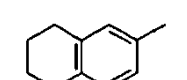
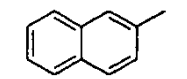
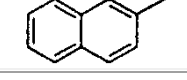
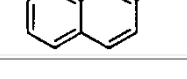
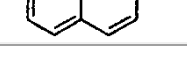
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
						
407 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
408 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
409 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
410 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
411 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
412 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
413 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
414 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
415 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
416 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
417 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
418 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
419 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
420 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
421 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
422 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O

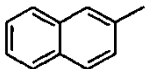
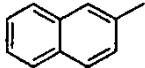
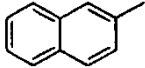
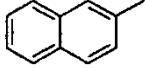
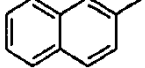
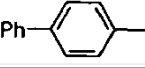
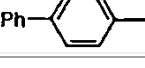
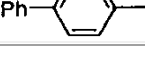
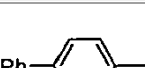
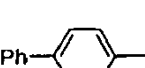
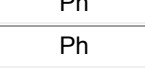
No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
						
423 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
424 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
425 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
426 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
427 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
428 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
429 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
430 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
431 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
432 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
433 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
434 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
435 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
436 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
437 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
438 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
439 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
440 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
441 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
442 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
443 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
444 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
445 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
446 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
447 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
448 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
449 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
450 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
451 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
452 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
453*		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
454 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
455 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
456 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
457 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
458 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
459 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
460 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
461 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
462 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
463 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
464 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
465 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
466 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
467 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
						
468 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
469 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
470 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
471 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
472 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
473 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
474 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
475 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
476 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
477 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
478 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
479 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
480 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡H	OCH ₃	O
481 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
482 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
						
483 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
484 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
485 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
486 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
487 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
488 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
489 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
490 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
491 *		CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
492 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
493 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
494 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
495 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
496 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
497 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
498 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
499 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
500 *		CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
501 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
502 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
503 *		H	H	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
504 *		H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
505 *		H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
506 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	OCH ₃	O
507 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	OCH ₃	O
508 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
509 *		CH ₃	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	O
510 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CH ₃	O
511 *		H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	OCH ₃	S
* 512	Ph	H	H	CH ₃	Cl	O
* 513	Ph	H	CH ₃	CH ₃	Cl	O
* 514	Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	O
* 515	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	Cl	O
* 516	Ph	H	H	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 517	Ph	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 518	Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	O

ES 2 536 973 T3

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
* 519	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 520	Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 521	Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 522	Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 523	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 524	4-Cl-Ph	H	H	CH ₃	Cl	O
* 525	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₃	Cl	O
* 526	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	O
* 527	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	Cl	O
* 528	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 529	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 530	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 531	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	Cl	O
* 532	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 533	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 534	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 535	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 536	4-Cl-Ph	H	H	CH ₃	Br	O
* 537	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₃	Br	O
* 538	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Br	O
* 539	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	Br	O
* 540	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ CH ₃	Br	O
* 541	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	O
* 542	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	O
* 543	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	Br	O
* 544	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 545	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 546	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 547	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 548	4-Cl-Ph	H	H	CH ₃	CN	O
* 549	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₃	CN	O
* 550	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CN	O
* 551	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CN	O
* 552	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ CH ₃	CN	O
* 553	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CN	O
* 554	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CN	O
* 555	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ CH ₃	CN	O
* 556	4-Cl-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 557	4-Cl-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 558	4-Cl-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
* 559	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 560	Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 561	Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 562	Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 563	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 564	Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 565	Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 566	Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 567	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 568	4-Br-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 569	4-Br-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 570	4-Br-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 571	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 572	4-Br-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 573	4-Br-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 574	4-Br-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 575	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 576	4-Br-Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 577	4-Br-Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 578	4-Br-Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 579	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 580	4-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 581	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 582	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 583	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Cl	O
* 584	4-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 585	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 586	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 587	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	Br	O
* 588	4-CH ₃ -Ph	H	H	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 589	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 590	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ CH ₃	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 591	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CH	CN	O
* 592	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃	O
* 593	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃	O
* 594	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃	O
* 595	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡CCH ₃	OCH ₃	O
* 596	Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡C-C ₂ H ₅	OCH ₃	O
* 597	4-Cl-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡C-C ₂ H ₅	OCH ₃	O
* 598	4-Br-Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡C-C ₂ H ₅	OCH ₃	O

No.	A	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	X
* 599	4-CH ₃ -Ph	H	CH ₂ C≡CH	CH ₂ C≡C-C ₂ H ₅	OCH ₃	O

Las formulaciones se pueden preparar de manera análoga a las descritas, por ejemplo, en el documento WO 95/30651.

