

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 434 822**

51 Int. Cl.:

A01N 43/42 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.11.2007 E 07832840 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **23.10.2013 EP 2103214**

54 Título: **Uso de compuestos de quinolina o sales de los mismos como principios activos en agentes de tratamiento para semillas o suelos, y método para controlar enfermedades en plantas**

30 Prioridad:

01.12.2006 JP 2006325344

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

17.12.2013

73 Titular/es:

**MITSUI CHEMICALS AGRO, INC. (100.0%)
5-2, HIGASHI-SHIMBASHI 1-CHOME
MINATO-KU TOKYO 105-7117, JP**

72 Inventor/es:

**ITO, HIROYUKI;
TAMAGAWA, YASUSHI;
TANAKA, HARUKAZU y
OHARA, TOSHIAKI**

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 434 822 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

Uso de compuestos de quinolina o sales de los mismos como principios activos en agentes de tratamiento para semillas o suelos, y método para controlar enfermedades en plantas

5

Campo técnico

La presente invención se refiere al uso, como agente de tratamiento del suelo (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar el suelo) o como agente de tratamiento para semillas (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar las semillas), de uno o más compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina o sales de la misma como principio activo. Además, la presente invención se refiere a un método para prevenir enfermedades en las plantas mediante el uso de un agente de tratamiento del suelo (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar el suelo) o mediante el uso de un agente de tratamiento para semillas (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar las semillas), que comprende uno o más compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina o sales de la misma como principio activo.

10

15

Antecedentes de la técnica

Los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina son compuestos conocidos públicamente, y se sabe que son útiles como fungicidas agrícolas y hortofrutícolas (Documento de patente 1). Este documento explica de manera particular claramente el efecto fungicida contra las plagas del arroz (*Piricularia oryzae*) moho de la hoja gris del tomate (*Botrytis cinerea*).

20

Sin embargo, este documento no describe un efecto fungicida contra las plagas del arroz por tratamiento del suelo en una caja de tipo vivero haciendo crecer plántones durante el periodo de la siembra hasta el momento del trasplante, y no se sabía que los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina tienen un efecto fungicida contra las plagas del arroz por tratamiento del suelo.

25

Además, este documento no describe que los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina tienen un efecto fungicida contra las enfermedades del suelo por tratamiento de los drenajes del suelo ni se sabía que los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina podían utilizarse contra las enfermedades del suelo.

30

Además, este documento no describe el uso de los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina como agente de tratamiento para las semillas, ni se sabía que los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina se podían utilizar como agente de tratamiento para las semillas. Documento de patente 1: Panfleto de la Publicación internacional WO 2005/70917

35

Divulgación de la invención

40

Problemas a resolver mediante la invención

Como resultado de llevar a cabo amplios estudios sobre los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina durante muchos años, los inventores de la presente invención han descubierto recientemente que los presentes compuestos son útiles como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas, lo que conduce de esta forma a realizar la presente invención.

45

La presente invención proporciona el uso, como agente de tratamiento del suelo (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar el suelo) o como agente de tratamiento para semillas (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar las semillas), de uno o más compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina definidos en el presente documento, o sales de la misma, como principio activo. Además, la presente invención proporciona un método para prevenir enfermedades en las plantas mediante el uso de un agente de tratamiento del suelo (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar el suelo) o mediante el uso de un agente de tratamiento para semillas (una composición para prevenir enfermedades en las plantas caracterizada por tratar las semillas), que comprende uno o más compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina definidos en el presente documento, o sales de la misma, como principio activo.

50

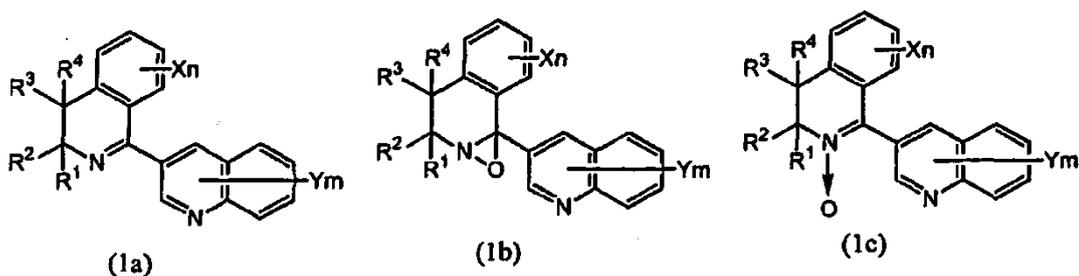
55

En la presente invención, "un efecto preventivo" significa un efecto preventivo y/o un efecto curativo.

60

Medios para resolver los problemas

La presente invención se refiere al uso de uno o más compuestos de la fórmula general (Ia), (Ib) o (Ic):



donde

R¹ y R² son un grupo alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno iguales o diferentes; o un grupo fenilo que puede estar sustituido con de 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes,

R³ y R⁴ son un átomo de hidrógeno, grupo metilo, grupo etilo, átomo del flúor o átomo de cloro,

X es un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₄; o un grupo ciano; y n es un número entero de 0 a 2, e

Y es un átomo del flúor, átomo de cloro o grupo metilo, y m es 0 o 1,

o una sal de los mismos

como agente de tratamiento del suelo, o como agente de tratamiento para las semillas.

Cuando n es 2, X puede ser igual o diferente.

Aquí, en los compuestos (1a), (1b) y (1c), X representa un átomo de hidrógeno cuando n es 0, e Y representa un átomo de hidrógeno cuando m es 0,

Efectos de la invención

Los compuestos de 3-(dihidroisoquinolin-1-il) quinolina (1a), (1b) y (1c) de la presente invención se pueden utilizar como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas, y muestran efectos sorprendentes contra varios patógenos de las plantas, especialmente contra plagas de arroz sin causar daños a las plantas hospedadoras y tienen efectos de prevención superiores contra enfermedades de las plantas como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

En los compuestos (1a), (1b) y (1c) de la presente invención, "grupo alquilo C₁-C₆" puede ser un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, incluyendo por ejemplo un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo, grupo isopropilo, grupo butilo, grupo isobutilo, grupo s-butilo, grupo t-butilo, grupo pentilo, grupo isopentilo, grupo 2-metilbutilo, grupo neopentilo, grupo 1-etilpropilo, grupo hexilo, grupo 4-metilpentilo, grupo 3-metilpentilo, grupo 2-metilpentilo, grupo 1-metilpentilo, grupo 3,3-dimetilbutilo, grupo 2,2-dimetilbutilo, grupo 1,1-dimetilbutilo, grupo 1,2-dimetilbutilo, grupo 1,3-dimetilbutilo, un grupo 2,3-dimetilbutilo o grupo 2-etilbutilo, preferentemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 5 átomos de carbono (grupo alquilo C₁-C₅), más preferentemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (grupo alquilo C₁-C₄), aún más preferentemente un grupo alquilo lineal o ramificado que tiene de 1 a 3 átomos de carbono (grupo alquilo C₁-C₃), particularmente preferentemente un grupo metilo, grupo etilo o grupo propilo y lo más preferentemente un grupo metilo o un grupo etilo.

En los compuestos (1a), (1b) y (1c) de la presente invención, un átomo de halógeno es un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo o átomo de yodo, preferentemente un átomo del flúor, átomo de cloro o átomo de bromo, más preferentemente un átomo de flúor o un átomo de cloro y lo más preferentemente un átomo de flúor.

En los compuestos (1a), (1b) y (1c) de la presente invención, un "grupo alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno iguales o diferentes" es, además de los "grupos alquilo C₁-C₆" anteriormente citados, el "grupo alquilo (C₁-C₆) anteriormente citado que puede estar sustituido con de 1 a 3 "átomos de halógeno" iguales o diferentes" anteriormente citados, incluyendo por ejemplo un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo yodometilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2-bromoetilo, grupo 2-cloroetilo, un grupo 2-fluoroetilo, un grupo 3-cloropropilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 3-fluoro-2-metilpropilo, un grupo 3,3,3-trifluoro-2-metilpropilo, o un grupo 6, 6, 6-triclorohexilo, preferentemente el "grupo alquilo C₁-C₄" anteriormente citado que puede estar sustituido con de 1 a 3 "átomos de halógeno" iguales o diferentes anteriormente citados, más preferentemente el "grupo alquilo C₁-C₃" anteriormente citado que puede estar sustituido con de 1 a 3 de los "átomos de flúor o átomos de cloro" iguales o diferentes anteriormente citados, aún más preferentemente un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo, un grupo clorometilo o grupo trifluorometilo y particularmente preferentemente un grupo metilo, grupo etilo o grupo trifluorometilo.

En los compuestos (Ia), (Ib) y (Ic) de la presente invención, un "grupo fenilo que puede estar sustituido con de 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes", en R¹ y similares puede ser, además del "grupo fenilo" anteriormente citado, el "grupo fenilo" anteriormente citado que está sustituido con de 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes anteriormente citados,

5 En los compuestos (Ia), (Ib) y (Ic) de la presente invención, 1 a 2 X pueden sustituir en posiciones arbitrarias sustituibles del anillo de isoquinolina, y en el caso en que 2 X estén presentes (en un caso donde n sea 2), pueden ser iguales o diferentes.

10 En los compuestos (Ia), (Ib) y (Ic) de la presente invención, Y puede sustituir en una posición arbitraria sustituible del anillo de isoquinolina.

Los compuestos (Ia), (Ib) o (Ic) de la presente invención se pueden convertir en sales, incluyendo por ejemplo sales minerales tales como clorhidrato, sulfato y nitrato; fosfatos; sulfonatos tales como metanosulfonato, etanosulfonato, bencenosulfonato y p-toluenosulfonato; o bien carboxilatos orgánicos tales como acetato, benzoato, oxalato, fumarato y salicilato (preferentemente clorhidratos, sulfatos, nitratos, metanosulfonatos, oxalatos, fumaratos o salicilatos). Estas sales se han incluido en el ámbito de la presente invención siempre que se puedan utilizar como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas.

15

20 Los compuestos (Ia), (Ib) o (Ic) de la presente invención o sus sales se pueden convertir en solvatos, y estos solvatos incluyen hidratos.

Los compuestos (Ia), (Ib) o (Ic) de la presente invención pueden tener carbonos asimétricos, y en estos casos, la invención de la presente solicitud también incluye una de las formas ópticamente activas, o una mezcla que contiene varias formas ópticamente activas en una relación arbitraria.

25

En los compuestos (Ia), (Ib) o (Ic) de la presente invención, cada R¹ y R² son,
(1a) preferentemente un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo, un grupo trifluorometilo, un grupo trifluoroetilo, un grupo fenilo, un grupo fluorofenilo o un grupo clorofenilo,

30 cada R³ y R⁴ son,
(2a) preferentemente un átomo de hidrógeno, grupo metilo o átomo de flúor,

X_n es,
35 (3a) preferentemente tal que

X es un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, grupo metilo, grupo ciano, y n es un número entero de 0 a 1,

40 Y_m es,
(4a) preferentemente tal que Y es un grupo metilo, y m es un número entero de 0 a 1.

Además, los compuestos obtenidos combinando R¹ y R² seleccionados de (1a) R³ y R⁴ seleccionados de (2a), X_n seleccionado de (3a) e Y_m seleccionados de (4a) son también preferibles, por ejemplo se pueden mencionar,

45 (A3) un compuesto donde R¹ y R² son un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo, un grupo trifluorometilo, un grupo trifluoroetilo, un grupo fenilo, un grupo fluorofenilo o un grupo clorofenilo,
R³ y R⁴ son un átomo de hidrógeno, grupo metilo o átomo de flúor,

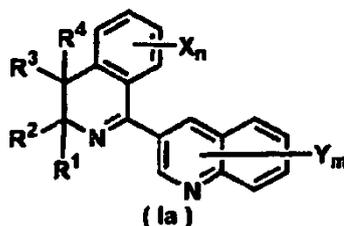
X es un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, grupo metilo, grupo ciano, y n es un número entero de 0 a 1,

50 Y es un grupo metilo, y m es un número entero de 0 a 1,

En lo que respecta a los compuestos (Ia), (Ib) o (Ic) de la presente invención, los compuestos representativos se han indicado en las siguientes tablas, pero la presente invención no está limitada a dichos compuestos.

55 En las siguientes tablas, "Me" indica un grupo metilo, "Et" un grupo etilo, "Pr" un grupo propilo, "iPr" un grupo isopropilo, "iBu" un grupo isobutilo, "tBu" un grupo t-butilo, "iPen" un grupo isopentilo, "Ph" un grupo fenilo, "4FPh" un grupo 4-fluorofenilo, "H" en "X_n" e "Y_m" indica que n es 0 o m es 0, y blanco en "tipo de sal" indica que está en forma libre.

Tabla 1



Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-1	Me, Me	H, H	H	H	
1-2	Me, Me	H, H	H	2-F	
1-3	Me, Me	H, H	H	4-F	
1-4	Me, Me	H, H	H	5-F	
1-5	Me, Me	H, H	H	6-F	
1-6	Me, Me	H, H	H	7-F	
1-7	Me, Me	H, H	H	8-F	
1-8	Me, Me	H, H	H	2-Cl	
1-9	Me, Me	H, H	H	4-Cl	
1-10	Me, Me	H, H	H	5-Cl	
1-11	Me, Me	H, H	H	6-Cl	
1-12	Me, Me	H, H	H	7-Cl	
1-13	Me, Me	H, H	H	8-Cl	
1-14	Me, Me	H, H	H	2-Me	
1-15	Me, Me	H, H	H	4-Me	
1-16	Me, Me	H, H	H	5-Me	
1-17	Me, Me	H, H	H	6-Me	
1-18	Me, Me	H, H	H	7-Me	
1-19	Me, Me	H, H	H	8-Me	
1-32	Me, Me	H, H	5-F	H	
1-33	Me, Me	H, H	5-F	4-F	
1-34	Me, Me	H, H	5-F	8-F	
1-35	Me, Me	H, H	5-F	4-Cl	
1-36	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl	
1-38	Me, Me	H, H	5-F	8-Me	
1-41	Me, Me	H, H	6-F	H	
1-42	Me, Me	H, H	7-F	H	
1-43	Me, Me	H, H	8-F	H	
1-44	Me, Me	H, H	5-Cl	H	
1-45	Me, Me	H, H	5-Cl	4-F	
1-46	Me, Me	H, H	5-Cl	8-F	
1-47	Me, Me	H, H	5-Cl	4-Cl	
1-48	Me, Me	H, H	5-Cl	6-Cl	
1-49	Me, Me	H, H	5-Cl	4-Me	
1-50	Me, Me	H, H	5-Cl	8-Me	
1-53	Me, Me	H, H	6-Cl	H	
1-54	Me, Me	H, H	7-Cl	H	
1-55	Me, Me	H, H	8-Cl	H	
1-56	Me, Me	H, H	5-Br	H	
1-57	Me, Me	H, H	5-Br	4-F	
1-58	Me, Me	H, H	5-Br	8-F	
1-59	Me, Me	H, H	5-Br	4-Cl	
1-60	Me, Me	H, H	5-Br	6-Cl	
1-61	Me, Me	H, H	5-Br	4-Me	
1-62	Me, Me	H, H	5-Br	8-Me	
1-65	Me, Me	H, H	6-Br	H	
1-66	Me, Me	H, H	7-Br	H	
1-67	Me, Me	H, H	8-Br	H	
1-88	Me, Me	H, H	5-I	H	
1-69	Me, Me	H, H	5-Me	H	
1-70	Me, Me	H, H	6-Me	H	
1-71	Me, Me	H, H	7-Me	H	
1-72	Me, Me	H, H	8-Me	H	
1-73	Me, Me	H, H	5-Et	H	

ES 2 434 822 T3

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-74	Me, Me	H, H	6-Et	H	
1-75	Me, Me	H, H	7-Et	H	
1-76	Me, Me	H, H	8-Et	H	
1-77	Me, Me	H, H	5-Pr	H	
1-78	Me, Me	H, H	6-Pr	H	
1-79	Me, Me	H, H	7-Pr	H	
1-80	Me, Me	H, H	8-Pr	H	
1-116	Me, Me	H, H	5-CN	H	
1-117	Me, Me	H, H	5,6-F2	H	
1-118	Me, Me	H, H	5,6-F2	4-F	
1-119	Me, Me	H, H	5,6-F2	8-F	
1-120	Me, Me	H, H	5,6-F2	4-Cl	
1-121	Me, Me	H, H	5,6-F2	6-Cl	
1-122	Me, Me	H, H	5,6-F2	4-Me	
1-123	Me, Me	H, H	5,6-F2	8-Me	
1-126	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	H	
1-127	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	4-F	
1-128	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	8-F	
1-129	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	4-Cl	
1-130	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	6-Cl	
1-131	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	4-Me	
1-132	Me, Me	H, H	5,6-Cl2	8-Me	
1-135	Me, Me	H, H	5-F,7-Me	H	
1-136	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H	
1-137	Me, Et	H, H	H	H	
1-138	Me, Et	H, H	H	4-F	
1-139	Me, Et	H, H	H	8-F	
1-140	Me, Et	H, H	H	4-Cl	
1-141	Me, Et	H, H	H	6-Cl	
1-142	Me, Et	H, H	H	8-Cl	
1-143	Me, Et	H, H	H	4-Me	
1-144	Me, Et	H, H	H	8-Me	
1-147	Me, Et	H, H	5-F	H	
1-148	Me, Et	H, H	6-F	H	
1-149	Me, Et	H, H	7-F	H	
1-150	Me, Et	H, H	5-Cl	H	
1-151	Me, Et	H, H	6-Cl	H	
1-152	Me, Et	H, H	7-Cl	H	
1-153	Me, Et	H, H	5-Br	H	
1-154	Me, Et	H, H	6-Br	H	
1-155	Me, Et	H, H	7-Br	H	
1-156	Me, Et	H, H	5-I	H	
1-172	Me, Et	H, H	5-CN	H	
1-173	Me, Et	H, H	5,6-F2	H	
1-174	Me, Et	H, H	5,6-Cl2	H	
1-175	Me, Pr	H, H	H	H	
1-176	Me, Pr	H, H	H	4-F	
1-177	Me, Pr	H, H	H	8-F	
1-178	Me, Pr	H, H	H	4-Cl	
1-179	Me, Pr	H, H	H	6-Cl	
1-180	Me, Pr	H, H	H	8-Cl	
1-181	Me, Pr	H, H	H	4-Me	
1-182	Me, Pr	H, H	H	8-Me	
1-185	Me, Pr	H, H	5-F	H	
1-186	Me, Pr	H, H	6-F	H	
1-187	Me, Pr	H, H	7-F	H	
1-188	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	
1-189	Me, Pr	H, H	6-Cl	H	
1-190	Me, Pr	H, H	7-Cl	H	
1-191	Me, Pr	H, H	5-Br	H	
1-192	Me, Pr	H, H	6-Br	H	
1-193	Me, Pr	H, H	7-Br	H	
1-194	Me, Pr	H, H	5-I	H	
1-195	Me, Pr	H, H	5-Me	H	
1-210	Me, Pr	H, H	5-CN	H	

ES 2 434 822 T3

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-211	Me, Pr	H, H	5,6-F2	H	
1-212	Me, Pr	H, H	5,6-Cl2	H	
1-213	Me, iPr	H, H	H	H	
1-214	Me, iPr	H, H	H	4-F	
1-215	Me, iPr	H, H	H	8-F	
1-216	Me, iPr	H, H	H	4-Cl	
1-217	Me, iPr	H, H	H	6-Cl	
1-218	Me, iPr	H, H	H	8-Cl	
1-219	Me, iPr	H, H	H	4-Me	
1-220	Me, iPr	H, H	H	8-Me	
1-223	Me, iPr	H, H	5-F	H	
1-224	Me, iPr	H, H	6-F	H	
1-225	Me, iPr	H, H	7-F	H	
1-226	Me, iPr	H, H	5-Cl	H	
1-227	Me, iPr	H, H	6-Cl	H	
1-228	Me, iPr	H, H	7-Cl	H	
1-229	Me, iPr	H, H	5-Br	H	
1-230	Me, iPr	H, H	6-Br	H	
1-231	Me, iPr	H, H	7-Br	H	
1-232	Me, iPr	H, H	5-I	H	
1-233	Me, iPr	H, H	5-Me	H	
1-248	Me, iPr	H, H	5-CN	H	
1-249	Me, iPr	H, H	5,6-F2	H	
1-250	Me, iPr	H, H	5,6-Cl2	H	
1-251	Me, iBu	H, H	H	H	
1-252	Me, iBu	H, H	H	4-F	
1-253	Me, iBu	H, H	H	8-F	
1-254	Me, iBu	H, H	H	4-Cl	
1-255	Me, iBu	H, H	H	6-Cl	
1-256	Me, iBu	H, H	H	8-Cl	
1-267	Me, iBu	H, H	H	4-Me	
1-258	Me, iBu	H, H	H	8-Me	
1-261	Me, iBu	H, H	5-F	H	
1-262	Me, iBu	H, H	6-F	H	
1-263	Me, iBu	H, H	7-F	H	
1-264	Me, iBu	H, H	5-Cl	H	
1-265	Me, iBu	H, H	6-Cl	H	
1-266	Me, iBu	H, H	7-Cl	H	
1-267	Me, iBu	H, H	5-Br	H	
1-268	Me, iBu	H, H	6-Br	H	
1-269	Me, iBu	H, H	7-Br	H	
1-270	Me, iBu	H, H	5-I	H	
1-271	Me, iBu	H, H	5-Me	H	
1-286	Me, iBu	H, H	5-CN	H	
1-287	Me, iBu	H, H	5,6-F2	H	
1-288	Me, iBu	H, H	5,6-Cl2	H	
1-289	Me, tBu	H, H	H	H	
1-290	Me, tBu	H, H	5-F	H	
1-291	Me, tBu	H, H	5-Cl	H	
1-292	Me, tBu	H, H	5-Br	H	
1-293	Me, tBu	H, H	5-I	H	
1-294	Me, tBu	H, H	5-Me	H	
1-304	Me, tBu	H, H	5-CN	H	
1-305	Me, tBu	H, H	5,6-F2	H	
1-306	Me, tBu	H, H	5,6-Cl2	H	
1-307	Me, iPen	H, H	H	H	
1-308	Me, iPen	H, H	H	4-F	
1-309	Me, iPen	H, H	H	8-F	
1,310	Me, iPen	H, H	H	4-Cl	
1-311	Me, iPen	H, H	H	6-Cl	
1-312	Me, iPen	H, H	H	8-Cl	
1-313	Me, iPen	H, H	H	4-Me	
1-314	Me, iPen	H, H	H	8-Me	
1-317	Me, iPen	H, H	5-F	H	
1-318	Me, iPen	H, H	6-F	H	