Ejemplos biológicos

5 D-1: Acción contra Plasmopara viticola en vides

a) Acción protectora residual

Plántulas de vid se pulverizan en la fase de 4 a 5 hojas con una mezcla de pulverización (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de una formulación de polvo humectable del compuesto de ensayo. Después de 24 horas, las plantas tratadas se infectan con una suspensión de esporangios del hongo. La infestación por el hongo se evalúa después de la incubación durante 6 días a una humedad relativa de 95-100% y +20°C.

b) Acción curativa residual

Plántulas de vid se infectan en la fase de 4 a 5 hojas con una suspensión de esporangios del hongo. Después de la incubación durante 24 horas en una cámara de humedad a una humedad relativa de 95-100% y +20°C, las plantas infectadas se secan y se pulverizan con una mezcla de pulverización (0,02% de ingrediente activo) preparada a partir de una formulación de polvo humectable del compuesto de ensayo. Después de que el revestimiento pulverizado se haya secado, las plantas tratadas se colocan nuevamente en la cámara de humedad. La infestación por el hongo se evaluó 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 fúngicas en ambos ensayos D-1a) y D-1b) en 80-100%. Al mismo tiempo, las plantas no tratadas mostraban un ataque de patógenos de 80-100%.

D-2: Acción contra Phytophthora en plantas de tomate

a) Acción protectora residual

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

b) Acción sistémica

Después de un período de cultivo de 3 semanas, las plantas de tomate se riegan con una mezcla de pulverización (0,02% de ingrediente activo basado en el volumen del suelo) preparada a partir de una formulación de polvo humectable del compuesto de ensayo. Se tiene cuidado de que la mezcla de pulverización no entre en contacto con las partes de las plantas que están por encima del terreno. Después de 96 horas, las plantas tratadas se infectan con una suspensión de esporangios del hongo. La infestación por el hongo se evalúa después de la incubación de las plantas infectadas durante 4 días a una humedad relativa de 90-100% 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 fúngicas en ambos ensayos D-2a) y D-2b) en 80-100%. Al mismo tiempo, las plantas no tratadas mostraban un ataque de patógenos de 80-100%.

40 D-3: Acción contra Phytophthora en plantas de patata

a) Acción protectora residual

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

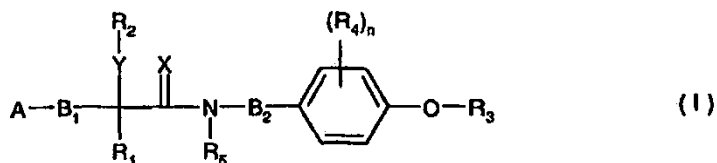
b) Acción sistémica

5 Plantas de patata de 2-3 semanas de edad (variedad Bintje) se riegan con una mezcla de pulverización (0,02% de ingrediente activo basado en el volumen del suelo) preparada a partir de una formulación de polvo humectable del compuesto de ensayo. Se tiene cuidado de que la mezcla de pulverización no entre en contacto con las partes de las plantas que están por encima del terreno. Después de 48 horas, las plantas tratadas se infectan con una suspensión de esporangios del hongo. La infestación por el hongo se evalúa después de la incubación de las plantas infectadas durante 4 días a una humedad relativa de 90-100% y +20°C. La infestación fúngica se controla eficazmente con los compuestos de las Tablas 1 a 64.

10 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 fúngicas en ambos ensayos D-3a) y D-3b) en 80 a 100%. Al mismo tiempo, las plantas no tratadas mostraban un ataque de patógenos de 80 a 100%.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general



incluyendo sus isómeros ópticos y mezclas de tales isómeros, en la que A es fenilo o tienilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, alquenilo de C₂-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquil C₁-C₁₀-tio, alcanoilo de C₁-C₄, halógeno y ciano; y X es oxígeno; e Y es oxígeno; y R₁ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alquenilo de C₃-C₈ o alquinilo de C₃-C₈; y R₂ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alquenilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₆-alquinilo de C₃-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquinilo de C₃-C₄; y R₃ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₈, alquenilo de C₃-C₈, alquinilo de C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquinilo de C₃-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquinilo de C₃-C₄; y R₄ es 3-alcoxi de C₁-C₈; y R₅ es hidrógeno o metilo; y B₁ se selecciona de -CH₂-CH₂-, -O-CH₂- y -S-CH₂-; y n es un número entero de 0 ó 1; y B₂ es -CH₂-CH₂-, CH₂-.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que

A es fenilo, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que comprende alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno y ciano; y X e Y son ambos oxígeno; y R₁ es hidrógeno; y R₂ es hidrógeno, alquilo de C₁-C₄, alquenilo de C₃-C₄ o alquinilo de C₃-C₄; y R₃ es alquilo de C₁-C₄, alquenilo de C₃-C₄ o alquinilo de C₃-C₄; y R₄ es 3-metoxi o 3-etoxi; y R₅ es hidrógeno; y B₁ se selecciona de -CH₂-CH₂-, -O-CH₂- y -S-CH₂-; y n es un número entero de 1; y B₂ es -CH₂-CH₂-.