ES 2 434 822 T3

Compuesto n°	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-319	Me, iPen	H, H	7-F	H	
1-320	Me, iPen	H, H	5-Cl	H	
1-321	Me, iPen	H, H	6-Cl	H	
1-322	Me, iPen	H, H	7-Cl	H	
1-323	Me, iPen	H, H	5-Br	H	
1-324	Me, iPen	H, H	6-Br	H	
1-325	Me, iPen	H, H	7-Br	H	
1-326	Me, iPen	H, H	5-I	H	
1-327	Me, iPen	H, H	5-Me	H	
1-342	Me, iPen	H, H	5-CN	H	
1-343	Me, iPen	H, H	5,6-F2	H	
1-344	Me, iPen	H, H	5,6-Cl2	H	
1-345	Et, Et	H, H	H	H	
1-346	Et, Et	H, H	H	4-F	
1-347	Et, Et	H, H	H	8-F	
1-348	Et, Et	H, H	H	4-Cl	
1-349	Et, Et	H, H	H	6-Cl	
1-350	Et, Et	H, H	H	8-Cl	
1-351	Et, Et	H, H	H	4-Me	
1-352	Et, Et	H, H	H	8-Me	
1-355	Et, Et	H, H	5-F	H	
1-356	Et, Et	H, H	6-F	H	
1-357	Et, Et	H, H	7-F	H	
1-358	Et, Et	H, H	5-Cl	H	
1-359	Et, Et	H, H	6-Cl	H	
1-360	Et, Et	H, H	7-Cl	H	
1-361	Et, Et	H, H	5-Br	H	
1-362	Et, Et	H, H	6-Br	H	
1-363	Et, Et	H, H	7-Br	H	
1-364	Et, Et	H, H	5-I	H	
1-365	Et, Et	H, H	5-Me	H	
1-380	Et, Et	H, H	5-CN	H	
1-381	Et, Et	H, H	5,6-F2	H	
1-382	Et, Et	H, H	5,6-Cl2	H	
1-383	Et, iBu	H, H	H	H	
1-384	Pr, Pr	H, H	H	H	
1-386	Me, ClCH2	H, H	H	H	
1-386	Me, Cl2CH	H, H	H	H	
1-387	Me, CF3	H, H	H	H	
1-388	Me, CF3	H, H	H	4-F	
1-389	Me, CF3	H, H	H	8-F	
1-390	Me, CF3	H, H	H	4-Cl	
1-391	Me, CF3	H, H	H	6-Cl	
1-392	Me, CF3	H, H	H	8-Cl	
1-393	Me, CF3	H, H	H	4-Me	
1-394	Me, CF3	H, H	H	8-Me	
1-397	Me, CF3	H, H	5-F	H	
1-398	Me, CF3	H, H	6-F	H	
1-399	Me, CF3	H, H	7-F	H	
1-400	Me, CF3	H, H	5-Cl	H	
1-401	Me, CF3	H, H	6-Cl	H	
1-402	Me, CF3	H, H	7-Cl	H	
1-403	Me, CF3	H, H	5-Br	H	
1-404	Me, CF3	H, H	6-Br	H	
1-405	Me, CF3	H, H	7-Br	H	
1-406	Me, CF3	H, H	5-I	H	
1-407	Me, CF3	H, H	5-Me	H	
1-422	Me, CF3	H, H	5-CN	H	
1-423	Me, CF3	H, H	5,6-F2	H	
1-424	Me, CF3	H, H	5,6-Cl2	H	
1-425	Me, CF3CH2	H, H	H	H	
1-426	Me, CF3CH2	H, H	H	4-F	
1-427	Me, CF3CH2	H, H	H	8-F	
1-428	Me, CF3CH2	H, H	H	4-Cl	
1-429	Me, CF3CH2	H, H	H	6-Cl	

ES 2 434 822 T3

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-430	Me, CF3CH2	H, H	H	8-Cl	
1-431	Me, CF3CH2	H, H	H	4-Me	
1-432	Me, CF3CH2	H, H	H	8-Me	
1-435	Me, CF3CH2	H, H	5-F	H	
1-438	Me, CF3CH2	H, H	6-F	H	
1-437	Me, CF3CH2	H, H	7-F	H	
1-438	Me, CF3CH2	H, H	5-Cl	H	
1-439	Me, CF3CH2	H, H	6-Cl	H	
1-440	Me, CF3CH2	H, H	7-Cl	H	
1-441	Me, CF3CH2	H, H	5-Br	H	
1-442	Me, CF3CH2	H, H	6-Br	H	
1-443	Me, CF3CH2	H, H	7-Br	H	
1-444	Me, CF3CH2	H, H	5-I	H	
1-445	Me, CF3CH2	H, H	5-Me	H	
1-460	Me, CF3CH2	H, H	5-CN	H	
1-461	Me, CF3CH2	H, H	6,8-F2	H	
1-462	Me, CF3CH2	H, H	5,6-Cl2	H	
1-463	ClCH2, ClCH2	H, H	H	H	
1-464	Me, Ph	H, H	H	H	
1-485	Me, Ph	H, H	H	4-F	
1-466	Me, Ph	H, H	H	8-F	
1-467	Me, Ph	H, H	H	4-Cl	
1-468	Me, Ph	H, H	H	6-Cl	
1-469	Me, Ph	H, H	H	8-Cl	
1-470	Me, Ph	H, H	H	4-Me	
1-471	Me, Ph	H, H	H	8-Me	
1-474	Me, Ph	H, H	5-F	H	
1-475	Me, Ph	H, H	6-F	H	
1-476	Me, Ph	H, H	7-F	H	
1-477	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	
1-478	Me, Ph	H, H	6-Cl	H	
1-479	Me, Ph	H, H	7-Cl	H	
1-480	Me, Ph	H, H	5-Br	H	
1-481	Me, Ph	H, H	6-Br	H	
1-482	Me, Ph	H, H	7-Br	H	
1-483	Me, Ph	H, H	5-I	H	
1-484	Me, Ph	H, H	5-Me	H	
1-499	Me, Ph	H, H	5-CN	H	
1-500	Me, Ph	H, H	5,6-F2	H	
1-501	Me, Ph	H, H	5,6-Cl2	H	
1-502	Me, 4FPh	H, H	H	H	
1-503	Me, 4FPh	H, H	H	4-F	
1-504	Me, 4FPh	H, H	H	8-F	
1-505	Me, 4FPh	H, H	H	4-Cl	
1-506	Me, 4FPh	H, H	H	6-Cl	
1-507	Me, 4FPh	H, H	H	8-Cl	
1-508	Me, 4FPh	H, H	H	4-Me	
1-509	Me, 4FPh	H, H	H	8-Me	
1-512	Me, 4FPh	H, H	5-F	H	
1-513	Me, 4FPh	H, H	6-F	H	
1-514	Me, 4FPh	H, H	7-F	H	
1-515	Me, 4FPh	H, H	5-Cl	H	
1-516	Me, 4FPh	H, H	6-Cl	H	
1-517	Me, 4FPh	H, H	7-Cl	H	
1-518	Me, 4FPh	H, H	5-Br	H	
1-519	Me, 4FPh	H, H	6-Br	H	
1-520	Me, 4FPh	H, H	7-Br	H	
1-521	Me, 4FPh	H, H	5-I	H	
1-522	Me, 4FPh	H, H	5-Me	H	
1-537	Me, 4FPh	H, H	5-CN	H	
1-538	Me, 4FPh	H, H	5,6-F2	H	
1-539	Me, 4FPh	H, H	5,6-Cl2	H	
1-540	Me, 4ClPh	H, H	H	H	
1-541	Me, 4ClPh	H, H	H	4-F	
1-542	Me, 4ClPh	H, H	H	8-F	

ES 2 434 822 T3

Compuesto n°	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-543	Me, 4CIPh	H, H	H	4-Cl	
1-544	Me, 4CIPh	H, H	H	6-Cl	
1-545	Me, 4CIPh	H, H	H	8-Cl	
1-546	Me, 4CIPh	H, H	H	4-Me	
1-547	Me, 4CIPh	H, H	H	8-Me	
1-550	Me, 4CIPh	H, H	5-F	H	
1-551	Me, 4CIPh	H, H	6-F	H	
1-552	Me, 4CIPh	H, H	7-F	H	
1-553	Me, 4CIPh	H, H	5-Cl	H	
1-554	Me, 4CIPh	H, H	6-Cl	H	
1-555	Me, 4CIPh	H, H	7-Cl	H	
1-556	Me, 4CIPh	H, H	5-Br	H	
1-557	Me, 4CIPh	H, H	6-Br	H	
1-558	Me, 4CIPh	H, H	7-Br	H	
1-559	Me, 4CIPh	H, H	5-I	H	
1-560	Me, 4CIPh	H, H	5-Me	H	
1-575	Me, 4CIPh	H, H	6-CN	H	
1-576	Me, 4CIPh	H, H	5,6-F2	H	
1-577	Me, 4CIPh	H, H	5,6-Cl2	H	
1-578	Ph, CF3	H, H	H	H	
1-579	Ph, CF3	H, H	5-F	H	
1-580	Ph, CF3	H, H	5-Cl	H	
1-581	Ph, CF3	H, H	5-Br	H	
1-582	Ph, CF3	H, H	5-I	H	
1-583	Ph, CF3	H, H	5-Me	H	
1-593	Ph, CF3	H, H	5-CN	H	
1-594	ClCH2, 4FPh	H, H	H	H	
1-595	ClCH2, 4FPh	H, H	H	4-F	
1-596	ClCH2, 4FPh	H, H	H	8-F	
1-597	ClCH2, 4FPh	H, H	H	4-Cl	
1-598	ClCH2, 4FPh	H, H	H	6-Cl	
1-599	ClCH2, 4FPh	H, H	H	8-Cl	
1-600	ClCH2, 4FPh	H, H	H	4-Me	
1-601	ClCH2, 4FPh	H, H	H	8-Me	
1-604	ClCH2, 4FPh	H, H	5-F	H	
1-605	ClCH2, 4FPh	H, H	6-F	H	
1-606	ClCH2, 4FPh	H, H	7-F	H	
1-607	ClCH2, 4FPh	H, H	5-Cl	H	
1-608	ClCH2, 4FPh	H, H	6-Cl	H	
1-609	ClCH2, 4FPh	H, H	7-Cl	H	
1-610	ClCH2, 4FPh	H, H	5-Br	H	
1-611	ClCH2, 4FPh	H, H	6-Br	H	
1-612	ClCH2, 4FPh	H, H	7-Br	H	
1-613	ClCH2, 4FPh	H, H	5-I	H	
1-614	ClCH2, 4FPh	H, H	5-Me	H	
1-629	ClCH2, 4FPh	H, H	5-CN	H	
1-630	ClCH2, 4FPh	H, H	5,6-F2	H	
1-631	ClCH2, 4FPh	H, H	5,6-Cl2	H	
1-632	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	H	
1-633	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	4-F	
1-634	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	8-F	
1-635	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	4-Cl	
1-636	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	6-Cl	
1-637	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	8-Cl	
1-638	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	4-Me	
1-639	ClCH2, 4CIPh	H, H	H	8-Me	
1-642	ClCH2, 4CIPh	H, H	5-F	H	
1-643	ClCH2, 4CIPh	H, H	6-F	H	
1-644	ClCH2, 4CIPh	H, H	7-F	H	
1-645	ClCH2, 4CIPh	H, H	5-Cl	H	
1-646	ClCH2, 4CIPh	H, H	6-Cl	H	
1-647	ClCH2, 4CIPh	H, H	7-Cl	H	
1-648	ClCH2, 4CIPh	H, H	5-Br	H	
1-649	ClCH2, 4CIPh	H, H	6-Br	H	
1-650	ClCH2, 4CIPh	H, H	7-Br	H	

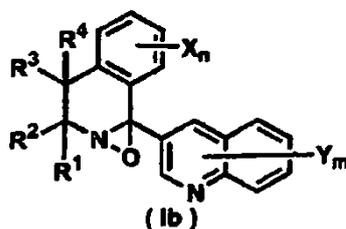
ES 2 434 822 T3

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-651	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-I	H	
1-652	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-Me	H	
1-667	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5-CN	H	
1-668	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5,6-F ₂	H	
1-669	ClCH ₂ , 4ClPh	H, H	5,6-Cl ₂	H	
1-792	Me, Me	H, H	H	H	sal de HCl
1-793	Me, Me	H, H	5-F	H	sal de HCl
1-794	Me, Me	H, H	5-Cl	H	sal de HCl
1-795	Me, Me	H, H	H	H	sal de H ₂ SO ₄
1-796	Me, Me	H, H	5-F	H	sal de H ₂ SO ₄
1-797	Me, Me	H, H	5-Cl	H	sal de H ₂ SO ₄
1-998	Me, Me	H, H	H	H	sal de HNO ₃
1-799	Me, Me	H, H	5-F	H	sal de HNO ₃
1-800	Me, Me	H, H	5-Cl	H	sal de HNO ₃
1-801	Me, Me	H, H	H	H	sal de (COOH) ₂
1-802	Me, Me	H, H	5-F	H	sal de (COOH) ₂
1-803	Me, Me	H, H	H	H	sal de MsOH
1-804	Me, Me	H, H	5-F	H	sal de MsOH
1-805	Me, Me	H, H	H	H	Salicilato
1-806	Me, Me	H, H	5-F	H	Salicilato
1-807	Me, Me	H, H	5-F	H	fumarato
1-808	Me, Et	H, H	H	H	sal de HCl
1-809	Me, Et	H, H	5-F	H	sal de HCl
1-810	Me, Et	H, H	5-Cl	H	sal de HCl
1-811	Me, Et	H, H	H	H	sal de H ₂ SO ₄
1-812	Me, Et	H, H	5-F	H	sal de H ₂ SO ₄
1-813	Me, Et	H, H	6-Cl	H	sal de H ₂ SO ₄
1-814	Me, Et	H, H	H	H	sal de HNO ₃
1-815	Me, Et	H, H	5-F	H	sal de HNO ₃
1-816	Me, Et	H, H	5-Cl	H	sal de HNO ₃
1-817	Me, Et	H, H	H	H	sal de (COOH) ₂
1-818	Me, Et	H, H	5-F	H	sal de (COOH) ₂
1-819	Me, Et	H, H	H	H	sal de MsOH
1-820	Me, Et	H, H	5-F	H	sal de MsOH
1-821	Me, Et	H, H	H	H	Salicilato
1-822	Me, Et	H, H	5-F	H	Salicilato
1-823	Me, Et	H, H	5-F	H	fumarato
1-824	Me, Pr	H, H	H	H	sal de HCl
1-825	Me, Pr	H, H	5-F	H	sal de HCl
1-826	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	sal de HCl
1-827	Me, Pr	H, H	H	H	sal de H ₂ SO ₄
1-828	Me, Pr	H, H	5-F	H	sal de H ₂ SO ₄
1-829	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	sal de H ₂ SO ₄
1-830	Me, Pr	H, H	H	H	sal de HNO ₃
1-831	Me, Pr	H, H	5-F	H	sal de HNO ₃
1-832	Me, Pr	H, H	5-Cl	H	sal de HNO ₃
1-833	Me, Pr	H, H	H	H	sal de (COOH) ₂
1-834	Me, Pr	H, H	5-F	H	sal de (COOH) ₂
1-835	Me, Pr	H, H	H	H	sal de MsOH
1-838	Me, Pr	H, H	5-F	H	sal de MsOH
1-837	Me, Pr	H, H	H	H	Salicilato
1-838	Me, Pr	H, H	5-F	H	Salicilato
1-839	Me, Pr	H, H	5-F	H	fumarato
1-840	Me, Ph	H, H	H	H	sal de HCl
1-841	Me, Ph	H, H	5-F	H	sal de HCl
1-842	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	sal de HCl
1-843	Me, Ph	H, H	H	H	sal de H ₂ SO ₄
1-844	Me, Ph	H, H	5-F	H	sal de H ₂ SO ₄
1-845	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	sal de H ₂ SO ₄
1-846	Me, Ph	H, H	H	H	sal de HNO ₃
1-847	Me, Ph	H, H	5-F	H	sal de HNO ₃
1-848	Me, Ph	H, H	5-Cl	H	sal de HNO ₃
1-849	Me, Ph	H, H	H	H	sal de (COOH) ₂
1-850	Me, Ph	H, H	5-F	H	sal de (COOH) ₂
1-851	Me, Ph	H, H	H	H	sal de MsOH

ES 2 434 822 T3

Compuesto n°	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym	Tipo de sal
1-852	Me, Ph	H, H	5-F	H	sal de MsOH
1-853	Me, Ph	H, H	H	H	Salicilato
1-854	Me, Ph	H, H	5-F	H	Salicilato
1-855	Me, Ph	H, H	5-F	H	fumarato
1-856	Me, Me	H, Me	H	H	
1-857	Me, Me	H, Me	5-F	H	
1-858	Me, Me	H, Me	5-Cl	H	
1-859	Me, Me	H, Et	H	H	
1-860	Me, Me	H, Et	5-F	H	
1-861	Me, Me	H, Et	5-Cl	H	
1-865	Me, Me	Me, Me	H	H	
1-866	Me, Me	Me, Me	5-F	H	
1-867	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H	
1-868	Me, Et	H, Me	H	H	
1-869	Me, Et	H, Me	5-F	H	
1-870	Me, Et	H, Me	5-Cl	H	
1-871	Me, Pr	H, Me	H	H	
1-872	Me, Pr	H, Me	5-F	H	
1-873	Me, Pr	H, Me	5-Cl	H	
1-874	Me, Ph	H, Me	H	H	
1-875	Me, Ph	H, Me	5-F	H	
1-876	Me, Ph	H, Me	5-Cl	H	
1-877	Me, Ph	Me, Me	H	H	
1-878	Me, Ph	Me, Me	5-F	H	
1-879	Me, Ph	Me, Me	5-Cl	H	
1-880	Me, Me	H, H	5-iPr	H	
1-881	Me, Me	H, H	5-CH(Me)CH ₂ CH ₃	H	
1-899	Me, Me	H, H	5-F	2-Me	
1-900	Me, Me	H, H	5-F	4-Me	
1-901	Me, Me	H, Me	6-F	2-Me	
1-902	Me, Me	H, Me	5-F	8-Me	
1-904	Me, Me	Me, Me	6-F	H	
1-905	Me, Me	Me, Me	7-F	H	
1-906	Me, Me	Me, Me	5-P	2-Me	
1-907	Me, Me	Me, Me	5-F	4-Me	
1-908	Me, Me	Me, Me	6-Cl	H	
1-909	Me, Me	Me, Me	7-Cl	H	
1-910	Me, Me	Me, Me	5-F	H	sal de HCl
1-911	Me, Me	Me, Me	5-F	H	sal de H ₂ SO ₄
1-912	Me, Me	Me, Me	5-F	H	sal de HNO ₃
1-913	Me, Me	Me, Me	6-F	H	sal de MsOH
1-914	Me, Me	Me, Me	5-Me	H	
1-915	Me, Me	Me, Me	6-Me	H	
1-916	Me, Me	Me, Me	7-Me	H	
1-917	Me, Me	Me, Me	5-F	6-F	
1-918	Me, Me	Me, Me	5-F	8-F	
1-919	Me, Me	Me, Me	5-F	8-Me	
1-927	Me, Me	H, F	5-F	H	
1-928	Me, Me	H, Cl	5-F	H	
1-929	Me, Me	F, F	H	H	
1-930	Me, Me	F, F	5-F	H	
1-940	Me, Me	F, F	6-F	H	
1-941	Me, Me	F, F	7-F	H	
1-942	Me, Me	F, F	5-Cl	H	
1-943	Me, Me	F, F	6-Cl	H	
1-944	Me, Me	F, F	7-Cl	H	
1-946	Me, Me	F, F	5-Br	H	
1-946	Me, Me	F, F	6-Br	H	
1-947	Me, Me	F, F	7-Br	H	
1-948	Me, Me	F, F	5-Me	H	
1-949	Me, Me	F, F	6-Me	H	
1-951	Me, Me	F, F	5,7-Cl ₂	H	
1-952	Me, Me	F, F	6-F,7-Me	H	