3. Un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, seleccionado del grupo que consiste en

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

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

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

4-(4-fluoro-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,
 5 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-fluoro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 3-(4-fluoro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 10 2-etoxi-3-(4-fluoro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 3-(4-fluoro-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,
 15 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,
 20 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,
 25 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,
 30 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,
 35 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,

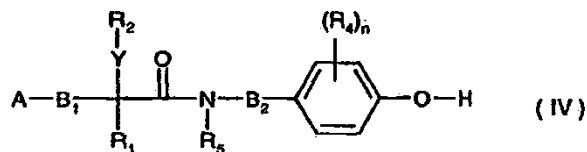
- (R)-2-etoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-butiramida,
 (R)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-fenil-2-prop-2-iniloxi-butiramida,
 (R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,
 (R)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-4-p-tolil-butiramida,
 5 (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-fluoro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (R)-4-(4-fluoro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (R)-2-etoxi-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 10 (R)-4-(4-fluoro-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,
 15 (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-2-iniloxi-propionamida,
 (R)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-p-toliloxi-propionamida,
 20 (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,
 25 (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-fluoro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (R)-3-(4-fluoro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (R)-2-etoxi-3-(4-fluoro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 30 (R)-3-(4-fluoro-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,
 35 (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,
 5 (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,
 10 (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,
 15 (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,
 20 (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,
 25 (S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-4-p-tolil-butiramida,
 (S)-4-(4-fluoro-fenil)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (S)-4-(4-fluoro-fenil)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (S)-2-etoxi-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-butiramida,
 (S)-4-(4-fluoro-fenil)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-2-prop-2-iniloxi-butiramida,
 30 (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,
 35 (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,
 5 (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-fluoro-fenoxi)-2-hidroxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 10 (S)-3-(4-fluoro-fenoxi)-2-metoxi-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (S)-2-etoxi-3-(4-fluoro-fenoxi)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-propionamida,
 (S)-3-(4-fluoro-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,
 15 (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,
 20 (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-fenitio-propionamida,
 (S)-N-[2-(3-metoxi-4-prop-2-iniloxi-fenil)-etil]-3-feniltio-2-prop-2-iniloxi-propionamida.
 25 (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,
 30 (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-beniloxi-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,
 35 (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.

4. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula I según la reivindicación 1, que comprende

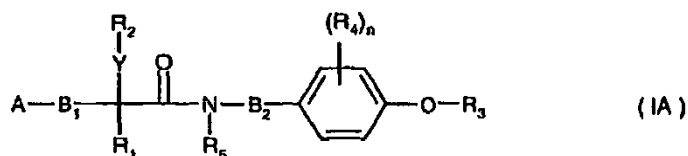
a) hacer reaccionar el fenol de fórmula VI



en la que A, R₁, R₂, R₄, R₅, B₁, B₂ y n son como se definen en la fórmula I, con un compuesto de fórmula V

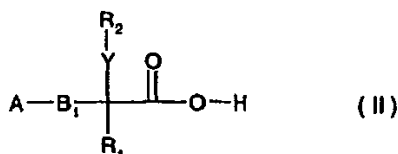


5 en la que R₃ es como se define en la fórmula I, y en la que Z es un grupo saliente, produciendo el subgrupo IA

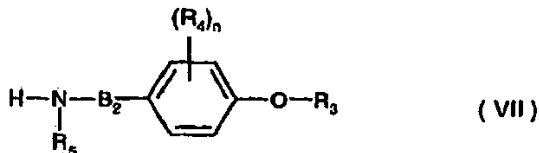


o

b) haciendo reaccionar el ácido de fórmula II

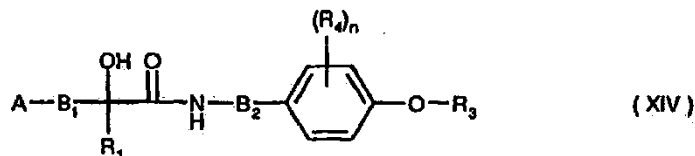


10 con una amina de fórmula VII



en la que A, R₁, R₂, R₃, R₄, R₆, B₁, B₂ y n son como se definen en la fórmula I, o

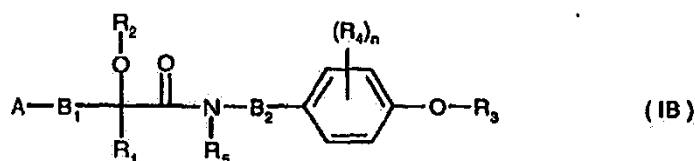
c) haciendo reaccionar el compuesto de fórmula XIV



15 con un agente eterificante de fórmula XV



en la que A, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, B₁, B₂ y n son como se definen para la fórmula I, y en la que Z es un grupo saliente; produciendo el subgrupo IB



20 5. Una composición para controlar y prevenir contra microorganismos fitopatógenos, que comprende un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1 como ingrediente activo, junto con un vehículo adecuado.

6. El uso de un compuesto de fórmula I de acuerdo con la reivindicación 1, para proteger plantas contra la infestación por microorganismos fitopatógenos.

5 7. Un método para controlar y prevenir una infestación de plantas de cultivo por microorganismos fitopatógenos, que 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 a su emplazamiento.

8. Un método de acuerdo con la reivindicación 7, en el que los microorganismos fitopatógenos son organismos fúngicos.