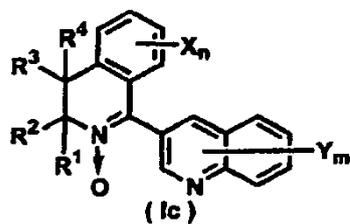
Tabla 2



Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
2-1	Me, Me	H, H	H	H
2-2	Me, Me	H, H	H	5-F
2-3	Me, Me	H, H	H	6-F
2-4	Me, Me	H, H	H	7-F
2-5	Me, Me	H, H	H	8-F
2-6	Me, Me	H, H	H	5-Cl
2-7	Me, Me	H, H	H	6-Cl
2-8	Me, Me	H, H	H	7-Cl
2-9	Me, Me	H, H	H	8-Cl
2-10	Me, Me	H, H	H	2-Me
2-11	Me, Me	H, H	H	4-Me
2-12	Me, Me	H, H	H	5-Me
2-13	Me, Me	H, H	H	6-Me
2-14	Me, Me	H, H	H	7-Me
2-15	Me, Me	H, H	H	8-Me
2-20	Me, Me	H, H	5-F	H
2-21	Me, Me	H, H	5-F	5-F
2-22	Me, Me	H, H	5-F	6-F
2-23	Me, Me	H, H	5-F	7-F
2-24	Me, Me	H, H	5-F	8-F
2-25	Me, Me	H, H	5-F	5-Cl
2-26	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl
2-27	Me, Me	H, H	5-F	7-Cl
2-28	Me, Me	H, H	5-F	8-Cl
2-29	Me, Me	H, H	5-F	2-Me
2-30	Me, Me	H, H	5-F	4-Me
2-31	Me, Me	H, H	5-F	5-Me
2-32	Me, Me	H, H	5-F	6-Me
2-33	Me, Me	H, H	5-F	7-Me
2-34	Me, Me	H, H	5-F	8-Me
2-39	Me, Me	H, H	6-F	H
2-40	Me, Me	H, H	7-F	H
2-41	Me, Me	H, H	8-F	H
2-42	Me, Me	H, H	5-Cl	H
2-43	Me, Me	H, H	6-Cl	H
2-44	Me, Me	H, H	7-Cl	H
2-45	Me, Me	H, H	7-Me	H
2-46	Me, Me	H, H	8-Me	H
2-47	Me, Me	H, H	5-Et	H
2-53	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	H
2-54	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H
2-55	Me, Me	H, H	H	H
2-56	Me, Me	H, Me	H	H
2-57	Me, Me	H, Me	H	5-F
2-58	Me, Me	H, Me	H	6-F
2-59	Me, Me	H, Me	H	7-F
2-60	Me, Me	H, Me	H	8-F
2-61	Me, Me	H, Me	H	2-Me
2-62	Me, Me	H, Me	H	4-Me
2-63	Me, Me	H, Me	H	8-Me
2-65	Me, Me	H, Me	5-F	H
2-66	Me, Me	H, Me	5-F	5-F
2-67	Me, Me	H, Me	5-F	6-F

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
2-68	Me, Me	H, Me	5-F	7-F
2-69	Me, Me	H, Me	5-F	8-F
2-70	Me, Me	H, Me	5-F	2-Me
2-71	Me, Me	H, Me	5-F	4-Me
2-72	Me, Me	H, Me	5-F	8-Me
2-74	Me, Me	H, Me	6-F	H
2-75	Me, Me	H, Me	7-F	H
2-76	Me, Me	H, Me	8-F	H
2-77	Me, Me	H, Me	5-Cl	H
2-78	Me, Me	H, Me	6-Cl	H
2-79	Me, Me	H, Me	7-Cl	H
2-80	Me, Me	H, Me	8-Cl	H
2-81	Me, Me	H, Me	5-Me	H
2-82	Me, Me	H, Me	6-Me	H
2-83	Me, Me	H, Me	7-Me	H
2-84	Me, Me	H, Me	8-Me	H
2-89	Me, Me	H, Me	5,6-F ₂	H
2-90	Me, Me	H, Me	6-F,7-Me	H
2-91	Me, Me	Me, Me	H	H
2-92	Me, Me	Me, Me	H	5-F
2-93	Me, Me	Me, Me	H	6-F
2-94	Me, Me	Me, Me	H	7-F
2-95	Me, Me	Me, Me	H	8-F
2-96	Me, Me	Me, Me	H	2-Me
2-97	Me, Me	Me, Me	H	4-Me
2-98	Me, Me	Me, Me	H	8-Me
2-100	Me, Me	Me, Me	5-F	H
2-101	Me, Me	Me, Me	5-F	5-F
2-102	Me, Me	Me, Me	5-F	6-F
2-103	Me, Me	Me, Me	5-F	7-F
2-104	Me, Me	Me, Me	5-F	8-F
2-105	Me, Me	Me, Me	5-F	2-Me
2-106	Me, Me	Me, Me	5-F	4-Me
2-107	Me, Me	Me, Me	5-F	8-Me
2-109	Me, Me	Me, Me	6-F	H
2-110	Me, Me	Me, Me	7-F	H
2-111	Me, Me	Me, Me	8-F	H
2-112	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H
2-113	Me, Me	Me, Me	6-Cl	H
2-114	Me, Me	Me, Me	7-Cl	H
2-115	Me, Me	Me, Me	8-Cl	H
2-116	Me, Me	Me, Me	5-Me	H
2-117	Me, Me	Me, Me	6-Me	H
2-118	Me, Me	Me, Me	7-Me	H
2-119	Me, Me	Me, Me	8-Me	H
2-124	Me, Me	Me, Me	5,6-F ₂	H
2-125	Me, Me	Me, Me	6-F,7-Me	H
2-132	Me, Me	H, F	5-F	H
2-133	Me, Me	H, Cl	5-F	H
2-134	Me, Me	F, F	H	H
2-135	Me, Me	F, F	5-F	H

Tabla 3



Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
--------------	--------	--------	----	----

ES 2 434 822 T3

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
3-1	Me, Me	H, H	H	H
3-2	Me, Me	H, H	H	5-F
3-3	Me, Me	H, H	H	6-F
3-4	Me, Me	H, H	H	7-F
3-5	Me, Me	H, H	H	8-F
3-6	Me, Me	H, H	H	5-Cl
3-7	Me, Me	H, H	H	6-Cl
3-8	Me, Me	H, H	H	7-Cl
3-9	Me, Me	H, H	H	8-Cl
3-10	Me, Me	H, H	H	2-Me
3-11	Me, Me	H, H	H	4-Me
3-12	Me, Me	H, H	H	5-Me
3-13	Me, Me	H, H	H	6-Me
3-14	Me, Me	H, H	H	7-Me
3-15	Me, Me	H, H	H	8-Me
3-20	Me, Me	H, H	5-F	H
3-21	Me, Me	H, H	5-F	5-F
3-22	Me, Me	H, H	5-F	6-F
3-23	Me, Me	H, H	5-F	7-F
3-24	Me, Me	H, H	5-F	8-F
3-25	Me, Me	H, H	5-F	5-Cl
3-26	Me, Me	H, H	5-F	6-Cl
3-27	Me, Me	H, H	5-F	7-Cl
3-28	Me, Me	H, H	5-F	8-Cl
3-29	Me, Me	H, H	5-F	2-Me
3-30	Me, Me	H, H	5-F	4-Me
3-31	Me, Me	H, H	5-F	5-Me
3-32	Me, Me	H, H	5-F	6-Me
3-33	Me, Me	H, H	5-F	7-Me
3-34	Me, Me	H, H	5-F	8-Me
3-39	Me, Me	H, H	6-F	H
3-40	Me, Me	H, H	7-F	H
3-41	Me, Me	H, H	8-F	H
3-42	Me, Me	H, H	5-Cl	H
3-43	Me, Me	H, H	6-Cl	H
3-44	Me, Me	H, H	7-Cl	H
3-45	Me, Me	H, H	7-Me	H
3-46	Me, Me	H, H	8-Me	H
3-47	Me, Me	H, H	5-Et	H
3-53	Me, Me	H, H	5,6-F ₂	H
3-54	Me, Me	H, H	6-F,7-Me	H
3-55	Me, Me	H, H	H	H
3-56	Me, Me	H, Me	H	H
3-57	Me, Me	H, Me	H	5-F
3-58	Me, Me	H, Me	H	6-F
3-59	Me, Me	H, Me	H	7-F
3-60	Me, Me	H, Me	H	8-F
3-61	Me, Me	H, Me	H	2-Me
3-62	Me, Me	H, Me	H	4-Me
3-63	Me, Me	H, Me	H	8-Me
3-65	Me, Me	H, Me	5-F	H
3-66	Me, Me	H, Me	5-F	5-F
3-67	Me, Me	H, Me	5-F	6-F
3-68	Me, Me	H, Me	5-F	7-F
3-69	Me, Me	H, Me	5-F	8-F
3-70	Me, Me	H, Me	5-F	2-Me
3-71	Me, Me	H, Me	5-F	4-Me
3-72	Me, Me	H, Me	5-F	8-Me
3-74	Me, Me	H, Me	6-F	H
3-75	Me, Me	H, Me	7-F	H
3-76	Me, Me	H, Me	8-F	H
3-77	Me, Me	H, Me	5-Cl	H
3-78	Me, Me	H, Me	6-Cl	H
3-79	Me, Me	H, Me	7-Cl	H
3-80	Me, Me	H, Me	8-Cl	H

Compuesto nº	R1, R2	R3, R4	Xn	Ym
3-81	Me, Me	H, Me	5-Me	H
3-82	Me, Me	H, Me	6-Me	H
3-83	Me, Me	H, Me	7-Me	H
3-84	Me, Me	H, Me	8-Me	H
3-89	Me, Me	H, Me	5,6-F ₂	H
3-90	Me, Me	H, Me	6-F,7-Me	H
3-91	Me, Me	Me, Me	H	H
3-92	Me, Me	Me, Me	H	5-F
3-93	Me, Me	Me, Me	H	6-F
3-94	Me, Me	Me, Me	H	7-F
3-95	Me, Me	Me, Me	H	8-F
3-96	Me, Me	Me, Me	H	2-Me
3-97	Me, Me	Me, Me	H	4-Me
3-98	Me, Me	Me, Me	H	8-Me
3-100	Me, Me	Me, Me	5-F	H
3-101	Me, Me	Me, Me	5-F	5-F
3-102	Me, Me	Me, Me	5-F	6-F
3-103	Me, Me	Me, Me	5-F	7-F
3-104	Me, Me	Me, Me	5-F	8-F
3-105	Me, Me	Me, Me	5-F	2-Me
3-106	Me, Me	Me, Me	5-F	4-Me
3-107	Me, Me	Me, Me	5-F	8-Me
3-109	Me, Me	Me, Me	6-F	H
3-110	Me, Me	Me, Me	7-F	H
3-111	Me, Me	Me, Me	8-F	H
3-112	Me, Me	Me, Me	5-Cl	H
3-118	Me, Me	Me, Me	6-Cl	H
3-114	Me, Me	Me, Me	7-Cl	H
3-115	Me, Me	Me, Me	8-Cl	H
3-116	Me, Me	Me, Me	5-Me	H
3-117	Me, Me	Me, Me	6-Me	H
3-118	Me, Me	Me, Me	7-Me	H
3-119	Me, Me	Me, Me	8-Me	H
3-124	Me, Me	Me, Me	5,6-F ₂	H
3-125	Me, Me	Me, Me	8-F,7-Me	H
3-130	Me, Et	H, H	5-F	H
3-132	Me, Me	H, F	5-F	H
3-133	Me, Me	H, Cl	5-F	H
3-134	Me, Me	F, F	H	H
3-135	Me, Me	F, F	5-F	H

- Un compuesto preferible entre los compuestos anteriormente citados es, un compuesto entre los Compuestos de nº 1-32: 3-(5-fluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidro-isoquinolin-1-il) quinolina,
- 5 un compuesto entre los Compuestos de nº 1-44: 3-(5-cloro-3,3-dimetil-3,4-dihidro-isoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-56: 3-(5-bromo-3,3-dimetil-3,4-dihidro-isoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-117: 3-(5, 6-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-185: 3-(5-fluoro-3-metil-3-propil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-387: 3-(3-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidroisoquinoun-1-il) quinolina,
- 10 un compuesto entre los Compuestos de nº 1-425: 3-[3-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroisoquinolin-1-il] quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-502: 3-[3-metil-3-(4-fluorofenil)-3,4-dihidroisoquinolin-1-il] quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-865: 3-(3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidro-isoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-866: 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-918: 8-fluoro-3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetra-metil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,
- 15 un compuesto entre los Compuestos de nº 1-919: 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)-8-metilquinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-929: 3-(4, 4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 1-930: 3-(4, 4, 5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 2-91: 3,3,4,4-tetrametil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,
- 20 un compuesto entre los Compuestos de nº 2-100: 5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,
- un compuesto entre los Compuestos de nº 2-134: 4, 4-difluoro-3,3-dimetil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxezireno [3, 2-a] isoquinolina,
- 25 un compuesto entre los Compuestos de nº 2-135: 4, 4, 5-trifluoro-3,3-dimetil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-

oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,

un compuesto entre los Compuestos de nº 3-100: 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

un compuesto entre los Compuestos de nº 3-109: 3-(6-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

un compuesto entre los Compuestos de nº 3-134: 3-(4, 4-difluoro-3,3-dimetil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

o un compuesto entre los Compuestos de nº 3-135: 3-(4, 4, 5-trifluoro-3,3-dimetil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina.

Los compuestos (Ia), (Ib) o (Ic) de la presente invención son compuestos conocidos públicamente, y se fabrican, por ejemplo, de acuerdo con los métodos divulgados en el panfleto de la publicación internacional WO 2005/070917 o método similar al mismo.

Los compuestos (Ia), (Ib) y (Ic) de la presente invención son útiles como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas contra varios patógenos de plantas en agricultura y horticultura. Por ejemplo, como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas, muestran efectos superiores de precaución y/o preventivos contra varios patógenos de plantas en agricultura y horticultura. Muestran efectos superiores preventivos contra varias enfermedades, incluyendo por ejemplo plagas del arroz, enfermedad bakanae en los cultivos de arroz, fusariosis del trigo y plaga de las semillas de trigo, plaga de las semillas por Rhizoctonia y podredumbre inducida por Pythium en el pepino, fusariosis del pepino, podredumbre inducida por Pythium en el tomate. Puesto que los compuestos de la presente invención muestran superiores efectos preventivos (de precaución), pueden evitar las enfermedades por tratamiento antes de la infección.

En la presente invención, el tratamiento del suelo significa pulverizar la superficie del suelo, inyectar en el suelo, empapar el suelo o mezclar con el suelo, una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo. Al tratar el suelo mediante una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo, las plantas pueden quedar protegidas de la infección por patógenos del suelo y de la infección aérea. Pulverizar la superficie del suelo, empapar el suelo o mezclar con el suelo, se puede llevar a cabo antes o en el momento de la siembra a través del crecimiento de plantas.

En la presente invención, el tratamiento de las semillas significa tratar las semillas pulverizando una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo sobre las semillas de las plantas, el tratamiento de las semillas por revestimiento mediante una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo sobre las semillas de las plantas, el tratamiento de las semillas por inmersión de las semillas de las plantas en una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo o tratando las semillas mediante revestimiento por empolvado de una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo. Al tratar las semillas con una composición que comprende compuestos de la presente invención como principio activo, se espera que se puedan obtener los efectos preventivos de las semillas contra los patógenos adheridos y contra los patógenos que infectan de manera inherente el interior de las semillas, así como efectos preventivos contra los brotes de enfermedad contra el patógeno (patógenos del suelo etc.), brotes que se observan tras la siembra.

La cantidad en las aplicaciones y la concentración de las aplicaciones puede variar dependiendo de la cosecha prevista, enfermedad prevista, grado de la enfermedad, forma farmacéutica del compuesto, métodos de aplicaciones y diferentes condiciones ambientales. En el caso en que las semillas se desinfecten, la cantidad de compuestos de la presente invención que se utiliza es habitualmente de 0,001 a 50 g por kg de semillas, preferentemente de 0,01 a 10 g por kg. En el caso del tratamiento del suelo, la cantidad de compuestos de la presente invención que se utiliza es habitualmente de 20 a 20.000 g por ha, preferentemente de 100 a 10.000 g por ha. En el caso donde el suelo se trata pulverizando su superficie, se trata mediante inyección en el mismo o se trata empapando el mismo, el tratamiento se puede llevar a cabo usando una composición que comprende los propios compuestos de la presente invención o tras diluir la composición hasta una concentración deseable. En el caso en que una composición que comprende compuestos de la presente invención se fabrique para entrar en contacto con las semillas de las plantas, las semillas de las plantas se pueden sumergir en el agente como tal. Además, una composición que comprende compuestos de la presente invención se puede usar como tal o tras su dilución hasta una concentración deseable, por inmersión de las semillas de las plantas en su interior, o por empolvado, pulverizando o revistiendo las semillas de las plantas con la composición. En el caso en que las semillas se traten mediante revestimiento por empolvado, pulverizando o revistiendo, la cantidad de la composición utilizada (contenido de los compuestos de la presente invención es de 10 % en peso hasta el 70 % en peso) es habitualmente de aproximadamente 0,05 a aproximadamente 50 % en peso de las semillas de la planta secas, preferentemente de 0,1 a 30 %, y dichas cantidades usadas no están limitadas en el intervalo, y pueden diferir dependiendo de las formas de las formulaciones y de los tipos de semillas de plantas como sujetos de tratamiento.

En la presente invención, semillas de plantas significan aquella parte que almacena nutrientes para que el embrión de la planta pueda germinar y utilizarse en la propagación agrícola, incluyendo específicamente semillas de maíz, soja, algodón, arroz, remolacha azucarera, trigo, cebada, girasol, tomate, pepino, berenjena, espinaca, arveja, calabaza, caña de azúcar, tabaco, pimienta verde, coles, etc.; semillas de aroides tuberosas, patata, batata, konjaku, etc.; bulbos de lirios comestibles, tulipanes, etc.; o semillas y bulbos de rakkyo, etc., y adicionalmente incluye semillas y similares que se han sometido a transformación genética, incluidas las semillas de soja, maíz, algodón,

etc., a las que se ha provisto de propiedades resistentes a herbicidas; semillas de arroz, tabaco, etc., adaptables a regiones frías; o semillas de maíz, algodón, patata, etc., de propiedades de producción de sustancias insecticidas, que son plantas que se han generado por manipulación artificial de genes y similares y no existen originalmente en la naturaleza. Aquí, la presente invención no está limitada a estas.

5 Cuando se usan los compuestos de la presente invención, de una manera similar al caso de las formulaciones agroquímicas convencionales, los compuestos se pueden formular en diferentes tipos de formulaciones (composiciones), incluyendo emulsiones, polvos, polvos que se pueden humedecer, disoluciones, gránulos, suspensiones, junto con adyuvantes (incluyendo portadores). Con respecto al uso real de dichas formulaciones, se
10 pueden usar como tales, o bien se pueden diluir hasta una concentración predeterminada mediante diluyentes tales como el agua.

15 El adyuvante utilizado puede ser un portador, emulsionante, agente suspensor, agente dispersante, agente diseminador, agente de penetración, agente de humedecimiento, agente espesante, agente estabilizante y similares, y se pueden añadir según sea necesario.

20 El portador utilizado se puede clasificar en un portador sólido y un portador líquido. El portador sólido puede ser un polvo animal o vegetal tal como almidón, azúcar, polvo de celulosa, ciclodextrina, carbón activo, polvo de soja, harina de trigo, granza, pasta de madera, harina de pescado y leche en polvo; o polvos minerales tales como talco, caolín, bentonita, bentonita orgánica, carbonato de calcio, sulfato de calcio, bicarbonato de sodio, zeolita, tierra de diatomeas, caoíta, arcilla, alúmina, sílice y polvo de azufre. El portador líquido puede ser agua; aceites animales o vegetales tales como aceite de soja, aceite de algodón y aceite de maíz; alcoholes tales como alcohol etílico y etilenglicol; cetonas tales como acetona y metil etil cetona; éteres tales como dioxano y tetrahidrofurano; hidrocarburos alifáticos/aromáticos tales como queroseno, aceite de lámparas, parafina líquida, xileno,
25 trimetilbenceno, tetrametilbenceno, ciclohexano, nafta disolvente; hidrocarburos halogenados tales como cloroformo y clorobenceno; amidas ácidas tales como dimetilformamida; ésteres tales como acetato de etilo y ésteres de glicerina de ácidos grasos; nitrilos tales como acetonitrilo; compuestos que contienen azufre tales como dimetilsulfóxido; o N-metilpirrolidona.

30 La relación en peso con respecto a la formulación del compuesto de la presente invención y el adyuvante es habitualmente de 0,05:99,95 a 90: 10, preferentemente 0,2:99,8 a 80:20.

35 El compuesto de la presente invención se puede usar combinado o junto con otros agroquímicos tales como fungicidas y agentes antivíricos según sea necesario.

Los fungicidas usados pueden ser, por ejemplo, compuestos de pirimidinamina tales como 2-anilino-4-metil-6-(1-propinil) pirimidina (nombre común: mepaniprim) y 4, 6-dimetil-N-fenil-2-pirimidinamina (nombre común: pirimetanilo); compuestos de azol tales como 1-(4-clorofenoxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il) butanona (nombre común: triadimefon), 1-(bifenil-4-iloxi)-3,3-dimetil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il) butan-2-ol (nombre común: bitertanol), 1-{N-(4-cloro-2-trifluorometilfenil)-2-propoxi-acetimidoidil} imidazol (nombre común: triflumizol), 1-{2-(2,4-diclorofenil)-4-etil-1,3-dioxolan-2-ilmetil}-1H-1,2,4-triazol (nombre común: etaconazol), 1-{2-(2,4-diclorofenil)-4-propil-1,3-dioxolan-2-ilmetil}-1H-1,2,4-triazol (nombre común: propiconazol), 1-{2-(2,4-diclorofenil) pentil}-1H-1,2,4-triazol (nombre común: penconazol), bis (4-fluorofenil) (metil) (1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil) silano (nombre común: flusilazol), 2-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)-hexanenitrilo (nombre común: miclobutanilo), (2RS, 3RS)-2-(4-clorofenil)-3-ciclo-propil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il) butan-2-ol (nombre común: ciproconazol), (RS)-1-(4-clorofenil)-4, 4-dimetil-3-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil) pentan-3-ol (nombre común: terbuconazol), (RS)-2-(2,4-diclorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il) hexan-2-ol (nombre común: hexaconazol), (2RS, 5RS)-5-(2,4-diclorofenil) tetrahidro-5-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)-2-furil 2,2,2-trifluoroetil éter (nombre común: furconazol-cis), N-propil-N-{2-(2,4,6-trichlorophenoxi) etil} imidazol-1-carboxamida (nombre común: procloraz) y 2-(4-fluorofenil)-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-3-trimetilsilil-propan-2-ol (nombre común: simeconazol); compuestos de quinoxalina tales como 6-metil-1,3-ditiolo [4,5-b] quinoxalin-2-ona (nombre común: quinometionato); compuestos de ditiocarbamato tales como polímero de manganeso etilenbis (ditiocarbamato) (nombre común: maneb), polímero de cinc etilenbis (ditiocarbamato) (nombre común: zineb), producto de coordinación de cinc (Zn) y manganeso etilenbis (ditiocarbamato) (maneb) (nombre común: manzeb), dizinc bis (dimetilditiocarbamato) etilenbis (ditiocarbamato) (nombre común: policarbamato) y polímero de cinc propilenbis (ditiocarbamato) (nombre común: probineb); compuestos de cloro orgánico tales como 4, 5, 6, 7-tetra-cloroftalida (nombre común: ftalide), tetracloroboftalonitrilo (nombre común: clorotalonilo) y pentacloronitrobenzoceno (nombre común: quintozene); compuestos de bencimidazol tales como 1-(butilcarbamoil) benzimidazol-2-il carbamato de metilo (nombre común: benomil), dimetil 4,4'-(o-fenileno) bis (3-tioalofanato) (nombre común: tianatemetilo) y carbamato de metilbenzimidazol-2-ilo (nombre común: carbendazim); compuestos de piridinamina tales como 3-cloro-N-(3-cloro-2, 6-dinitro-4- α , α , α , -trifluorotolil)-5-trifluorometil-2-piridinamina (nombre común: fluazinam); compuestos de cianoacetamida tales como 1-(2-ciano-2-metoxiiminoacetil)-3-etil urea (nombre común: cymoxanil); compuestos de fenilamida tales como metil N-(2-metoxi-acetil)-N-(2, 6-xilil)-DL-alaninato (nombre común: metalaxil), 2-metoxi-N-(2-oxo-1,3-oxazolidin-3-il) aceto-2', 6'-xilidida (nombre común: oxadixil), (6)- α -(2-cloro-N-(2, 6-xililacetamida)- γ -butirolactona (nombre común: ofurace), metil N-fenilacetil-N-(2, 6-xilil)-DL-alaninato (nombre común: benalaxil), metil N-(2-furoil)-N-(2, 6-xilil)-DL-alaninato (nombre común: furalaxil) and (6)- α -[N-(3-clorofenil) ciclopropanecarboxamida]- γ -butirolactona (nombre común: cyprofuram); compuestos de ácido sulfénico tales como

N-diclorofluorometiltio-N',N'-dimetil-N-fenil sulfamida (nombre común: dichlofluanid); compuestos de cobre tales como el hidróxido cúprico (nombre común: hidróxido cúprico) y 8-quinolato de cobre (nombre común: oxina cobre); compuestos de isoxazol tales como 5-metilisoxazol-3-ol (nombre común: hidroxiiisoxazol); compuestos organosfosforados tales como aluminum tris (etilfosfonato) (nombre común: fusetil aluminio), O-2, 6-dicloro-p-tolil-O, O-dimetilfosforotioato (nombre común: tolclofos-metil), S-bencil O, O-diisopropilfosforotioato, O-etil S, S-difenilfosforoditioato y hidrogenofosfato de aluminio y etilo; compuestos de N-halogenotioalquilo tales como N-(triclorometiltio) ciclohexi-4-eno-1, 2-dicarboximida (nombre común: captan), N-(1, 1, 2, 2-tetracloroetil) ciclohexi-4-eno-1, 2-dicarboximida (nombre común: captafol) y N-(triclorometiltio) ftalimida (nombre común: folpet); compuestos de dicarboximida tales como N-(3,5-dicloro-fenil)-1, 2-dimetilciclopropan-1, 2-dicarboximida (nombre común: procymidone), 3-(3,5-diclorofenil)-N-isopropopil-2,4-dioxoimidazolidina-1-carboxamida (nombre común: iprodione) y (RS)-3-(3,5-diclorofenil)-5-metil-5-vinil-1,3-oxazolidina-2,4-diona (nombre común: vinclozolin); compuestos de benzanilida tales como α, α, α -trifluoro-3'-isopropoxi-o-toluanilida (nombre común: flutolanil) y 3'-isopropoxi-o-toluanilida (nombre común: mepronil); compuestos de piperazina tales como N, N'-[piperazin-1, 4-diilbis{(triclorometil) metileno}] diformamida (nombre común: triforine); compuestos de piridina tales como 2', 4'-dicloro-2-(3-piridil) acetofenona O-metiloime (nombre común: pirifenox); compuestos de carbinol tales como alcohol (6)-2, 4'-dicloro- α -(pirimidin-5-il) benzohidrilo (nombre común: fenarimol) y alcohol (6)-2, 4'-difluoro- α -(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil) benzohidrilo (nombre común: flutriafol); compuestos de piperidina tales como (RS)-1-{3-(4-t-butilfenil)-2-metilpropil} piperidina (nombre común: fenpropidine); compuestos de morfolina tales como (6)-cis-4-{3-(4-t-butilfenil)-2-metilpropil}-2, 6-dimetilmorfolina (nombre común: fenpropimorph); compuestos organoestánicos tales como hidróxido de trifenilestaño (nombre común: hidróxido de fentino) y acetato de trifeniltino (nombre común: acetato de fentino) compuestos de urea tales como 1-(4-cloro-benzil)-1-ciclopentil-3-fenilurea (nombre común: pencycuron); compuestos de ácido esteárico cinámico tales como (E,Z) 4-{3-(4-clorofenil)-3-(3,4-dimetoxipenil) acriloi} morfolina (nombre común: dimethomorph); compuestos de fenilcarbamato tales como 3,4-dietoxicarbanilato de isopropilo (nombre común: diethofencarb); o compuestos de cianopirrol tales como 3-ciano-4-(2, 2-difluoro-1,3-benzodioxol-4-il) pirrol (nombre común: fludioxonil) y 3-(2',3'-diclorofenil)-4-ciano-pirrol (nombre común: fencpiclonil); y los agentes antivirales pueden ser un agente BT o un agente vírico de una enfermedad de insecto.

[Ejemplos]

30 La presente invención se va a describir detalladamente con referencia a los siguientes Ejemplos, pero la presente invención no está limitada a los citados.

Aquí, cada uno de los compuestos entre los Compuestos de nº 1-32, 1-44,1-56, 1-117, 1-185, 1-387, 1-425, 1-502, 1-865, 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-91, 2-100, 2-134, 2-135, 3-100, 3-109, 3-134 y 3-135 usados en los Ejemplos se han descrito, respectivamente, como Ejemplos 2, 18, 22, 52, 58, 68, 69, 72, 122, 114, 164, 165, 177, 178, 196, 193, 237, 203, 204, 209, 218 y 219 de la Publicación internacional WO 2005/070917.

Ejemplo 1

40 Ensayo de tratamiento en el momento de la siembra o el momento del trasplante (plaga del arroz)

Cada suelo de una caja de vivero para plantas de ensayo (arroz: Sachikaze) se trató en el momento de la siembra o en el momento del trasplante con la disolución de polvos humedecibles que contenía el compuesto de la presente invención disuelto en agua de forma que la tasa de aplicación fuera de 400 g a.i./10 a. Las plantas de ensayo se cultivaron durante una semana. Una suspensión de esporas de plaga del arroz se inoculó mediante pulverización de la suspensión sobre las plantas de ensayo cultivadas utilizando el método anterior. Las macetas se instalaron en una sala de inoculación, cuya temperatura ambiente era de 20-23°C, y se estimuló la infección con la enfermedad. Se observó la gravedad de la enfermedad 7 días después de la inoculación. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado.

50 Aquí, la gravedad de la enfermedad de las plantas de ensayo se observó a simple vista, puntuada de acuerdo con los siguientes criterios y expresada (en 4 niveles de 0 a 3 donde la gravedad de la enfermedad en las plantas no tratadas fue de 3).

55 Gravedad de la enfermedad:

- 0 (Sin lesión debida a la enfermedad)
- 1 (Lesión debida a la enfermedad inferior al 40 % de la zona no tratada)
- 2 (Lesión debida a la enfermedad del 40 % o más a menos del 80 %)
- 60 3 (Lesión debida a la enfermedad del 80 % o más)

De acuerdo con los resultados de los ensayos, la severidad de la enfermedad fue 0, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-32, 1-44, 1-56, 1-117, 1-185, 1-387, 1-425, 1-502, 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-91,3-100, 3-109, 3-134 o 3-135.

65

Ejemplo 2

Ensayo de prevención de la enfermedad en el suelo (fusariosis del pepino)

5 Semillas de plantas cultivadas en maceta (Sagamihanpaku) se sembraron en un suelo inoculado que se ajustó de manera que las esporas de la fusariosis del pepino estuviesen diseminadas a una tasa de 1×10^5 por 1 g de suelo. En el momento de la siembra, se empapó el suelo con la disolución de polvos humedecibles que contenía el compuesto de la presente invención disuelto en agua a una tasa de 10.000 g/ha. Se observó la gravedad de la enfermedad después de 3 semanas de tratamiento. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado. Aquí, la gravedad de la enfermedad de las plantas de ensayo se observó a simple vista, se juzgó de acuerdo con los siguientes criterios, y se expresó (en 4 niveles de 0 a 3 donde la gravedad de la enfermedad en las plantas no tratadas fue de 3).

Gravedad de la enfermedad:

- 15
- 0 (Ausencia de síntomas)
 - 1 (Amarilleamiento)
 - 2 (Marchitez)
 - 3 (Muerte)

20 De acuerdo con los resultados de los ensayos, el grado de severidad de la enfermedad fue 0, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 o 3-135.

Ejemplo 3

25 Ensayo de desinfección de semillas (plaga del arroz, enfermedad "Bakanae" en los cultivos de arroz)

30 20 g de semillas humedecidas de plantas de ensayo (semillas de Sachikaze o Tanginbouzu: inoculadas con plaga del arroz o la enfermedad bakanae en los cultivos de arroz,) se revistieron con los polvos humedecibles que contenían el compuesto de la presente invención de forma que la tasa de aplicación fuera de 0,02 % a.i., a los que se habían añadido 20 ml de agua destilada y se incubaron durante 1 día a 25 °C. Las plantas de ensayo tratadas de acuerdo con el método anterior se cultivaron en macetas durante 3 semanas. y se observó la gravedad de la enfermedad. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado. El efecto de prevención se juzgó de acuerdo con los siguientes criterios. Con respecto a las semillas infectadas con la plaga del arroz, se observaron el número de lesiones con respecto a la tasa de germinación, y se calculó la tasa de infección. El valor de prevención se calculó tomando una tasa de infección de las plantas no tratadas de 100. De acuerdo con los resultados del ensayo, el valor de prevención fue de 80 o mayor, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-32, 1-866, 1-929, 1-930, 2-100, 2-134, 2-135, 3-100, 3-134 o 3-135. Con respecto a las semillas infectadas con la enfermedad "Bakanae", se observaron el número semillas enfermas y la tasa de germinación, y se calculó la tasa de infección. El valor de prevención se calculó tomando una tasa de infección de las plantas no tratadas de 100. De acuerdo con los resultados del ensayo, el valor de prevención fue de 80 o mayor, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-32, 1-865, 1-866, 1-929, 1-930, 3-100, 3-134 o 3-135.

Ejemplo 4

45 Ensayo de tratamiento de semillas (fusariosis de las semillas de trigo)

50 20 g de semillas humedecidas (semillas inoculadas con fusariosis de las semillas de trigo) de plantas de ensayo (Nourin 61 gou) se revistieron con los polvos humedecibles que contenían el compuesto de la presente invención de forma que la tasa de aplicación fuera de 0,1 % a.i. Las semillas (30 granos) tratadas por el método anterior se sembraron, y se observó la gravedad de la enfermedad después de 2 semanas. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado.

55 Aquí, la gravedad de la enfermedad de las plantas de ensayo se observó a simple vista y se evaluó de acuerdo con los siguientes criterios, y se expresó (en 4 niveles de 0 a 3 donde la gravedad de la enfermedad en las plantas no tratadas fue de 3).

Gravedad de la enfermedad:

- 60
- 0: Ausencia de síntomas.
 - 1: Amarilleamiento.
 - 2: Marchitez.
 - 3: Podredumbre.

65 De acuerdo con los resultados de los ensayos, la severidad de la enfermedad fue 0, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 o 3-135.

Ejemplo 5

Ensayo de tratamiento de semillas (fusariosis del pepino)

5 10 g de semillas humedecidas (semillas inoculadas con fusariosis del pepino) de plantas de ensayo (Sagamihanpaku) se revistieron con los polvos humedecibles que contenían el compuesto de la presente invención de forma que la tasa de aplicación fuera de 0,1 % a.i. Las semillas (10 granos) tratadas por el método anterior se sembraron, y se observó la gravedad de la enfermedad después de 3 semanas. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado.

10 Aquí, la gravedad de la enfermedad de las plantas de ensayo se observó a simple vista y se evaluó de acuerdo con los siguientes criterios, y se expresó (en 4 niveles de 0 a 3 donde la gravedad de la enfermedad en las plantas no tratadas fue de 3).

15 Gravedad de la enfermedad:

0: Ausencia de síntomas.

1: Amarilleamiento.

2: Marchitez.

20 3: Muerte.

De acuerdo con los resultados de los ensayos, la severidad de la enfermedad fue 0, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 o 3-135.

25 Ejemplo 6

Ensayo de tratamiento de semillas (fusariosis del pepino)

30 10 g de semillas humedecidas de plantas de ensayo (cultivares de pepino: Sagamihanpaku) se revistieron con los polvos humedecibles que contenían el compuesto de la presente invención de forma que la tasa de aplicación fuera de 0,1 % a.i. Las semillas (10 granos) tratadas por el método anterior se sembraron en un suelo inoculado con la fusariosis del pepino (1×10^5 esporas), y se observó la gravedad de la enfermedad después de 3 semanas. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado.

35 Aquí, la gravedad de la enfermedad de las plantas de ensayo se observó a simple vista y se evaluó de acuerdo con los siguientes criterios, y se expresó (en 4 niveles de 0 a 3 donde la gravedad de la enfermedad en las plantas no tratadas fue de 3).

Gravedad de la enfermedad:

40 0: Ausencia de síntomas.

1: Amarilleamiento.

2: Marchitez.

3: Muerte.

45 De acuerdo con los resultados de los ensayos, la severidad de la enfermedad fue 0, cuando se utilizaron los compuestos entre los Compuestos de nº 1-866, 1-918, 1-919, 1-929, 1-930, 2-100, 2-135, 3-100 o 3-135.

Ejemplo 7.

50 Ensayo de tratamiento de semillas (podredumbre del pepino)

10 g de semillas humedecidas de plantas de ensayo (Sagamihanpaku) se revistieron con los polvos humedecibles que contenían el compuesto de la presente invención de forma que la tasa de aplicación fuera de 0,1 % a.i. Las semillas (10 granos) tratadas por el método anterior se sembraron en un suelo inoculado con el hongo de la podredumbre del pepino (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium megalo-cantham*), y se observó la gravedad de la enfermedad después de 2 semanas. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado.

Ejemplo 8

60 Ensayo de tratamiento de semillas 2 (podredumbre del pepino)

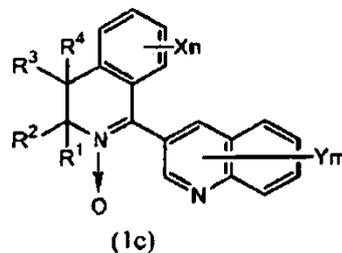
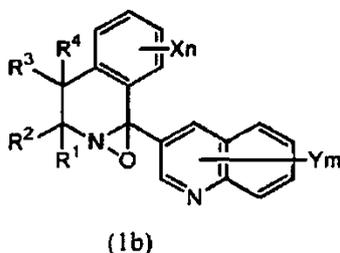
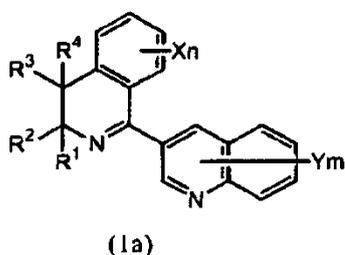
10 g de semillas humedecidas de plantas de ensayo (Sagamihanpaku) se revistieron con los polvos humedecibles que contenían el compuesto de la presente invención de forma que la tasa de aplicación fuera de 0,1 % a.i. Las semillas (10 granos) tratadas por el método anterior se sembraron en un suelo inoculado con el hongo de la podredumbre del pepino (*Rhizoctonia solani*), y se observó la gravedad de la enfermedad después de 2 semanas. Los ensayos se llevaron a cabo por duplicado.

Aplicabilidad industrial

Los compuestos de la presente invención se pueden utilizar como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de semillas, y son superiores como agente de tratamiento del suelo o como agente de tratamiento de
5 semillas, ya que muestran efectos sorprendentes contra varios patógenos de las plantas, especialmente contra plagas de arroz sin causar daños a las plantas hospedadoras.
Las enfermedades de las plantas contra las que los compuestos de la presente invención demuestran efectos
excelentes son, por ejemplo, plagas del arroz, enfermedad bakanae en los cultivos de arroz, fusariosis del trigo y
10 plaga de las semillas de trigo, plaga de las semillas por Rhizoctonia y podredumbre inducida por Pythium en el pepino, fusariosis del pepino, podredumbre inducida por Pythium en el tomate, pero el espectro fúngico de los compuestos de la presente invención no está limitada a los citados.

REIVINDICACIONES

1. Uso de un compuesto de la fórmula general (Ia), (Ib) o (Ic):



5

donde

R¹ y R² son un grupo alquilo C₁-C₆ que puede estar sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno iguales o diferentes; o un grupo fenilo que puede estar sustituido con de 1 a 5 átomos de halógeno iguales o diferentes,

R³ y R⁴ son un átomo de hidrógeno, grupo metilo, grupo etilo, átomo del flúor o átomo de cloro,

10

X es un átomo de halógeno; un grupo alquilo C₁-C₄; o un grupo ciano; y n es un número entero de 0 a 2, e

Y es un átomo del flúor, átomo de cloro o grupo metilo, y m es 0 o 1,

o una sal de los mismos

como agente de tratamiento del suelo, o como agente de tratamiento para las semillas.

15 2. El uso de acuerdo con la reivindicación 1, donde con respecto a los compuestos de la fórmula general (Ia), (Ib) o (Ic),

R¹ y R² son un grupo metilo, grupo etilo, grupo propilo, un grupo trifluorometilo, un grupo trifluoroetilo, un grupo fenilo, un grupo fluorofenilo o un grupo clorofenilo,

R³ y R⁴ son un átomo de hidrógeno, grupo metilo o átomo de flúor,

20

X es un átomo de flúor, átomo de cloro, átomo de bromo, grupo metilo, o ciano, y n es 0 o 1, e

Y es un grupo metilo, y m es 0 o 1.

25 3. El uso de acuerdo con la reivindicación 1, donde el compuesto de la fórmula general (Ia), (Ib) o (Ic) se ha seleccionado del grupo que consiste en:

25

3-(5-fluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(5-cloro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(5-bromo-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

30

3-(5, 6-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(5-fluoro-3-metil-3-propil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(3-metil-3-trifluorometil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-[3-metil-3-(2,2,2-trifluoroetil)-3,4-dihidroisoquinolin-1-il] quinolina,

3-[3-metil-3-(4-fluorofenil)-3,4-dihidroisoquinolin-1-il] quinolina,

3-(3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

35

3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

8-fluoro-3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)-8-metilquinolina,

3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

40

3,3,4,4-tetrametil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,

5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,

4,4-difluoro-3,3-dimetil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,

4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-8b-quinolin-3-il-4, 8b-dihidro-3H-oxazireno [3, 2-a] isoquinolina,

3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

45

3-(6-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina,

3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina, y

3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-2-oxido-3,4-dihidroisoquinolin-1-il) quinolina.

50 4. Un método para prevenir enfermedades en las plantas mediante el uso de un agente de tratamiento del suelo (una composición para prevenir enfermedades en las plantas **caracterizada por** tratar el suelo) o mediante el uso de un agente de tratamiento para semillas (una composición para prevenir enfermedades en las plantas **caracterizada por** tratar las semillas), que comprende uno o más compuestos definidos en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3.